

CHARAKTERYSTKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

ULGASTRAN 1 g tabletki

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Jedna tabletki zawiera 1 g sukralfatu (*Sucralfatum*)

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletki.

Opis tabletek:

Tabletki barwy prawie białej do białej, okrągłe, obustronnie płaskie, średnica tabletki 16 mm.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Choroba wrzodowa żołądka i dwunastnicy.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dorośli: 1 g (1 tabletki) 4 razy na dobę (co 6 godzin), na 0.5 - 1 godz. przed każdym posiłkiem i bezpośrednio przed snem. Lek należy popijać dużą ilością wody. Leczenie kontynuować przez 4 do 6 tygodni. Maksymalna dawka dobową leku wynosi 8 g (8 tabletek).

4.3 Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na substancję czynną lub na którąkolwiek substancję pomocniczą.

Nie należy stosować długotrwale u pacjentów z ciężką niewydolnością nerek, mocznicą lub hipofosfatemią oraz u pacjentów poddawanych dializoterapii.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Należy zachować szczególną ostrożność podczas stosowania sukralfatu u pacjentów z niewydolnością nerek. U pacjentów z niewydolnością nerek dochodzi do zmniejszenia wydalania glinu przez nerki. Glin słabo przenika przez błony dializacyjne ze względu na wiązanie z albuminami osocza. U pacjentów poddawanych dializoterapii lek stosować tylko w przypadku bezwzględnej konieczności i przez krótki okres czasu. Należy wówczas kontrolować stężenie glinu i fosforanów w surowicy oraz ocenić po zakończeniu terapii, czy nie występują objawy kumulacji glinu (osteodystrofia, osteomalacja, encefalopatia).

Leki zobojętniające kwas solny należy stosować 30 min przed podaniem lub po podaniu sukralfatu.

Nie zaleca się jednoczesnego stosowania innych preparatów zawierających glin ze względu na możliwość zwiększonego wchłaniania glinu i możliwość działania toksycznego.

4.5 Interakcje z innymi lekami i inne rodzaje interakcji

Na etapie wchłaniania może dochodzić do interakcji sukralfatu z pokarmem. Ze względu na możliwość wiązania się sukralfatu z białkami pokarmowymi oraz zwiększania biodostępności indukowanej pokarmem zaleca się podawanie sukralfatu na 1 godzinę przed posiłkiem lub 2 godziny po posiłku.

Na podstawie licznych badań stwierdzono, że sukralfat podawany równocześnie z innymi lekami stosowanymi doustnie może opóźniać lub zmniejszać ich wchłanianie (interakcja farmakokinetyczna, etap biodostępności) poprzez tworzenie fizycznej bariery w przewodzie pokarmowym lub poprzez chelatowanie leków. Dotyczy to w szczególności następujących grup leków:

- chemioterapeutyków z grupy chinolonów;
- tetracyklin;
- leków przeciwgrzybiczych;

- blokerów receptorów histaminowych H₂;
- leków przeciwzakrzepowych pochodnych kumaryny;
- niesteroidowych leków przeciwzapalnych;
- fosforanów;
- glikozydów nasercowych;
- fenytoiny;
- teofiliny.

Leki zobojętniające (z grupy *antacida*) zwiększając pH soku żołądkowego zmniejszają skuteczność sukralfatu.

Sukralfat w środowisku kwaśnym soku żołądkowego uwalnia jony glinu, dlatego należy zwracać uwagę na możliwość zachodzenia interakcji jonów glinu także z innymi grupami leków:

- leki przeciwwirusowe, np. inhibitory proteazy;
- inhibitory ACE;
- beta-blokery;
- leki przeciwcukrzycowe;
- leki immunosupresyjne;
- leki przeciwpsychotyczne;
- pochodne benzodiazepiny;
- kortykosteroidy doustne;
- sole żelaza.

Zaleca się, aby stosować odstęp czasowy pomiędzy podawaniem sukralfatu i innych leków. Podawanie innych leków 2 godziny przed sukralfatem eliminuje występowanie szeregu interakcji.

4.6 Ciąża i laktacja

Brak jest wystarczających danych dotyczących stosowania sukralfatu u kobiet w ciąży.

Badania na zwierzętach dotyczące wpływu na przebieg ciąży, rozwój zarodka i płodu, przebieg porodu i (lub) rozwój pourodzeniowy są niewystarczające (patrz 5.3). Potencjalne zagrożenie dla człowieka nie jest znane.

Produktu ULGASTRAN nie należy stosować w okresie ciąży, jeśli nie jest to bezwzględnie konieczne.

Kobiety karmiące piersią nie powinny stosować produktu ULGASTRAN.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu

Produkt ULGASTRAN nie powoduje upośledzenia sprawności psychofizycznej, zdolności prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu.

4.8 Działania niepożądane

Działania niepożądane po zastosowaniu sukralfatu mają niewielkie nasilenie i rzadko są przyczyną przerwania terapii.

Częstość możliwych działań niepożądanych opisano według następujących kryteriów: bardzo często: ($\geq 1/10$); często: ($\geq 1/100$ do $< 1/10$); niezbyt często: ($\geq 1/1,000$ do $< 1/100$); rzadko: ($\geq 1/10,000$ do $< 1/1,000$). Każde zdarzenie zostało opisane według częstości występowania oraz według ciężkości.

<i>często:</i>	zaparcia
<i>niezbyt często:</i>	ból głowy, nudności, wymioty, biegunka wzrost stężenia glinu i wapnia zjonizowanego oraz spadek stężenia fosforu organicznego w surowicy
<i>rzadko:</i>	zawroty głowy, bezsenność, nadmierna senność, nieżyt błony śluzowej nosa, niestrawność, wzdęcia, suchość w ustach, zapalenie krtani osteopenia, osteoporoza obrzęk twarzy, świąd, wysypka hepatotoksyczność toksyczne uszkodzenie nerek

4.9 Przedawkowanie

Objawy charakterystyczne dla przedawkowania sukralfatu nie są znane.

Badania na zwierzętach, dotyczące toksyczności ostrej wykazały brak efektu toksycznego przy zastosowaniu dawek 12 g/kg masy ciała. Sukralfat jest tylko w minimalnych ilościach wchłaniany do krwi. W razie przyjęcia dużych dawek leku w okresie do 2 godzin od zażycia można rozważyć płukanie żołądka.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: inne leki stosowane w chorobie wrzodowej i refluksowej; kod ATC: A02BX02

Sukralfat jest kompleksowym związkiem wodorotlenku glinu i siarczanu sacharozy (zasadowa sól glinowa ośmiosiarczanu sacharozy). Związek ten należy do leków osłonowych, stosowanych w leczeniu choroby wrzodowej, które nie mają ani działania zobojętniającego, ani nie hamują sekrecji żołądkowej. W środowisku kwaśnym sukralfat staje się wysoce polarny i wiąże się z tkankami dna owrzodzenia na około 12 godzin, przy stosunkowo niewielkim wiązaniu z prawidłową błoną śluzową żołądka i dwunastnicy. W obecności kwasu solnego wiąże się z dodatnio naładowanymi grupami glikoprotein. Może tworzyć kompleksowe połączenie o charakterze żelu z cząsteczkami śluzu, co ma zapobiegać enzymatycznemu rozkładowi tego ostatniego przez pepsynę. Uważa się, że jego przyleganie do ziarniny uniemożliwia dyfuzję jonów wodorowych do dna owrzodzenia. Ponadto, wiąże sole kwasów żółciowych oraz pepsynę i w ten sposób ogranicza ich działanie uszkodzające. Sukralfat zwiększa tkankowe stężenie endogennych prostaglandyn i łączy się z naskórkowym czynnikiem wzrostu oraz innymi czynnikami wzrostowymi, angażując je w miejscową reakcję obrony śluzówkowej. Jego skuteczność w gojeniu owrzodzeń i zapobieganiu nawrotom choroby wrzodowej jest podobna do leków z grupy *antacida* (alkaliów) i antagonistów receptora H₂. W obecności kwasu solnego polimery cząsteczek leku tworzą lepką pastę powlekającą ściany żołądka; jeszcze po 3 godzinach od podania w żołądku znajduje się około 3% podanej dawki. Nie wpływa

na czas opróżniania żołądka, ani na trawienie. Nie wykazano działania sukralfatu na układ sercowo-naczyniowy, ani na ośrodkowy układ nerwowy.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Po podaniu doustnym sukralfat w niewielkim stopniu (od 2 do 5%) jest wchłaniany z przewodu pokarmowego. Sukralfat ulega w żołądku częściowej dysocjacji (około 10%) do $\text{Al}(\text{OH})_3$ oraz ośmiosiarczanu sacharozy. Uwalniane jony glinu ulegają związaniu z fosforanami oraz innymi anionami w żołądku oraz jelicie do nierozpuszczalnych i słabo ulegających absorpcji związków lub do związków rozpuszczalnych, lecz w małym stopniu przyswajalnych. Wchłanianie jonów glinu wynosi od 0,1 do 10%. U pacjentów stosujących długotrwałą terapię z zastosowaniem sukralfatu oznaczono średnio 8,41 mg jonów glinu/l i nie stwierdzono statystycznie istotnej różnicy w porównaniu z grupą stosującą placebo.

Na etapie wchłaniania może dochodzić do interakcji sukralfatu z pokarmem. Ze względu na możliwość wiązania się sukralfatu z białkami pokarmowymi oraz zwiększania biodostępności indukowanej pokarmem zaleca się podawanie sukralfatu na 1 godzinę przed posiłkiem lub 2 godziny po posiłku.

Celem terapii z zastosowaniem sukralfatu jest wywieranie działania w obrębie błony śluzowej żołądka i dwunastnicy. Ze względu na niewielkie wchłanianie największe stężenie jonów glinu jest w żołądku i dwunastnicy. Przy prawidłowej czynności nerek głównym kompartmentem dla sukralfatu jest światło przewodu pokarmowego.

Sukralfat w obecności kwasu solnego w żołądku uwalnia jony glinowe, które wiążą się z dodatnio naładowanymi grupami białek błony śluzowej. Siarczan sacharozy powstały pod wpływem kwasu solnego nie jest metabolizowany i jest wydalany w postaci niezmienionej wraz z kałem w ciągu 48 godzin (ponad 90% przyjętej dawki).

Wydalenie sukralfatu następuje głównie przez przewód pokarmowy, zaledwie 0,5 - 2,2 % jest wydalane przez nerki z moczem.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Nie stwierdzono rakotwórczego działania w badaniach przeprowadzonych na myszach, szczurach i królikach, którym podawano sukralfat w dawkach do 1 mg/kg na dobę (dawka 12 razy większa od dawki stosowanej u ludzi) przez 2 lata. W badaniach na zwierzętach nie stwierdzono również zmniejszenia płodności ani efektów embriotoksycznych. Badań oceniających mutagenność nie prowadzono.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Celuloza mikrokrystaliczna
Krzemionka koloidalna bezwodna
Magnezu stearynian
Powidon K-30

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

3 lata

6.4 Specjalne środki ostrożności przy przechowywaniu

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C .

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Blistry z foli AL/PCV w tekturowym pudełku.
50 tabletek (5 blistrów po 10 szt.)

6.6 Szczególne środki ostrożności dotyczące usuwania

Brak szczególnych wymagań

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

GEDEON RICHTER POLSKA Sp. z o.o.

ul. ks. J. Poniatowskiego 5

05 - 825 Grodzisk Mazowiecki

8. NUMERY POZWOLEŃ NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Cert. Rej. MZ i OS nr 3891

Pozwolenie nr R/2236

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU / DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

29.12.1992 r.

14.06.1999 r.

11.03.2004 r.

12.08.2004 r.

10.06.2005 r.

07.08.2008 r.

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO

07.08.2008 r.

24.05.2010 r.

24 MAJ 2010

Gedeon Richter Polska Sp. z o.o.
05-825 Grodzisk Mazowiecki
ul. Ks. J. Poniatowskiego 5
NIP: 529-16-56-994
REGON: 015228616
- 10 -