

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

МЕДИЦИНЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА
Код на лекарството за продукта - Пазарен код
20000138
BG/MKMK-59953
05-07-2022

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Бизалакс 5 mg стомашно-устойчиви таблетки
Bisalax 5 mg gastro-resistant tablets

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка стомашно-устойчива таблетка съдържа 5 mg бизакодил (bisacodyl).

Помощни вещества с известно действие:

Всяка стомашно-устойчива таблетка съдържа 49 mg лактоза монохидрат и 40 mg пшенично нишесте.

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Стомашно-устойчиви таблетки

Жълти, кръгли, двойноизпъкнали филмирани таблетки

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Продуктът се прилага:

- за краткосрочно лечение на констипация;
- при подготовка за диагностични процедури, при пред- и постоперативно лечение и при необходимост от улесняване на дефекацията (при хемороиди, анални фистули и рагади).

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Констипация

Възрастни

1-2 таблетки (5-10 mg) дневно.

Педиатрична популация

Деца от 4 до 10 години: 1 таблетка (5 mg) дневно.

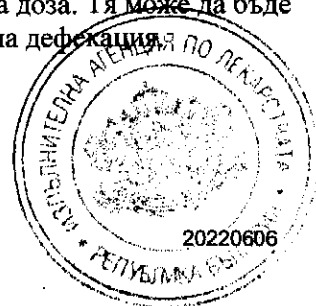
Деца над 10 години: 1-2 таблетки (5-10 mg) дневно.

При деца на възраст под 10 години, продуктът се прилага по лекарско предписание.

При деца се препоръчва комбинирано приложение със супозитории, съдържащи бизакодил.

Препоръчва се лечението при деца и възрастни да започне с най-ниската доза. Тя може да бъде повишена до максималната препоръчителна за предизвикване на редовна дефекация.

Максималната дневна доза не трябва да се превишава.



При подготовка за диагностични процедури и преди операция

При подготовка за диагностични процедури, при пред- и постоперативно лечение, както и при състояния, при които се изисква улесняване на дефекацията, приложението на бизакодил трябва да се осъществява под лекарско наблюдение.

Възрастни

За предизвикване на пълно изпразване на червата препоръчителната доза е 2 таблетки (10 mg) сутрин и 2 таблетки (10 mg) вечер преди лягане и прилагане на лаксатив с незабавно действие (напр. супозитория) на следващата сутрин.

Педиатрична популация

За деца на 4 и повече години препоръчителната доза е 1 таблетка (5 mg) вечер преди лягане и прилагане на лаксатив с незабавно действие (напр. супозитория за деца) на следващата сутрин.

Начин на приложение

Перорално приложение

Препоръчва се таблетките да се приемат вечер, преди лягане, за да се предизвика дефекация на следващата сутрин. Те трябва да се поглъщат цели, с достатъчно количество течност.

Таблетките не трябва да се приемат заедно с продукти, които намаляват киселинността на горните отдели на стомашно-чревния тракт, като мляко, антиациди или инхибитори на протонната помпа, за да не се разтвори преждевременно стомашно-устойчивата обвивка.

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активното вещество или към някои от помощните вещества, изброени в точка 6.1.
- Илеус, чревна непроходимост, остър хирургичен корем, като апендицит, остър ентерит и остра коремна болка, придружена от гадене и повръщане, което може да е показателно за по-тежки състояния.
- Тежка дехидратация:
- Деца на възраст под 4 години.
- Редки наследствени заболявания, при които някои от помощните вещества са противопоказани (вж. точка 4.4).

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Както всички лаксативи, така и бизакодил не трябва да се приема ежедневно или за продължителен период от време, без да се установи причината за констипацията.

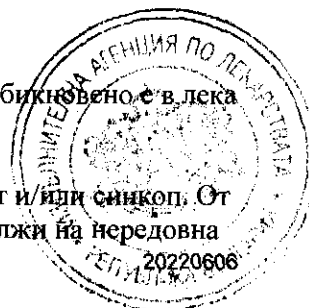
Продължителната употреба във високи дози може да доведе до водно-електролитен дисбаланс и хипокалиемия.

Загубата на течности през стомашно-чревния тракт може да доведе до дехидратация, която се проявява със симптоми като жажда и олигурия. При пациенти с обезводняване, при които дехидратацията може да бъде опасна (напр. пациенти с бъбречна недостатъчност или пациенти в старческа възраст) употребата на бизакодил трябва да се преустанови, като лечението може да се възобнови само под лекарско наблюдение.

Лаксативите не помагат за отслабване.

Пациентите могат да получат хематокезия (кръв в изпражненията), която обикновено е в лека форма и отзвучава спонтанно.

При пациенти, които приемат бизакодил се съобщава за поява на замаяност и/или синкоп. От наличните данни за тези случаи се предполага, че синкопът вероятно се дължи на нередовна



или затруднена дефекация или е вазовагална реакция на коремната болка вследствие на запека и не е свързан непременно с приложението на самия бизакодил.

Бизалакс не трябва да се приема от деца на възраст под 10 години без назначение от лекар.

Помощни вещества:

Пшенично нишесте

Пшеничното нишесте в този лекарствен продукт съдържа съвсем малки количества глютен (счита се че не съдържа глютен) и е много малко вероятно да предизвика проблеми при пациенти с цьолиакия. Една таблетка съдържа не повече от 4 микрограма глютен. Пациенти с алергия към пшеница (различна от цьолиакия) не трябва да приемат този лекарствен продукт.

Лактоза

Пациенти с редки наследствени проблеми на непоносимост към галактоза, пълнен лактазен дефицит или глюкозо-галактозна малабсорбция не трябва да приемат това лекарство.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

При едновременната употреба на бизакодил във високи дози заедно с диуретици и/или адрено-кортикостероиди може да се повиши рискът от електролитен дисбаланс.

Електролитният дисбаланс може да доведе до повишена чувствителност към сърдечни гликозиди.

Едновременната употреба с други лаксативи може да засили гастроинтестиналните странични реакции на бизакодил.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Няма достатъчно и добре контролирани проучвания при бременни жени. При приложение по време на бременност от продължителните наблюдения няма данни за нежелани или увреждащи ефекти по време на бременността.

Независимо от това, както при всички лекарствени продукти, бизакодил трябва да се приема по време на бременност само по лекарско предписание.

Кърмене

Клиничните данни показват, че както активната част на бизакодил (ВНРМ или бис-(p-хидроксифенил)-пиридил-2-метан), така и неговите глюкурониди не се екскретират в кърмата на здрави кърмещи жени.

Бизалакс може да се приема по време на кърмене.

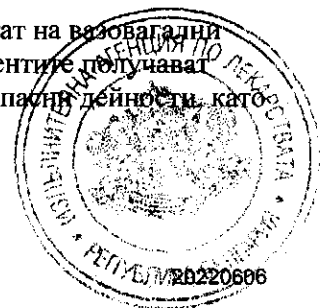
Фертилитет

Не са провеждани проучвания относно ефекта на бизакодил върху фертилитета при хора.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Не са провеждани проучвания за ефектите на бизакодил върху способността за шофиране и работата с машини.

Въпреки това, пациентите трябва да бъдат предупреждавани, че в резултат на вазовагални реакции (колики) могат да възникнат замаяност и/или синкоп. Ако пациентите получават стомашни колики, те трябва да избягват извършването на потенциално опасни дейности, като шофиране и работа с машини.



4.8 Нежелани лекарствени реакции

Най-честите нежелани реакции, за които се съобщава по време на лечението са абдоминална болка и диария.

Нежеланите реакции са класирани по честота, като се използва следната конвенция: много чести ($\geq 1/10$), чести ($\geq 1/100$, $<1/10$), нечести ($\geq 1/1\ 000$, $<1/100$), редки ($\geq 1/10\ 000$, $<1/1\ 000$), много редки ($<1/10\ 000$), с неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка).

Нарушения на имунната система

Редки: свръхчувствителност
С неизвестна честота: ангиоедем*, анафилактични реакции*

Нарушения на метаболизма и храненето

С неизвестна честота: дехидратация*

Нарушения на нервната система

Нечести: замаяност
Редки: синкоп

Замаяността и синкопът, възникващи след приемането на бизакодил, изглежда са свързани с вазовагалния отговор (напр. абдоминални спазми, дефекация).

Стомашно-чревни нарушения

Чести: коремни спазми, болки в корема, диария, гадене
Нечести: абдоминален дискомфорт, повръщане, хематохезия, аноректален дискомфорт

С неизвестна честота: колит*, вкл. исхемичен колит*

Продължителното приложение на високи дози може да доведе до функционална атония на колона.

*Нежеланата реакция не е наблюдавана в никое от избраните клинични изпитвания на бизакодил. Оценяването е базирано на горната граница на 95% доверителния интервал, изчислен от общия брой лекувани пациенти съгласно европейските препоръки за кратката характеристика на продукта (3/3056, което се отнася за редки).

Съобщаване на подозирани нежелани реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез Изпълнителна агенция по лекарствата, ул. „Даян Груев“ № 8, 1303 София, тел.: 02 8903417, уебсайт: www.bda.bg.

4.9 Предозиране

Симптоми

Приемът на много високи дози може да предизвика диария, коремни спазми, клинично значима загуба на течности, калий и други електролити, включително симптоми на хипокалиемия и функционална атония на колона.

Хроничното предозиране с лаксативи, вкл. и бизакодил, може да предизвика хронична диария, коремни болки, хипокалиемия, вторичен хипералдостеронизъм, бъбречнокаменна болест. Има описани случаи на увреждане на бъбречните тубули, метаболитна алкалоза и мускулна слабост вследствие на хипокалиемията при клинично предозиране.



Лечение

Стомашен лаваж, предизвикване на повръщане, корекция на водно-електролитния дисбаланс, прилагане на симптоматични средства. Това е особено важно при деца и пациенти в старческа възраст.

В някои случаи може да се наложи приложението на спазмолитици.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: контактни лаксативни средства, АТС код: А06АВ02

Бизакодил е локално действащо лаксативно средство от дифенилметановата група. Принадлежи към групата на контактните лаксативни средства, действащи директно върху нервните окончания на чревната мукоза, основно в колона. Резорбира се в незначителна степен в гастроинтестиналния тракт, където се хидролизира до бис-(пара-хидроксифенил)-пиридил-2-метан (ВНМР), посредством ензими, отделящи се от мукозата на колона. ВНМР стимулира перисталтиката и кумулирането на течности и електролити в чревния лумен. Това води до улесняване на дефекацията, намаляване на времето на пасажа и омекотяване на изпражненията.

Като слабително средство, което проявява терапевтичното си действие върху дебелото черво, бизакодил стимулира по специфичен естествен процес на изпраждане на долната част на гастроинтестиналния тракт. Ето защо бизакодил не оказва влияние върху храносмилането, както и върху абсорбцията на калории и съществено необходими хранителни вещества в тънкото черво.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция и биотрансформация

След перорално приложение бизакодил бързо се хидролизира до активното съединение бис-(пара-хидроксифенил)-пиридил-2-метан (ВНМР), основно от естерази на чревната мукоза. При приемане на стомашно-устойчиви таблетки максималната плазмена концентрация на ВНМР се достига между 4-10 часа след приложение; лаксативният ефект се проявява между 6-12 часа след приложение. ВНМР действа локално в долния отдел на стомашно-чревния тракт и не съществува зависимост между лаксативния ефект и плазмените концентрации на активното съединение. По тази причина таблетките бизакодил са направени така, че да бъдат устойчиви на стомашен сок и чревно съдържимо. Това води до освобождаване на активното вещество основно в дебелото черво, което е желаното място на действие.

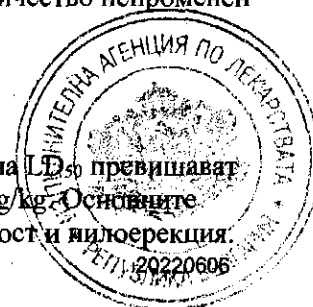
ВНМР се резорбира в незначителна степен (системна бионаличност след перорално приложение <5%), конюгира се в чревната стена и черния дроб, и циркулира в кръвообращението като неактивен ВНМР глюкуронид.

Елиминиране

Плазменият полуживот на елиминиране на ВНМР глюкуронида е изчислен приблизително на 16,4 часа. След приложение на стомашно-устойчивите таблетки средно 51,8% от дозата се открива във фецеса като свободен ВНМР и средно 10,5% от дозата се открива в урината като ВНМР глюкуронид. Екскретира се чрез жлъчката и урината, основно чрез фекалиите. Фецесът съдържа голямо количество ВНМР (90% от общата екскреция) и малко количество непроменен бизакодил.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Бизакодил е вещество с ниска остра токсичност. При гризачи стойностите на LD_{50} превишават дозови нива от 2 g/kg. При кучета се наблюдава дозова толерантност до 15 g/kg. Основните клинични прояви на интоксикацията са: диария, понижена моторна активност и милоерекция.



Резултатите от проведени токсикологични изследвания при многократно приложение на бизакодил (до 26 седмици) при плъхове, морски свинчета и маймуни показват наличие на тежка дозозависима диария (с изключение на морските свинчета). Не е наблюдавана значима дозозависима нефротоксичност. Счита се, че наблюдаваните морфологични промени на пикочния мехур при плъхове, третирани 32 седмици, не са причинени от бизакодил, а се отнасят до вторично образуване на микрокалкули, най-вероятно в резултат на електролитен дисбаланс, и следователно нямат биологична значимост при хора.

Тестовете за мутагенност при бактерии и бозайници не показват генотоксичен потенциал на бизакодил. Освен това бизакодил не предизвиква значителни завишения в морфологичната трансформация при ембрионални клетки от хамстер/SHE. Тестовете за мутагенност не показват индикация за наличие на мутагенен потенциал.

Не са провеждани конвенционални проучвания за карциногенност на бизакодил. Предвид терапевтичното му сходство с фенолфталеин, бизакодил е изследван в p53 трансгенетичен модел на мишки за 26 седмици. Не се наблюдава свързана с приема неоплазия при перорални дози до 8000 mg/kg дневно при мишки.

Няма данни за ембриотоксичност при проведени изследвания върху ембрионални клетки на хамстери. Не са наблюдавани тератогенни ефекти при плъхове и зайци (FDA Pregnancy Risk Category B) при дози до 1 000 mg/kg ден, които надвишават максималната препоръчителна дневна доза при хора (изчислена за mg/m²) най-малко с 800 пъти. Токсичност при майката и ембрионална токсичност се наблюдават при плъхове при дози 80 пъти по-високи от максималната препоръчителна дневна доза при хора.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Лактоза монохидрат
Пшенично нишесте
Колоиден, безводен силициев диоксид
Магнезиев стеарат
Желатин
Филмово покритие
Съполимер на метакрилова киселина - етилакрилат (1:1)
Талк
Титанов диоксид
Макрогол 6000
Хинолиново жълто 70 (E 104)

6.2 Несъвместимости

Неприложимо

6.3 Срок на годност

3 години

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 25°C.



6.5 Вид и съдържание на опаковката

Картонена опаковка, съдържаща 30 стомашно-устойчиви таблетки.
Блистер от PVC/алуминиево фолио, съдържащ 10 таблетки (3 блистера в картонена кутия) или 30 таблетки (1 блистер в картонена кутия).

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Тева Фарма ЕАД
ул. „Люба Величкова“ № 9, гр. София 1407
България

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Рег. № 20000138

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Дата на първо разрешаване: 29.03.1968 г.
Дата на последно подновяване: 15.12.2010 г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

