



МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО

Приложение към
разрешение за употреба № 11-9506/05.08.04г

659/29.06.04г *Мичева*

Бизакодил Софарма
стомашно-устойчиви таблетки - 5 mg

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

BISACODYL SOPHARMA

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Съдържание на една стомашно-устойчива таблетка:

Bisacodyl 5 mg

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Стомашно-устойчиви таблетки

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Показания

- Краткотрайно лечение на функционална констипация;
- Състояния, при които се изисква улесняване на дефекацията;
- За овладяване на постоперативна констипация;
- Като част от общия режим за почистване на дебелото черво преди хирургични интервенции, рентгеново, ехографско (изключително рядко) или ендоскопско изследване.

4.2. Начин на приложение и дозировка

При констипация:

Възрастни и деца над 12 години - перорално в доза 5-10 mg (1-2 таблетки) еднократно вечер. При деца от 6 до 12 години – 5 mg (1 таблетка) еднократно вечер или сутрин преди закуска (приблизително по 0,3 mg/kg).



Бизакодил Софарма стомашно-устойчиви таблетки - 5 mg

При диагностични процедури:

За подготовка на пациента преди рентгеново, ендоскопско, ехографско изследване на коремни органи или предстояща оперативна интервенция се прилага на възрастни и деца над 12 години в доза от 10 mg до 20 mg (2-4 таблетки) еднократно вечер в два последователни дни преди изследването или хирургичната интервенция.

При деца от 6 до 12 години – 5 mg вечер.

Таблетите трябва да се поглъщат цели, със съответно количество течност. Не трябва да се приемат с мляко и антиациди. Бизакодил Софарма трябва да се приема 1 час преди или 2 часа след хранене поради възможни взаимодействия с храната.

Не се препоръчва прием на Бизакодил Софарма повече от 10 дни.

4.3. Противопоказания

Свръхчувствителност към активното или към някое от помощните вещества, илеус, остри възпалителни заболявания в коремната кухина, остър хирургичен корем, неопластични заболявания на червата, хронични възпалителни чревни заболявания, кървене от гастро-интестиналния тракт, чревна полипоза, възпаление на хеморойдите, нарушения във водно-електролитното равновесие, генитално кървотечение.



Бизакодил Софарма стомашно-устойчиви таблетки - 5 mg

4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

Продуктът трябва да се прилага с внимание при пациенти в напреднала възраст, при болни с кардио-васкуларни заболявания (хипотония, хронична сърдечна недостатъчност), изтощени и фебрилни болни.

Не се препоръчва приложение на Бизакодил Софарма при диагностично неизяснена абдоминална болка, гадене и повръщане.

Неизяснен стомашно-чревен дискомфорт с продължителност повече от две седмици изисква предварителна консултация с лекар преди употреба на Бизакодил Софарма.

Бизакодил Софарма, както и останалите лаксативни продукти трябва да се прилага внимателно при пациенти с уролитиаза. Последната може да се прояви като рядко усложнение на злоупотребата с лаксативи.

Приложение на продукта в по-високи дози от максималните може да доведе до поява на коремна болка, увеличена секреция на мукус в чревния лумен и значителна загуба на вода.

Продължителното и необосновано приложение на продукта трябва да се избягва поради възможна зависимост.

Не се препоръчва Бизакодил Софарма да се назначава на деца под 6 годишна възраст, поради трудност в дозирането и невъзможност за делене на стомашно-устойчивите таблетки. В случай на нарушение в целостта на обвивката може да се появи стомашно дразнене.

Продуктът не трябва да се използва за редукция на телесното тегло.



Бизакодил Софарма стомашно-устойчиви таблетки - 5 mg

Този лекарствен продукт съдържа 0,04 g лактоза. Когато се приема съгласно препоръките за дозиране, всяка доза набавя до 0,08 g лактоза. Неподходящ при хора с лактазна недостатъчност, галактоземия или глюкозен/галактозен синдром на малабсорбция.

Продуктът съдържа като помощно вещество пшенично нишесте, което може да представлява опасност за хора с цьолиакия.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Бизакодил скъсява гастроинтестиналното транзитно време, поради което може да се намали резорбцията на други лекарства и хранителни добавки при едновременно приложение.

- Храна – различните хранителни продукти могат да предизвикат разтваряне на таблетките в стомаха с възпалителни изменения в стомашната лигавица и поява на болки. За избягване на този проблем, Бизакодил Софарма трябва да се приема 1 час преди или 2 часа след хранене
- При едновременния прием с мляко също могат да се появят оплаквания от дразнене на гастро-интестиналния тракт.
- Диуретици – едновременното прилагане на Бизакодил Софарма с тиазидни и бримкови диуретици може да доведе до ексцесивна загуба на калий.
- Едновременното приемане със системни глюкокортикостероиди и амфотерицин също води до хипокалиемия.



Бизакодил Софарма стомашно-устойчиви таблетки - 5 mg

- Електролитният дисбаланс може да доведе до повишена чувствителност към сърдечни гликозиди.
- Антиацидни продукти и H₂-блокери – назначаването на Бизакодил Софарма едновременно с прием на тези лекарствени продукти, може да доведе до по-бързо разтваряне на обвивката и прояви на гастро-дуоденално дразнене.
- Едновременното приложение на Бизакодил Софарма и орални антикоагуланти може да доведе до ускоряване времето на резорбция, поради което може да се наложи корекция в дозата на антикоагулантите.
- Бизакодил Софарма е контактно лаксативно средство и действието му се антагонизира от локални анестетици и опиати.
- Лекарствени продукти с холиномиметично действие (ацетилхолин, пилокарпин и др.), както и с адренолитично действие (йохимбин, вазолат) стимулират холинергичната инервация на червата и създават условия за потенциране действието на продукта. Обратно, продукти с адреномиметично и холинолитично действие създават условия за намаляване на ефекта му поради активиране на адренергичните рефлекторни звена.

4.6. Бременност и кърмене

Бизакодил Софарма преминава през плацентата и се екскретира с майчиното мляко, поради което не се препоръчва по време на бременност и лактация.



Бизакодил Софарма
стомашно-устойчиви таблетки - 5 mg

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

В някои случаи при приемане на по-високи дози и при възрастни хора могат да се появят краткотрайни симптоми като обща слабост, нарушения в координацията, ортостатична хипотония, което трябва да се има предвид при шофиране и работа с машини.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите реакции са предимно от страна на гастро-интестиналния тракт:

- коремни болки и колики (срещат се по-често при лица с тежка констипация)
- гадене, тежест и подуване на корема;
- диария с различна интензивност, което от своя страна може да доведе до развитие на нарушения във водно-електролитния баланс (хипокалиемия, задръжка на натрий). Последният може да предизвика обърканост, аритмии, мускулни крампи, обща слабост и уморяемост; протеин-губеща ентеропатия;
- при хронично приемане е възможно развитие на толерантност към ефектите на продукта;
- прояви на свръхчувствителност - обриви, сърбеж, рядко ангиоедем и анафилактични реакции.

4.9. Предозиране

При високи дози Бизакодил Софарма се наблюдават диария, абдоминални колики, загуба на електролити и клинично изразена хипокалиемия. При хронично предозиране могат да се наблюдават



Бизакодил Софарма стомашно-устойчиви таблетки - 5 mg

хронична диария, манифестна хипокалиемия (мускулна слабост, обща уморяемост, ритъмни нарушения), вторичен хипералдостеронизъм, нефролитиаза, увреждане на бъбречните тубули, метаболитна алкалоза.

Лечение – прекъсване на приема на Бизакодил Софарма, стомашен лаваж, рехидратираща терапия с водно-електролитни разтвори, при необходимост - калиева субституция, спазмолитици.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1. Фармакодинамика

Бизакодил Софарма е синтетичен лекарствен продукт от групата на дифенилметана и притежава контактно стимулиращо действие върху перисталтиката на гастро-интестиналния тракт. Продуктът действа директно върху нервните окончания на чревната мукоза, поради което при орално приложение ефектът му настъпва след 6-12 часа. Продуктът не стимулира матката и не предизвиква маточни контракции. Стимулирайки нервните окончания на сетивните нерви той предизвиква парасимпатикови рефлексии, в резултат на което се повишават перисталтичните контракции на колона.

Бизакодил Софарма стимулира секрецията на вода и електролити в чревния лумен, стимулира чревния пасаж и предизвиква разстройство във връзка с активираната синтеза на азотен оксид. Азотният оксид (NO) стимулира интестиналната секреция на електролити и играе важна роля като медиатор на интестиналния мотилитет.



Бизакодил Софарма стомашно-устойчиви таблетки - 5 mg

Бизакодил Софарма индуцира секрецията на течности в червата чрез инхибиране на (Na + K) АТР-аза и стимулиране на йеюналната и колонната аденил - циклазна активност, който процес вероятно е медиран от повишено съдържание на PG E₂ в лигавицата.

Механизмът на действие на Бизакодил Софарма го прави особено подходящ за повлияване на констипация, свързана с ганглионарна блокада или засягане на гръбначния мозък от нокси с различен характер (възпалителни, токсични, механични).

5.2. Фармакокинетика

Бизакодил Софарма е локален лаксатив и се резорбира в незначителна степен в гастро-интестиналния тракт (не повече от 5%) след орално приложение. Хидролизира се от ензими на чревната лигавица до bis(p-hydroxyphenyl)pyrid-yl-2-methane, който е носител на фармакологичната активност на продукта. Резорбираната част се конюгира и циркулира в кръвния ток в неактивна форма, след което се екскретира чрез урината и жлъчката под формата на глюкурониди. Основната част от bis(p-hydroxyphenyl)pyrid-yl-2-methane се екскретира директно чрез фецеса. Освобождаването на активното вещество на Бизакодил Софарма под формата на стомашно-устойчиви таблетки става в дебелото черво. Началото на действие на лекарствения продукт е между 6-12 час.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Бизакодил Софарма е продукт с изключително ниска токсичност за човешкия организъм, поради факта, че при перорално приложение резорбцията е минимална. Всички регистрирани цитохимични



Бизакодил Софарма
стомашно-устойчиви таблетки - 5 mg

промени в лигавицата на гастро-интестиналния тракт при експериментални животни се определят като функционални и не показват наличие на преканцерозни нарушения и лезии. На базата на изследвания при животни се счита, че няма риск за канцегогенно действие на bisacodyl при хора, когато се прилага в препоръчваната дозировка.

Ефектите на bisacodyl върху репродуктивните способности са определяни при перорално приложение върху плъхове в дози, съответстващи на 70-кратно по-високи дози от тези при хора. Не са отчетени статистически значими разлики в броя, виталитета или телесната маса на поколенията. Фертилитетът на третираните животни не е повлиян от bisacodyl. Не са наблюдавани увреждания на фетуса в резултат от третирането.

Остра токсичност - при проведените експерименти за остра токсичност при перорално приложение на bisacodyl при плъхове са установени стойности на $LD_{50} > 3$ г/кг.

Хронична токсичност - в проучвания за хронична токсичност плъхове от двата пола са третирани с bisacodyl в концентрации 0.3, 0.1 и 0.03% в хранителната диета за 32 седмици. Животните и от двата пола са страдали от диария в експерименталния период, следствие от третирането. Само в групата, третирана с най-високата концентрация на bisacodyl (0.3%) са наблюдавани уролитиаза и епителни пролиферативни лезии на пикочния мехур при мъжките животни. Установено е, че пролиферациите на епитела на пикочния



Бизакодил Софарма
стомашно-устойчиви таблетки - 5 mg

мехур не са пряко следствие от приложението на bisacodyl, а най-вероятно са причинени вторично от уrolитиазата.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества и техните количества

Съдържание на една таблетка в mg:

Lactose monohydrate	40,00
Gelatin	1,30
Wheat starch	44,70
Silica colloidal anhydrous	0,50
Magnesium stearate	0,50
Talc	5,20
Eudragit L30 D-55 30%	20,00
In NaOH	0,10
Triethyl citrate	0,60
Titanium dioxide	0,60
Боя Quinoline Yellow	0,20
Macrogol 6000	0,30

6.2. Физико-химични несъвместимости

Не са известни.

6.3. Срок на годност

Две години от датата на производство.

6.4. Специални условия за съхранение

Да се съхранява при температура под 25⁰ С.

Да се съхранява в оригинална опаковка на сухо и защитено от светлина място.



Бизакодил Софарма
стомашно-устойчиви таблетки - 5 mg

Да се съхранява на място, недостъпно за деца!

6.5. Данни за опаковката

Продуктът се опакова по 10 /десет/ стомашно-устойчиви таблетки в блистер от твърдо ПВХ/алуминиево фолио. Три блистера се поставят в шанцована кутия от картон заедно с листовката за пациента.

6.6. Препоръки за употреба

Няма

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Софарма АД, България,
1220 София, ул. "Илиенско шосе" N 16

**8. РЕГИСТРАЦИОНЕН № В РЕГИСТЪРА ПО ЧЛ. 28 ОТ
ЗЛАХМ**

**9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ ЗА УПОТРЕБА НА
ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ (ПОДНОВЯВАНЕ НА
РАЗРЕШЕНИЕТО)**

10. ДАТА НА (ЧАСТИЧНА) АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА

08.07.2004г.

