

CHARAKTERYSTKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

ULGASTRAN 1 g/5 ml zawiesina doustna

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

5 ml zawiesiny zawiera 1 g sukralfatu (*Sucralfatum*)

Substancje pomocnicze: metylu parahydroksybenzoesan (0,1 g/100 g), propylu parahydroksybenzoesan (0,05 g/100 g), sorbitol (1,5 g/100 g).

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Zawiesina doustna

Zawiesina barwy białej, o zapachu cytrynowo-waniliowym. Zawiesina może lekko sedymentować ale po wstrząśnięciu butelki powraca do stanu jednorodnego rozproszenia.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Choroba wrzodowa żołądka i dwunastnicy.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Produkt przeznaczony do stosowania doustnego.

Dorośli: 1 g (1 łyżeczka) 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 łyżeczek).

Wstrząsnąć przed użyciem.

Dawkowanie u pacjentów z niewydolnością nerek

U pacjentów z niewydolnością nerek produkt Ulgastran należy stosować ostrożnie (patrz punkt 4.3 i 4.4).

Dawkowanie u pacjentów w podeszłym wieku

Dostosowanie dawkowania nie jest konieczne.

Dawkowanie u dzieci i młodzieży w wieku poniżej 18 lat

Nie ma doświadczenia dotyczącego stosowania u dzieci.

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.

Substancje pomocnicze biologicznie czynne

Ulgastran zawiera sorbitol. Nie stosować u pacjentów z rzadko występującą dziedziczną nietolerancją fruktozy.

Ulgastran zawiera parahydroksybenzoesany. Produkt może powodować reakcje alergiczne (możliwe reakcje typu późnego).

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 H_2 ;
- 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

Ulgastran nie ma wpływu na zdolność 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.

Każde zdarzenie zostało opisane według częstości występowania.

Częstość występowania działań niepożądanych podano zgodnie z następującą klasyfikacją:

Często ($\geq 1/100$ do $< 1/10$)

Niezbyt często ($\geq 1/1\ 000$ do $< 1/100$)

Rzadko ($\geq 1/10\ 000$ do $< 1/1\ 000$)

W obrębie każdej grupy o określonej częstości występowania objawy niepożądane są wymienione zgodnie ze zmniejszającym się nasileniem.

często	zaparcia
niezbyt często	biegunka, wymioty, nudności, ból głowy, wzrost stężenia glinu i wapnia zjonizowanego oraz spadek stężenia fosforu organicznego w surowicy
rzadko	zawroty głowy, bezsenność, nadmierna senność, niestrawność, wzdęcia, suchość w ustach, zapalenie krtani, nieżyt błony śluzowej nosa, osteoporoza, osteopenia, 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 ośmiosisarczanu 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 H_2 . 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 $Al(OH)_3$ oraz ośmiosisarczanu sacharozy. Uwalniane jony glinu ulegają wiązaniu 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).

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

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Dane niekliniczne, uzyskane na podstawie konwencjonalnych badań farmakologicznych dotyczących bezpieczeństwa stosowania, toksyczności po podaniu wielokrotnym, genotoksyczności, potencjalnego

działania rakotwórczego i toksycznego wpływu na reprodukcję, nie ujawniają występowania szczególnego zagrożenia dla człowieka.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Hypromeloza
30% emulsja symetykonu
Metylu parahydroksybenzoesan
Propylu parahydroksybenzoesan
Glicerol
Sorbitol
Sacharyna sodowa
Kwas cytrynowy
Wanilina
Olejek cytrynowy
Woda oczyszczona

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

2 lata

6.4 Specjalne środki ostrożności przy przechowywaniu

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Butelka z oranżowego szkła w tekturowym pudełku.
250 ml w butelce.

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
tel.: (22) 755 50 81

8. NUMERY POZWOLEŃ NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Cert. Rej. MZ i OS nr 3892
Pozwolenie nr R/1646

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

29.12.1992 r.
24.05.1999 r.
11.03.2004 r.
06.09.2004 r.
14.06.2005 r.
13.08.2008 r.

**10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU
CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO**

13.08.2008 r.
24.05.2010 r.

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