

ЗБИРЕН ИЗВЕШТАЈ ЗА ОСОБИНИТЕ НА ЛЕКОТ

1. ЗАШТИТЕНО ИМЕ НА МЕДИЦИНСКИОТ ПРОИЗВОД

- ♦ GELUSIL® LAC таблети.

2. КВАЛИТАТИВЕН И КВАНТИТАТИВЕН СОСТАВ

1 таблета содржи 500 mg алуминиум-магнезиум-силикат-хидрат (сималдрат) и 300 mg безмасен млечен прав

3. ФАРМАЦЕВТСКА ФОРМА

- ♦ Таблета;

4. КЛИНИЧКИ ОСОБЕНОСТИ

4.1 ТЕРАПЕВТСКИ ИНДИКАЦИИ

- хиперацидитет (со и без печење во хранопроводникот)
- улкусна болест (улкус на желудник и дванаестопалачно црево)
- акутен и хроничен гастрит
- рефлуксен езофагит
- надразнета желудечна лигавица од различно потекло (етанол, кафе, никотин)
- hiatus hernia

Се препорачува за лекување на пироза кај бремени жени, повозрасни пациенти, како и кај пациенти кои имаат потешкотии во варењето (подригнување, флатуленција и метеоризам).

4.2 ДОЗИРАЊЕ И НАЧИН НА УПОТРЕБА

Таблетите се земаат повеќе пати на ден (3-6 пати), треба се цвакаат пред да се проголтаат, а потоа може да се испие една чаша вода.

Кај деца на возраст од 6-12 години треба да се даде половина од предвидената доза за возрасни.

Против чувство на “киселина” се зема една доза без оглед на оброкот.

4.3 КОНТРАИНДИКАЦИИ

- преосетливост на составните компоненти
- бубрежна инсуфициенција
- недијагностицирано крварење од дигестивниот тракт или ректум
- акутен абдомен (апендицитис)
- улцеративен колит, опстипација, диареа, опструкција на црева
- кај инактивни и дехидрирани пациенти потребно е внимателно дозирање

ПОСЕБНИ МЕРКИ НА ПРЕТПАЗЛИВОСТ И ПРЕДУПРЕДУВАЊЕ

Примената на препаратот во текот на бременоста се ограничува на мали дози во



краток временски интервал. Според податоци од литературата, кај фетуси и новородени од мајки кои хронично примале големи дози на алуминиум и магнезиум хидроксид е докажана хиперкалцемија, хипер или хипомагнезијемија и потенцирани тетивни рефлексии.

Во тек на *доењето* мали количини на алуминиум и магнезиум можат да се елиминираат и преку млекото, меѓутоа концентрацијата на овие катјони не е толку висока за да предизвика несакани дејства кај новородените.

Кај *новозрасните пациенти* хроничната терапија со алуминиумски антациди може да ја влоши метаболната состојба на коските поради деплеција на фосфорот; може да се јави хиперкалцурија, како и инхибиција на цревната ресорпција на флуоридите. Не постојат потврдени податоци за корелацијата на внесот на големи количини алуминиум и појавата на Алцхајмеровата болест, но примената на антациди кои содржат алуминиум не се препорачува кај заболени од оваа болест.

Посебни мерки на претпазливост се потребни кај пациенти со *оштетен бубрежна функција*. Во овие случаи се ограничува дневната доза на магнезиум (во антацидите) на 50 mEq.

Кај пациенти со *уремија* кои не се на дијализа, примената на препарати кои содржат алуминиум кој ги врзува на себе фосфатите може да предизвика труење со алуминиум и остеомаластија.

Употребата на антациди со алуминиум и магнезиум кај пациенти кои анамнестички даваат податоци за крварење од горните делови од дигестивниот тракт треба да биде особена претпазливост.

4.5 ИНТЕРАКЦИИ

Способноста на антацидите да ја менуваат вредноста на pH во желудникот, како и да создаваат комплекси со други лекови, може да влијае на брзината и ресорпцијата на лековите доколку се применуваат **истовремено** со антацидите. Пациентот треба да се предупреди да не зема никакви лекови перорално 1-2 часа од земањето на антацидот. Клинички позначајни интеракции на антацидите се со следниве наведени лекови:

1. *Антиагонистите на H₂ рецепторите, сукралат, лансопразол*

Антацидите ги намалуваат вредностите на AUC на циметидинот и ранитидинот, а значајно ја намалуваат биорасположливоста на фамотидинот и низатидинот. Алуминиум-магнезиум хидроксидот може да влијае на врзувањето на сукралфатот и желудечната лигавица. Антацидите можат да ја зголемат ресорпцијата на лансопразолот и затоа тој не смее да се применува заедно со антацидите.

2. *Антимикробни лекови*

Антацидите ја намалуваат ресорпцијата на тетрациклините (за повеќе од 90 %), кинолоните (ципрофлоксацин, офлоксацин, норфлоксацин, пефлоксацин и спарфлоксацин) за повеќе од 35-90 %, кетоконазолот и цефаклорот. Исто така ја намалуваат биорасположливоста на еноксацинот и брзината на растопување на еритромицинот.

3. *Лекови кои делуваат врз кардиоваскуларниот и респираторниот систем*

Според поновите сознанија не е потврдено поранешното мислење дека антацидите ја намалуваат ресорпцијата на бета адренергичните блокатори атенололот и метопрололот. При истовремена употреба со антациди се зголемуваат плазматските концентрации на метопрололот. Антацидите ја намалуваат биорасположливоста на



каптоприлот и брзината на ресорпцијата на теофилино, додека пак не влијаат врз ресорпцијата на кардиотоничните гликозиди (можеби поради нивните подобри формулации).

4. Фосфати

Антацидите ја намалуваат ресорпцијата на орално администрираните фосфати, додека при истовремена употреба на антацидите и сукралфатот може да се зголеми опасноста од клинички значајна хипофосфатемија.

5. Нестероидни антиинфламатори

Алуминиум хидроксид и магнезиум оксид адсорбираат значајни количини на парацетамол и хлорохин-сулфат и го забавуваат нивното растопување. Антацидите ја зголемуваат брзината на ресорпција на толфенаминската и мефенаминската киселина, ибупрофенот и салицилатите.

6. Перорални хипогликемици и антикоагуланти

Магнезиум хидроксид даден перорално ја зголемува биорасположливоста на толбутамидот, а може да ја забрза и ресорпцијата на хлорпропамидот, глипизидот, глибенкламидот и дикумаролот.

7. Антихолинергички и други

Антацидите ја намалуваат ефикасноста на антихолинергичките намалувајќи ја нивната ресорпција. Цитратите со антацидите (алуминиум) можат да предизвикаат системска алкалоза и зголемена ресорпција на алуминиумот од цревата. Пролонгираната примена на антацидите ја намалува ресорпцијата на фолната киселина и изониазидот. Витаминот Д заедно со магнезиумов антицид може да предизвика хипермагнезиемија. Антацидите ја алкализираат урината при елиминација на амфетаминот и кинидинот со оглед на тоа дека овие лекови имаат намалена елиминација во алкална урина.

Антациди и лабораториски испитувања

Антацидите ја зголемуваат серумската концентрација на гастринот и ја зголемуваат рН во крвта и урината. При употреба на антацидите кои содржат алуминиум се намалува серумскиот фосфор, додека при долготрајна употреба на магнезиум хидроксид доаѓа до намалување на серумската концентрација на калиум.

Антациди и дијагностички испитувања

Истовремено со пентагастринот и хистаминот, алуминиум и магнезиум хидроксидот ги менуваат резултатите од тестовите на желудечната секреторна функција по стимулација со пентагастрин и хистамин.

4.6 БРЕМЕНОСТ И ДОЕЊЕ

Примената на препаратот во текот на бременоста се ограничува на мали дози во краток временски интервал. Според податоци од литературата, кај фетуси и новородени од мајки кои хронично примале големи дози на алуминиум и магнезиум хидроксид е докажана хиперкалцемија, хипер или хипомагнезиемија и потенцирани тетивни рефлексии.

Во тек на доењето мали количини на алуминиум и магнезиум можат да се елиминираат и преку млекото, меѓутоа концентрацијата на овие катјони не е толку висока за да предизвика несакани дејства кај новородените.

4.7 ЕФЕКТИ НА ЛЕКОТ ВРЗ УПРАВУВАЊЕ СО МОТОРНО ВОЗИЛО ИЛИ МАШИНА



Лекот не влијае на психофизичките способности на пациентите.
Gelusil® Lac не влијае на способноста за управување со моторни возила.

4.8 НЕСАКАНИ ДЕЈСТВА

Антацидите влијаат на цревниот мотилитет. Доколку имаат алуминиум во составот, предизвикуваат опстипација (зависно од дозата) и овој ефект е поизразен кај возрасните. Најчесто несакако дејство кај магнезиумовите антациди е ретка столица и/или диареа, што може да резултира со губење на течности и електролити. Кај комбинираниите препарати кои содржат алуминиум и магнезиум, крајниот ефект врз мотилитетот на цревата зависи од нивниот сооднос. Намалувањето на мотилитетот, дехидратацијата или ретенцијата на течностите може да предизвика цревна опструкција.

Кај пациенти со нормална бубрежна функција, алуминиумот од антацидите ретко предизвикува системски несакани дејства. Понекогаш се среќава појава на хипофосфатемија. Долготрајна употреба на антациди кои содржат алуминиум и магнезиум хидроксид може да предизвика спонтани фрактури на долгите коски поради исцрпените резерви на фосфати од коските.

Кај пациенти со пореметена ренална функција долготрајната терапија со антациди може да доведе до токсична кумулација на алуминиум и магнезиум. Ресорбирањето на алуминиум од антацидите се врзува за плазматските протеини (албумин, трансферин) поради што тешко се дијализира. Истиот се кумулира во коските, белите дробови и нервното ткиво. Се смета дека остеодистрофијата која се јавува при состојби на хипералбуминемија е последица на депонирање на алуминиум во коските.

Долготрајната употреба на алуминиумски антациди може да предизвика создавање на бубрежни калкулуси, остеомаляция и остеопороза. Кај пациенти со пореметена бубрежна функција антацидите со магнезиум можат да предизвикаат хипермагнезијемија која се карактеризира со хипотензија, гадење, повраќање, промени во ЕКГ, депресија на дишење и кома.

5.0 ФАРМАКОЛОШКИ ОСОБЕНОСТИ

5.1 ФАРМАКОДИНАМСКИ СВОЈСТВА

Хидроксидите на магнезиумот и алуминиумот се вбројуваат во најпознати антацидни лекови. и покрај релативно малиот капацитет на неутрализација на HCL, тие физички се врзуваат за пепсинот со што се објаснува нивниот значителен противулкусен ефект.

Антацидите се аплицираат орално, при што солите на магнезиум се ресорбираат и по навлегувањето во цревата ја забрзуваат перисталтиката делувајќи лаксантно што е и пожелно дејство кај улкусната болест. Соединенијата на алуминиумот не се ресорбираат, така да не доведуваат до последователна хиперсекреција на HCL, но ефикасно го инактивираат пепсинот и жолчните киселини. Со своето адстрингентно дејство солите на алуминиум делуваат опсипантно. Со менување на соодносот на количините на магнезиумовите и алуминиумовите соли може да се влијае на цревната перисталтика.

Еден грам од алуминиум-магнезиум-силикат-хидрат врзува 150 ml 0.1 N хлороводородна киселина. За неутрализација до pH=7 на 1g сималдрат потребно е 0.25 mmol HCl, што јасно укажува дека капацитетот за неутрализација на желудечната



содржина не е толку изразен како кај некои други антациди, ниту пак киселоста на желудечната содржина се намалува како кај H_2 -блокаторите. Сепак овој факт има и свои предности, бидејќи сималдратот никогаш не предизвикува комплетна неутрализација на HCl во желудечниот сок, па според тоа никогаш не предизвикува секундарна хиперсекреција на киселината. Исто така, денес е јасно дека антацидите од типот на алуминиум и магнезиум, во механизмот на своето делување немаат само неутрализирачка способност кон HCl , туку е докажано дека тие ја намалуваат концентрацијата на пепсинот во желудечниот сок и концентрацијата на жолчните киселини и лизолецитинот со што се намалува нивниот иритирачки ефект.

Алуминиумот преципитира бројни протеини, со масни киселини создава хидрофобни сапуни, додека магнезиумот ги има истите дејства но послабо изразени.

Се смета дека антацидите на сеуште недоволно објаснет начин вршат стимулација на протективниот систем на простагландинот E_2 на желудечната лигавица.

Сималдратот не го менува моталитетот на дигестивниот тракт, бидејќи констипативниот ефект на алуминиумот ја антагонизира лаксативната компонента на магнезиумот. Алуминиум-магнезиум-силикат-хидрат не ја менува ацидобазната рамнотежа во организмот.

5.2 ФАРМАКОКИНЕТСКИ СВОЈСТВА

Јоните на алуминиум и магнезиум не се ресорбираат во значителна мера и затоа антацидите кои ги содржат не влијаат значително на ацидобазната рамнотежа, како што тоа го прави бикарбонатот. Нересорбираните количества на антациди поминуваат непроменети низ цревата како нересорбирани карбонати или оксиди се елиминираат преку фецесот. Ресорбираниот мал дел се наоѓа во вид на катјони и дава системски ефекти.

Серумското ниво на алуминиум е мерено кај 30 пациенти на интензивна нега кај кои е ординиран антацид за превенција на стрес-улкус. Забележано е зголемување на серумското ниво на алуминиумот кај сите пациенти кои имале нормална и незначително пореметена бубрежна функција, но под критичното ниво од 100 ng/ml .

Со цел да се одреди плазматското ниво на алуминиумот и неговите уринарни концентрации како резултат на антацидната терапија изведен е студија на 80 пациенти со гастроинтестинални заболувања и нормална бубрежна функција. Пациентите секојдневно примале вкупно 512 мг алуминиум од комплекс базиран на алуминиумски алатоинати (во две антацидни формулации; суспензија и лиофилизирана таблета) во тек на 30 дена. Не е забележано сигнификантно покачување на плазматските и уринарните на алуминиумот во тек на студијата, што укажува дека овој вид на соединенија на алуминиумот се погодни за долготрајна антацидна терапија.

Единствено, во едно испитување изведено кај здрави доброволци е покажано дека високите дози на гелусил не ја зголемуваат концентрацијата на магнезиум и алуминиум во плазмата, но доведуваат до зголемено лачење на овие елементи со урината.

Заради тоа, потребно е да се внимава после долготрајна употреба на гелусилот кај пациенти со намалена функција на бубрезите, затоа што акумулацијата на алуминиумот може, како што е познато да доведе до сериозни енцефалопатии и остеомаляции.

5.3 ПРЕТКЛИНИЧКИ ПОДАТОЦИ ЗА СИГУРНОСТА НА ЛЕКОТ

Сите компоненти кои влегуваат во состав на препаратот Gelusil Lac® се наоѓаат во



широка употреба долг низ на години. Според достапните референци не постои некоја индикација која би укажувала на неговата токсичност (акутна и хронична токсичност, канцерогеност, мутагеност и токсични дејства врз фертилитетот и можното тератогено дејство). Може да се каже дека се работи за лек кои во тераписки, препорачани дози предизвикува само благи несакани дејства.

6.0 ФАРМАЦЕВТСКИ ОСОБЕНОСТИ

6.1 ЛИСТА НА ЕКСЦИПИЕНТИ

- Млеко во прав;
- Сахароза;
- Магнезиум стеарат;
- Арома на ванила сушена 39774;
- Лактоза монохидрат;
- Тинктура на ванила, вештачка.

6.2 ИНКОМПАТИБИЛНОСТИ

Не се познати

6.3 РОК НА ТРАЕЊЕ

- 5 години
- Лекот не смее да се употребува после истекот на датумот означен на пакувањето.

6.4 НАЧИН НА ЧУВАЊЕ

Да се чува на температура до 25° C, во оригиналното пакување со цел да се заштити од светлина и влага.

ЛЕКОТ ДА СЕ ЧУВА НА МЕСТА НЕДОСТАПНИ ЗА ДЕЦА!

6.4 ПАКУВАЊЕ

40 таблети по 500 mg.

Контактна амбалажа: алуминиум / PVC блистер.

7.0 ИМЕ И АДРЕСА НА ПРОИЗВОДИТЕЛОТ

НЕМОФАРМ, А.Д., ул. Београдски пут бб, Вршац, Р.Србија во соработка со Pfizer Н.С.Р.

7.1 НОСИТЕЛ НА ОДОБРЕНИЕТО ЗА СТАВАЊЕ ВО ПРОМЕТ

ХЕМОФАРМ А.Д. ФАРМАЦЕВТСКО - ХЕМИСКА ИНДУСТРИЈА
ПРЕТСТАВНИШТВО СКОПЈЕ, ул. Иво Лола Рибар 39/1-1, Скопје,
Р.Македонија

8.0 БРОЈ И ДАТУМ НА РЕШЕНИЕТО ЗА ПРОМЕТ

15-19032/07 од 24.12.2007



**9.0 ДАТУМ НА ПРВОТО ОДОБРЕНИЕ/ОБНОВА НА
ОДОБРЕНИЕТО**

15.06.1998 год.

10.0 ДАТУМ НА (ДЕЛУМНА) РЕВИЗИЈА НА ТЕКСТОТ

Мај, 2008 год.

