

## **КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА**

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към Рег. № .....	9860198
Разрешение № .....	86/М/1747-б-60508
Соф. датене № .....	11-10-2022

## 1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Фенолакс 5 mg стомашно-устойчиви таблетки  
Fenolax 5 mg gastro-resistant tablets

## 2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка стомашно-устойчива таблетка съдържа бизакодил (*Bisacodyl*) 5 mg.  
Помощно вещество: лактоза моногидрат 55 mg.

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

## 3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Стомашно-устойчиви таблетки, със светлорозов цвят, с бяла линия по средата. Формата на таблетките е кръгла, двустранно изпъкнала.

## 4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

### 4.1 Терапевтични показания

Запек от различен произход.

За изпразване на червата преди диагностични изследвания и хирургическа намеса (напр. ректоскопия, холецистография, урография, рентгенова диагностика на коремната кухина, радиологични снимки на сакро-лумбалния участък на гръбначния стълб).

### 4.2 Дозировка и начин на приложение

#### Дозировка

#### При запек

Препоръчва се лечението да започне с най-ниската доза. Тя може да бъде увеличена до максималната препоръчителна доза за предизвикване на редовна дефекация. Максималната доза не трябва да се превишава.

#### Възрастни и деца над 10 години:

Перорално, 1 – 2 таблетки (5 mg – 10 mg) един път дневно (обикновено вечер).

#### Деца на възраст от 4 до 10 години:

Фенолакс не трябва да се приема без консултация с лекар.

Перорално, 1 таблетка (5 mg) един път дневно (обикновено вечер).

#### Деца под 4-годишна възраст:

Това лекарство не се препоръчва за тази възрастова група.

#### При подготовка за диагностични изследвания и хирургическа намеса

Приложението на Фенолакс трябва да се осъществява само под лекарски контрол.



**Възрастни:**

Препоръчителната дозировка е перорално 2 таблетки (10 mg) сутрин и 2 таблетки (10 mg) вечер.

**Деца на възраст над 4 години:**

Препоръчителната дозировка е 1 таблетка (5 mg) перорално вечер.

**Деца под 4-годишна възраст:**

Това лекарство не се препоръчва за тази възрастова група.

*Лица в напреднала възраст, пациенти със смущения в дейността на бъбреците или черния дроб:  
Няма необходимост от промяна на дозата.*

При овладяване на запека, след възстановяване на редовното изхождане, дозировката трябва да се намали и обикновено може да се спре.

Бизакодил се абсорбира от храносмилателния тракт в минимални количества. Дефекацията настъпва обикновено около 6 часа след пероралния прием (след 6 – 12 часа при прием преди сън).

**Начин на приложение**

Таблетките трябва да се гълтат цели (да не се лъвчат или натрошават) с голямо количество вода.

Таблетките не трябва да се приемат с продукти, които намаляват киселинността на горния стомашно-чревен тракт, като мляко, антиациди или инхибитори на протонната помпа, за да не се разтвори преждевременно стомашно-устойчивото покритие на таблетките.

**4.3 Противопоказания**

Свръхчувствителност към активното вещество или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1.

Остър хирургичен корем (вкл. чревна непроходимост, възпаление на апендицит), болест на Крон, абсцес на дебелото черво, остро възпаление на червата, остра коремна болка, придружена от гадене и повръщане, стомашно-чревно кървене, тежко обезводняване.

**4.4 Специални предупреждения и предизвънни мерки при употреба**

Както всички други лаксативи, Фенолакс не трябва да бъде употребяван всеки ден или за продължителен период от време, без да се установи причината за констипация.

Продължителното приложение на високи дози може да доведе до нарушения на електролитния баланс и хипокалиемия.

Загубата на течности в стомашно-чревния тракт може да предизвика дехидратация. Симптомите могат да включват жажда и олигурия. При пациенти със загуба на течности, при които дехидратацията може да бъде вредна (напр. с бъбречна недостатъчност, пациенти в напреднала възраст) лечението с Фенолакс трябва да се прекрати, като то може да бъде възстановено единствено под лекарски контрол.

Стомулиращите лаксативи, включително Фенолакс, не помагат при намаляване на теглото (вж. точка 5.1).



Възможно е някои пациенти да получат хематохезия (кръв в изпражненията), която обикновено е в лека форма и отшумява спонтанно.

Наблюдавани са случаи на замаяност и/или синкоп при пациенти, лекувани с бизакодил. Наличните данни за тези случаи предполагат, че тези нежелани събития са свързани с нередовна дефекация (или затруднена дефекация) или със съдово-нервна реакция към коремна болка, която е свързана с констипация и не е непременно свързана с приложението на бизакодил.

Фенолакс е под формата на стомашно-устойчиви таблетки, предпазващи стомаха от дразнещото действие на лекарството. Ето защо, таблетките трябва да се гълтат цели (да не се дъвчат или натрошават).

При деца на възраст от 4 до 10 години Фенолакс се използва само след лекарско предписание.

#### **Фенолакс съдържа лактоза**

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

#### **Фенолакс кохинил червено А (E124)**

Кохинил червено А (E124) може да причини алергични реакции.

#### **4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие**

При приемане на високи дози бизакодил едновременното приложение на диуретици или кортикоステроиди може да повиши риска от електролитен дисбаланс. Едновременната употреба с други лаксативи може да засили гастроинтестиналните странични ефекти на Фенолакс.

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

#### **4.6 Фертилитет, бременност и кърмене**

##### **Бременност**

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

Независимо от това, както при всички лекарствени продукти, Фенолакс трябва да бъде приеман по време на бременност само по лекарско предписание.

##### **Кърмене**

Клиничните данни показват, че както активната част на бизакодил ВНРМ (bis-(p-hydroxyphenyl)-pyridyl-2-methane), така и неговите глюкориниди не се екскретират в кърмата на здрави кърмещи жени.

Фенолакс може да бъде прилаган по време на кърмене.

##### **Фертилитет**

Не са провеждани изследвания относно ефекта на бизакодил върху фертилитата при човек.



#### **4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини**

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

Въпреки това е необходимо пациентите да бъдат предупреждавани, че в резултат на повлияването на съдовата инервация (колика) може да възникне замаяност и/или синкоп. В случай на колика, пациентите трябва да избягват извършването на потенциално опасни действия, като шофиране и работа с машини.

#### **4.8 Нежелани лекарствени реакции**

Най-често съобщаваните нежелани лекарствени реакции, установени по време на лечението, са коремна болка и диария.

Честотата по MedDRA конвенцията:

много чести ( $\geq 1/10$ )

чести ( $\geq 1/100$  до  $<1/10$ )

нечести ( $\geq 1/1\,000$  до  $<1/100$ )

редки ( $\geq 1/10\,000$  до  $<1/1\,000$ )

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

Замаяност и синкоп, възникващи след приемане на бизакодил, са в резултат на повлияване на съдовата инервация (напр. колика, дефекация).

##### *Стомашно-чревни нарушения*

чести: коремни спазми, коремна болка, диария, гадене

нечести: коремно неразположение, повъръщане, хематохезия (кръв в изпражненията), аноректален дискомфорт

с неизвестна честота: колит\*, включително исхемичен колит\*

\*Нежеланата реакция не е била наблюдавана в никое от избраните клинични изпитвания на бизакодил. Оценяването е базирано на горната граница на неговия 95% доверителен интервал, изчислен от общия брой лекувани пациенти съгласно европейските препоръки за кратката характеристика на продукта (3/3 056 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/рисък за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез националната система за съобщаване:



Изпълнителна агенция по лекарствата  
ул. Дамян Груев № 8  
1303, гр. София  
Р. България  
Тел.: +359 2 8903 417  
Уебсайт: www.bda.bg

#### 4.9 Предозиране

##### Симптоми

При приемане на високи дози могат да се наблюдават водни изпражнения (диария), коремни спазми и клинично значима загуба на течност, калий и други електролити.

Хроничното предозиране с бизакодил, както при всички лекарствени продукти, може да предизвика хронична диария, коремни болки, хипокалиемия, вторичен хипералдостеронизъм и бъбреинокаменна болест. Случаи на увреждане на бъбрените тубули, метаболитна алкалоза и мускулна слабост, вследствие на хипокалиемия, са описани в резултат на хронична злоупотреба с лаксативни средства.

##### Терапия

Кратко време след приемане на бизакодил, абсорбцията може да бъде намалена или възпрепятствана чрез предизвикване на повръщане или стомашна промивка. Може да се наложи възстановяване на течностите и корекция на електролитния дисбаланс. Това е особено важно при пациенти в напреднала възраст и при деца.

В някои случаи може да се наложи приложение на спазмолитики.

### 5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

#### 5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Стомашно-чревен тракт и метаболизъм. Слабителни, контактни средства; ATC код: A06AB02

Бизакодил е локално действащо лаксативно средство от дифенилметановата група. Като контактен лаксатив, за който също е характерно, че е нерезорбиращ се, предизвикващ отделяне на вода, бизакодил упражнява своето действие, след хидролиза в дебелото черво, предизвиквайки неговата перисталтика и акумулиране на вода и електролити в чревния лumen. 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 начин естествения процес на изпразване на долната част на стомашно-чревния тракт. Затова бизакодил не оказва въздействие върху храносмилането, както и не води до натрупване в тънкото черво на калории или други хранителни вещества.

#### 5.2 Фармакокинетични свойства

След перорално или ректално приложение бизакодил бързо се хидролизира до активното съединение bis-(p-hydroxyphenyl)-pyridyl-2-methane (BHPM), основно от естерази на чревната мукоза.



При приемане на стомашно-устойчиви таблетки максималната плазмена концентрация на ВНРМ се достига между 4-10 часа след приложение, докато лаксативния ефект се появява между 6-12 часа след приложение. За разлика от приложението на супозитории, при които лаксативният ефект се появява средно след около 20 минути след прилагане. В някои случаи се появява 45 минути след прилагане. Максималната плазмена концентрация на ВНРМ се достига 0,5-3 часа след приложение на супозитория. Следователно, лаксативният ефект на бизакодил не е в съотношение с плазмените нива на ВНРМ. Вместо това, ВНРМ действа локално в долния отдел на стомашно-чревния тракт и не съществува зависимост между лаксативния ефект и плазмените нива на активното съединение. По тази причина, бизакодил таблетки са направени да бъдат устойчиви на стомашен сок и чревно съдържимо. Това води до освобождаването на лекарствения продукт основно в дебелото черво, което е желаното място на действие.

След перорално и ректално приложение само малки количества от лекарствения продукт се абсорбират и са почти напълно конюгирали в чревната стена и черния дроб под формата на неактивен ВНРМ глюкоронид. Плазменият полуживот на елиминиране на ВНРМ глюкоронид е изчислен приблизително на 16,4 часа. След приложение на бизакодил стомашно-устойчиви таблетки средно 51,8% от дозата се открива в изпражненията като свободен ВНРМ и средно 10% от дозата се открива в урината като ВНРМ глюкоронид. След приложение на супозитория средно 3,1% от дозата се открива се в урината като ВНРМ глюкоронид. Изпражненията съдържат голям количество ВНРМ (90% от общата екскреция) и малко количество непроменен бизакодил.

### 5.3 Предклинични данни за безопасност

Острата токсичност при перорален прием на бизакодил при гризачи и такива, които не се отнасят към гризачите е ниска и надвишава дозови нива от 2 g/kg. При кучета се наблюдава дозова толерантност до 15 g/kg. Основните клинични прояви на остра токсичност са диария, понижена моторна активност и пилоерекция.

Проведени са проучвания за токсичност при многократно прилагане до 26 седмици при плъхове, морски свинчета и маймуни от вида *rhesus* (макак). Според очакванията, лекарственият продукт предизвиква тежка дозозависима диария при всички видове с изключение на морските свинчета. Не са наблюдавани ясни хистопатологични промени и по-точно, не е наблюдавана дозозависима нефротоксичност. Наблюдавани са пролиферативните, бизакодил-индуцирани лезии в пикочния мехур при плъхове, третирани за 32 седмици. Тези пролиферации не са причинени от бизакодил. Счита се, че се отнасят вторично до образуването на микрокалкули, поради промени в електролитите в урината и следователно няма биологична значимост при хора.

Данните от проведените обстойни тестове за мутагенност при бактерии и бозайници не показват генотоксичен потенциал за бизакодил. Също така, бизакодил не предизвиква значителни завишения в морфологичната трансформация при ембрионални клетки от хамстер/SHE. Тестове за мутагенност не показват индикация за мутагенен потенциал, за разлика от генотоксичния и карциногенен фенолфталейн.

Не са провеждани конвенционални проучвания за карциногенност на бизакодил. Предвид терапевтичното си сходство с фенолфталейн, бизакодил е изследван в p53 трансгенетичен модел на мишка за 26 седмици. Не е наблюдавана свързана с лечението неоплазия при перорални дозови нива до 8 000 mg/kg дневно.

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 препоръчана дневна доза при човек (изчислена за mg/m<sup>2</sup>) най-малко с 800 пъти. Токсичност при майката и ембрионална токсичност се наблюдават при плъхове при дози 80 пъти по-високи от максималната препоръчана дневна доза при човек.



## **6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ**

### **6.1 Списък на помощните вещества**

#### **Ядро:**

Картофено нишесте  
Лактоза моногидрат  
Талк  
Магнезиев стеарат  
Желатин

#### **Обвивка:**

Съполимер на метакрилова киселина-стилакрилат (1:1)  
Натриев хидроксид  
Триетилов цитрат  
Полисорбат 20  
Талк  
Титанов диоксид (E171)  
Кохинил червено (E124)  
Симетикон

### **6.2 Несъвместимости**

Неприложимо.

### **6.3 Срок на годност**

3 години

### **6.4 Специални условия на съхранение**

Да се съхранява под 25°C.  
Да се съхранява в оригиналната опаковка.

### **6.5 Вид и съдържание на опаковката**

Блистери от Al/PVC фолио.  
1 блистер съдържа 30 стомашно-устойчиви таблетки в картонена кутийка.

### **6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне**

Няма специални изисквания.

## **7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

Майлан ЕООД  
Офис сграда „Сердика офиси“  
бул. Ситняково № 48, ет. 7  
1505 София  
България



**8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

Регистрационен № 9800198

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

Дата на последно подновяване: 17 август 2005 г.

**10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА**

08/2022

