

Кратка характеристика

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО

Приложение към

разрешение за употреба № П-6051/14.09.92

№6 /22.07.02

Живанов

Agiolax® granules

Агиолакс® гранули

1. Търговско име на лекарственото средство

Agiolax®

2. Качествен и количествен състав

5 г от гранулите (1 чаена лъжичка) съдържат:

Plantaginis semen ovatae (Seeds of Plantago ovata)	2.60 g
Plantaginis testa ovatae (Ispaghula husk)	0.11 g
Sennae fructus angustifoliae (Tinnevelly senna pods) (standardized in terms of 15 mg of sennosides)	0.5-0.66 g

3. Лекарствена форма

Гранули

4. Клинични данни

4.1. Показания

За кратковременно лечение на констипация

4.2. Дозировка и начин на приложение

Максималната дневна доза не трябва да надвишава 30 мг хидроксиантраценови деривати, което средно е еквивалентно на 10 г (=2 чаени лъжички) Agiolax гранули.

Следователно дозировката е както следва:

Възрастни и деца над 12 години

1 до 2 чаени лъжички Agiolax гранули веднъж дневно. Гранулите трябва да се приемат несдъвкани със значително количество течност (около 250 мл) вечер след хранене.

Хора в напреднала възраст (над 65 г.):

Същата дозировка.

Деца от 10 до 12 години:

Половината от дозата за възрастни: ½ - 1 чаена лъжичка дневно.

Точната индивидуална доза е най-малката, необходима за получаване на меки, но оформени изпражнения.

Интервал от половин - един час трябва да се спазва след приемане на други лекарства.

За предпочитане е Agiolax да се приема вечер. Действието настъпва приблизително след 8 до 12 часа.

Лаксативите не трябва да се приемат продължително време или във високи дози.

4.3. Противопоказания

Да не се използва в случаите на: свръхчувствителност към някоя от съставките, чревни запушвания и стенози, атония, възпаления на дебелото черво (болест на Crohn, улцерозен колит, апендицит); коремни болки с неустановен произход; тежка дехидратация със загуба на вода и електролити. При деца под 10 години. Диабет, при който е затруднено регулирането на инсулина.

4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Както всички слабители, Agiolax не бива да се дава при наличие на недиагностицирани остри или хронични коремни симптоми. Ако имате ежедневна нужда от лаксативи, трябва да се открие причината за запек. Трябва да се избягва продължителната употреба на слабители. Употреба, по-продължителна от 2 седмици изисква лекарски контрол. Редовната употреба може да предизвика пигментация на дебелото черво (псевдомеланоза), която е безобидна и изчезва след спирането на медикамента. Злоупотребата с лаксативи и предизвиканата в резултат на това загуба на течности и електролити могат да доведат до: зависимост и евентуална необходимост от нарастващи



доза, смущение в електролитния баланс (главно хипокалемия), атония на колона с намалена функция. Приемането на лаксативи, съдържащи антраноид, продължително време може да доведе до влошаване на запек. Хипокалемията може да предизвика сърдечна и нервно-мускулна дисфункция, особено ако се вземат сърдечни гликозиди, диуретици или кортикостероиди. Системната употреба може да доведе до албуминурия и хематурия.

При хроничен запек по-приемливата алтернатива е промяна в начина на хранене, вместо да се употребяват лаксативи.

4.5. Взаимодействие с други лекарства или други форми на взаимодействие.

Хипокалемията (като резултат от системната злоупотреба с лаксативи) потенцира действието на сърдечните гликозиди и влияе на антиаритмиците, на лекарства, които предизвикват реверсия на синусовия ритъм (напр. Quinidine). Едновременната употреба с други лекарства, предизвикващи хипокалемия (напр. тиазидните диуретици, адреностероидите и корена от Ликвириция) може да засили електролитния дисбаланс. Чревната абсорбция на едновременно приеманите препарати може да бъде забавена. Предписването на Агиолакс на болни, приемащи инсулин, може да наложи намаляване на инсулиновата доза.

4.6. Бременност и кърмене

Няма съобщения за нежелани или увреждащи действия на препарата по време на бременност и върху плода, когато се използва в предписаните дози. Все пак през първите три месеца от бременността Agiolax трябва да се употребява само ако запекът не може да се лекува с промяна в начина на хранене или с прибавката на баластни вещества.

Малки количества от активните метаболити (реин) се излъчват чрез майчиното мляко. Лаксативен ефект при кърмачетата не е установен.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Няма

4.8. Нежелани лекарствени реакции

В отделни случаи могат да настъпят стомашно-чревни усложнения. В тези случаи се изисква намаляване на дозата. По време на курса на лечение може да се забележи червено оцветяване на урината, което не е опасно. При продължителна употреба/злоупотреба може да настъпят смущения във водния и електролитен баланс. Диарията може да предизвика по-специално загуба на калий. Това може да доведе до смущения на сърдечната функция и миастения, особено ако се приемат едновременно със сърдечни гликозиди, диуретици и адреностероиди. При продължителна употреба могат да настъпят албуминурия и хематурия. Освен това може да се получи пигментация на интестиналната лигавица (*Pseudomelanosis coli*), която като правило изчезва след спиране на приема.

В редки случаи може да се наблюдава свръхчувствителност към плантаго-компонентата.

4.9. Предозиране

Най-честите симптоми са колики и тежка диария със съпътстваща загуба на течности и електролити, които трябва да бъдат набавени. Лечението трябва да се провежда като се приемат големи количества течности. Трябва да се следят електролитите и по-специално калия.

5. Фармакологични свойства

5.1. Фармакодинамика

Фибрите и слузта от семената и люслите на *Plantago ovata* възстановяват нормалния пасаж на съдържимото в дебелото черво. Фибрите действат лаксативно като увеличават обема на фекалната маса. Те намаляват времето за преминаване през колона чрез физическо стимулиране на чревните стени като поглъщат течностите и увеличават обема на чревното съдържимо. Повишава се теглото на последното, както и водното му съдържание чрез свързване на водата и увеличаване количеството на бактериите във фекалната маса.

Дериватите на 1,8-дихидроксиантрацена притежават лаксативно действие.

Гликозидите с β -връзки (сенозидите) не се абсорбират в тънките черва; те се превръщат в активен метаболит (реинантрон) от бактериите в дебелото черво. Тук има два различни механизма на действие:



1. Влияние върху подвижността на дебелото черво (стимулация на перисталтиката и потискане на локалните контракции), което води до ускорено преминаване на фекалната маса през него и оттам до намаление на резорбцията на течности.
2. Влияние върху секреторните процеси (стимулация на мукозата и активна хлоридна секреция), което води до засилено изхвърляне на течности.

Дефекацията настъпва след около 8-12 часа – времето, необходимо за преминаване през дебелото черво и за метаболизиране на препарата до активни съставки.

5.2. Фармакокинетични свойства

Гликозидите с β -връзки (сенозидите) не се абсорбират в тънките черва, нито се разграждат от храносмилателните ензими. Те се преобразуват от бактериите, намиращи се в дебелото черво, в активен метаболит (реинантрон). Агликатите се абсорбират в тънките черва. Опити с животни с радиоактивно-белязан реинантрон, приложен директно в сляпото черво, показват абсорбция по-малка от 10%. При контакт с кислород реинантронът се окислява до реин и сенидини, които могат да бъдат открити в кръвта главно под формата на глюкурониди и сулфати. След орално приложение на сенозиди 3-6% от метаболитите се изхвърлят чрез урината; една част се отделя чрез жлъчката. По-голямата част от сенозидите (около 90%) се отделя чрез фекалиите като полимери (поликвинони) заедно с 2-6% непроменени сенозиди, сенидини, реинантрон и реин. При фармакокинетични изследвания на хора, приемащи орално пулверизирани шушулки на сена (20 мг сенозиди) в продължение на 7 дни, е намерена максимална концентрация от 100 нг реин/мл в кръвта. Кумулация на реина не е наблюдавана. Активните метаболити напр. реин, преминават в малки количества в кърмата. Опитите с животни показват, че реинът има слаба проникваемост през плацентата.

Фибрите на *Plantago ovata* в по-голямата си част са несмилаеми и не се абсорбират. След орално приемане те се отделят в набъбнало състояние чрез фекалиите, частично разградени от чревната флора в колона.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Повечето данни се отнасят за екстракт, съдържащ 1.4 до 3.5% антраноиди, отговарящи на 0.9 до 2.3% потенциален реин, 0.05 до 0.15% потенциален алое-емодин и 0.001 до 0.006% потенциален емодин или за изолираните активни съставки, напр. реин или сенозиди А и Б. Острата интоксикация от шушулките на сената, балансиран екстракт от тях, както и от сенозиди при мишки и плъхове след орално приемане е била слаба. Като резултат от изследванията при парентерално приложение на мишки, се предполага, че екстрактите притежават по-голяма токсичност, отколкото пречистените гликозиди, което е възможно да се дължи на съдържанието на агликат.

Сенозидите не проявяват специфична токсичност, когато са изпитвани в дози над 500 мг/кг при кучета за 4 седмици и над 100 мг/кг при плъхове за 6 месеца. Данни за билкови препарати няма.

Няма доказателства за каквото и да било ембриопетално, тератогенно или фетотоксично действие при плъхове или зайци след орално третиране със сенозиди. Освен това не е имало ефект върху постнаталното развитие на млади плъхове, върху поведението на майките или върху плодовитостта на женските и мъжки животни при плъхове. Данни за билкови препарати няма.

Екстрактът и алое-емодинът притежават мутагенно действие при опити *in vitro*, сенозид А и Б дават негативен резултат за мутагенност. Задълбочени изпитания *in vivo* на дефиниран екстракт от майчин лист също показват негативен резултат. Балансиран екстракт от сена, даван орално 2 години, няма канцерогенно действие при мъжки или женски плъхове. Изпитваният екстракт е съдържал около 40.8% антраноиди, от които 35% са били сенозиди, отговарящи на около 25.2% потенциален реин, 2.3% потенциален алое-емодин и 0.007% потенциален емодин или 142 ppm свободен алое-емодин и 9 ppm свободен емодин.

6. Фармацевтични данни

6.1. Списък на помощните вещества

Sucrose, Talc, Acacia, Iron oxide, red, E172, Iron oxide, red, E172, Iron oxide, black, E172, Iron oxide, yellow, E172, Hard paraffin, Peppermint oil, Caraway oil, Sage oil



6.2. Несъвместимости

Не са известни

6.3. Срок на годност

5 години

6.4. Специални изисквания за съхранение

Температура до 25° С.

6.5. Данни за опаковката

Многослоен флакон от картон, върху вътрешната страна на който е нанесено алуминиево фолио, основа от електролитна калаена платка, полипропиленова вътрешна част, полипропиленова винтова капачка и кръгла вътрешна запушалка от полистирол. Няма картонена кутия, листовката е поставена под винтовата капачка.

Размер на опаковката: 100 г, 150 г и 250 г

Отделните залепени опаковчици (сашета) се състоят от 4 слоя, направени от хартия, покрита от едната страна с бяла хартия, LDPE (полиетилен с ниска плътност), алуминиево фолио и съдържат 5 г гранули. Поставени са по 6 броя в пластмасова кутийка

6.6. Препоръки при употреба

Няма

7. Производител на крайния продукт и притежател на разрешението за употреба

Madaus AG

51101 Cologne

phone: (0221) 8998 0

Fax: (0221) 8998 711

e-mail: info@madaus.de

8. Номер на разрешението за употреба

960 0347

9. Дата на първата регистрация

13.12.1996 г.

10. Дата на последната редакция на текста

март 1999 г.

