

SOUHRN ÚDAJŮ O PŘÍPRAVKU

1. NÁZEV PŘÍPRAVKU

Ospolot 200 mg potahované tablety

2. KVALITATIVNÍ A KVANTITATIVNÍ SLOŽENÍ

Jedna tableta obsahuje 200 mg sultiamu

Pomocné látky se známým účinkem: 50,0 mg laktózy v jedné tabletě

Úplný seznam pomocných látek viz bod 6.1.

3. LÉKOVÁ FORMA

Potahované tablety

Popis přípravku: Kulaté bílé oboustranně lehce bikonvexní potahované tablety o průměru 10 mm s půlicí rýhou na jedné straně, na druhé straně vyraženo „200“

Tabletu lze rozdělit na stejné dávky.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikace

Benigní parciální epilepsie dětského věku – rolandická epilepsie, zvláště pokud léčba jinými antiepileptiky selhává.

4.2 Dávkování a způsob podání

Dávkování

Dávkování je přísně individuální, stanoví a kontroluje je lékař a nesmí se svévolně měnit, či vysazovat. Dávka se postupně a pozvolna zvyšuje vždy po 4–7 dnech o 100 mg. Dospělí dostávají zpočátku 2- až 3krát denně 50 mg sultiamu. Léčba může být také zahájena udržovací dávkou. Udržovací dávka činí u dětí cca 5–10 mg/kg tělesné hmotnosti/den, u dospělých se podává cca 15 mg/kg tělesné hmotnosti/den. Po 5–6 dnech při výše uvedené dávce lze očekávat dosažení konstantní plazmatické hladiny. Terapeutická plazmatická koncentrace se pohybuje mezi 1,5 až 10 µg/ml.

Při dlouhodobé terapii se obvykle podávají následující střední denní dávky:

- děti do 2 let: 50 mg 2–3x denně,
- děti 3–6 let: 50–100 mg 2x denně,
- děti 7–10 let: 50–100 mg 3x denně,
- děti 11–14 let: 100–200 mg 3x denně,
- dospívající nad 14 let a dospělí: 200–400 mg 3x denně.

Denní dávka se kvůli krátkému biologickému poločasu sultiamu obvykle dělí na 2–3 jednotlivé dávky.

Způsob podání

Tablety se užívají nerozkousané a zapíjejí dostatečným množstvím tekutiny (nejméně 1/2 sklenkou vody).

Převedení z jiné medikace na sultiam nebo na kombinovanou terapii musí být pozvolné. O zahájení, délce léčby a jejím ukončení má v každém jednotlivém případě rozhodnout odborný lékař (neurolog, dětský neurolog).

Tato léková forma není určena k zahájení léčby, ani k užití u dětí, pokud jednotlivá dávka má být nižší než 100 mg.

4.3 Kontraindikace

Hypersensitivita na léčivou látku nebo na jiné sulfonamidy, nebo na kteroukoli pomocnou látku uvedenou v bodě 6.1

Dále se nesmí podávat pacientům s akutní porfýrií, s hyperthyreózou a s arteriální hypertenzí.

4.4 Zvláštní upozornění a opatření pro použití

Jen se zvláštní opatrností a při pečlivém zvážení rizik a prospěchu terapie lze podávat sultiam pacientům s poruchou renálních funkcí a s duševní poruchou v anamnéze.

Pacienty a jejich pečovatele je třeba upozornit, aby se při případném výskytu horečky, bolestí v krku, alergických kožních reakcí se zduřením mizních uzlin nebo s chřipkovými příznaky během léčby přípravkem Ospolot bezodkladně obrátili na lékaře. Pokud jsou klinické příznaky provázeny trombocytopenií nebo leukopenií, je na místě přerušení léčby. Při těžších alergických reakcích je nutné okamžité vysazení přípravku Ospolot. Léčbu je nutno přerušit také v případě trvalého vzestupu hodnot kreatininu.

Ospolot nemá být užíván během těhotenství a kojení, protože nejsou k dispozici dostatečné údaje o bezpečnosti pro vývoj plodu (viz bod 4.6).

Terapii přípravkem Ospolot má zahajovat zkušený dětský neurolog. Před nasazením sultiamu je nutno provést diferenciálně diagnostickou rozvahu k odlišení jiných forem epilepsií dětského věku.

Rolandické epilepsie kromě toho vykazují značný podíl spontánních remisí a vyznačují se většinou příznivým průběhem a prognózou i bez medikamentózní léčby.

Je vhodné pravidelně sledovat krevní obraz, jaterní enzymy a vyšetření moči, nejprve před nasazením terapie, dále v týdenních odstupech po dobu 1. měsíce léčby, poté v měsíčních intervalech; po půlroční léčbě postačují již kontroly jen 2–3x ročně.

Tento přípravek obsahuje laktózu. Pacienti se vzácnými dědičnými problémy s intolerancí galaktózy, úplným nedostatkem laktázy nebo malabsorpcí glukózy a galaktózy nemají tento přípravek užívat.

4.5 Interakce s jinými léčivými přípravky a jiné formy interakce

Při kombinované terapii sultiamu s fenytoinem může dojít k významnému zvýšení plazmatické hladiny fenytoinu. Tato kombinace vyžaduje proto zvláště pečlivé sledování s častými kontrolami plazmatických hladin, zejména pak při narušené funkci ledvin.

V některých případech bylo pozorováno při kombinaci s lamotriginem také zvýšení plazmatické hladiny lamotriginu. Je proto nutno častěji sledovat hladinu lamotriginu, zejména na počátku léčby.

Při kombinaci sultiamu s primidonem se může zvýšit intenzita nežádoucích účinků, zvláště u dětí se mohou objevit závratě, nejistota při chůzi a somnolence.

Současné podávání karbamazepinu může snižovat plazmatické hladiny sultiamu.

Během léčby sultiamem se pacienti mají vyhnout konzumaci alkoholických nápojů, protože sulfonamidy vykazují podobné účinky jako disulfiram, a sultiam, jako sulfonamidový derivát, může také působit obdobně. Příznaky interakce s alkoholem zahrnují většinou subjektivně nepříjemné systémové reakce, obvykle na bázi vasodilatace jako: pulzující bolest hlavy, nauzea, zvracení, dechový útlum, tachykardie, hypotenze, amblyopie, arytmie až šokové reakce, poruchy vědomí a záchvaty. Uvedené příznaky se mohou vyskytovat v různé intenzitě a trvání.

4.6 Fertilita, těhotenství a kojení

Riziko spojené s antiepileptiky obecně

Ženy ve fertilním věku mají konzultovat lékaře specialistu. V případě, že žena plánuje otěhotnět, je třeba přehodnotit potřebu antiepileptické léčby. Vzhledem k možnému výskytu záchvatů, které mohou mít závažné důsledky jak pro ženu, těhotenství a nenarozené dítě, je třeba se vyhnout náhlému přerušení antiepileptické léčby.

Riziko výskytu vrozených malformací se zvyšuje 2- až 3násobně u potomků matek užívajících v těhotenství antiepileptickou léčbu ve srovnání s očekávanou incidencí v normální populaci, která je přibližně 3 %. Mezi nejčastější malformace patří rozštěpy rtu, kardiovaskulární malformace a defekty neurální trubice.

Léčba kombinacemi antiepileptik je spojována s vyšším rizikem výskytu vrozených malformací než je tomu u monoterapie, a proto má být monoterapie použita, kdykoliv je to možné.

Vzhledem k nedostatku údajů se podávání přípravku Ospolot během těhotenství a kojení nedoporučuje.

4.7 Účinky na schopnost řídit a obsluhovat stroje

Přípravek může i při řádném a doporučeném užívání, zvláště na počátku léčby, ovlivnit do té míry pozornost a reakční schopnosti, že se může změnit schopnost aktivní účasti v silničním provozu, schopnost obsluhovat stroje a vykonávat další činnosti, vyžadující zvýšenou pozornost. Při současné konzumaci alkoholu to platí ve zvýšené míře.

4.8 Nežádoucí účinky

Četnost nežádoucích účinků je definována takto:

velmi časté ($\geq 1/10$), časté ($\geq 1/100$ až $< 1/10$), méně časté ($\geq 1/1\,000$ až $< 1/100$), vzácné ($\geq 1/10\,000$ až $< 1/1\,000$), velmi vzácné ($< 10\,000$), není známo (z dostupných údajů nelze určit).

Poruchy metabolismu a výživy

Vzácné: nechutenství a pokles tělesné hmotnosti

Psychiatrické poruchy

Méně časté: netečnost

Vzácné: halucinace, úzkost

Není známo: behaviorální anomálie (např. agresivita, podrážděnost, změny nálad), kognitivní porucha

Poruchy nervového systému

Méně časté: parestesie v pažích, nohou nebo v obličeji

Vzácné: závratě, bolest hlavy, myastenien, pohybové zpomalení

Není známo: generalizovaný tonicko-klonický záchvat (grand-mal), zvýšení četnosti záchvatů, polyneuritida

Srdeční poruchy

Není známo: tachykardie (výrazně závislá na dávce)

Respirační, hrudní a mediastinální poruchy

Časté: dyspnoe

Není známo: tachypnoe, hyperpnoe (obě výrazně závislé na dávce)

Gastrointestinální poruchy

Velmi časté: zažívací obtíže (nauzea, pocit plnosti a tlak v nadbříšku)

Poruchy jater a žlučových cest

Není známo: hepatotoxické reakce, zvýšení jaterních enzymů

Poruchy kůže a podkožní tkáně

Není známo: toxická epidermální nekrolýza, Stevensův-Johnsonův syndrom

Poruchy svalové a kosterní soustavy a pojivové tkáně

Vzácné: bolest kloubů

Poruchy ledvin a močových cest

Není známo: akutní renální selhání

V jednom případě se po podávání přípravku Ospolot vyskytla proгредиční slabost končetin s hypersalivací, setrhlou řečí a stupňující se somnolencí až s přechodem do bezvědomí. Po vysazení přípravku Ospolot příznaky během několika hodin ustoupily.

Hlášení podezření na nežádoucí účinky

Hlášení podezření na nežádoucí účinky po registraci léčivého přípravku je důležité. Umožňuje to pokračovat ve sledování poměru přínosů a rizik léčivého přípravku. Žádáme zdravotnické pracovníky, aby hlásili podezření na nežádoucí účinky na adresu:

Státní ústav pro kontrolu léčiv

Šrobárova 48

100 41 Praha 10

Webové stránky: www.sukl.cz/nahlasit-nezadouci-ucinek

4.9 Předávkování

Příznaky předávkování

Bolest hlavy, závratě, ataxie, poruchy vědomí, metabolická acidóza, močové krystaly. Sultiam se vyznačuje velmi nízkou toxicitou. Předávkování 4–5 g sultiamu pacienti přežili, dávka 20 g sultiamu, požitá v suicidiálním úmyslu, vedla u jednoho pacienta k úmrtí, v jiném případě však intoxikovaný přežil a došlo k úzdravě ad integrum.

Léčba předávkování

Specifické antidotum není známé. Při intoxikaci je na místě provést obvyklá opatření, t.j. výplach žaludku s podáním aktivního uhlí ke snížení resorbce a dále potřebná opatření k zajištění životních funkcí. K léčbě acidózy lze podat infuzně hydrogenuhličitan sodný. Aby se předešlo poškození ledvin močovými krystaly, je doporučitelná alkalizace moči a podpora diurézy.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: Antiepileptika, jiná antiepileptika.

ATC kód: N03AX03

Sultiam patří do skupiny inhibitorů karboanhydrázy a vykazuje výrazný účinek u experimentálně elektricky vyvolaných záchvatů (u myši a u potkanů) a u záchvatů experimentálně vyvolaných pentametylentetrazolem (u myši).

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Absorpce

Po perorálním podání se sultiam rychle a téměř úplně vstřebává, především v horních partiích tenkého střeva. Maximální plazmatické koncentrace byly naměřeny 1–5 hodin po podání. Při dávkách mezi 3 až 14,5 mg/kg tělesné hmotnosti bylo dosaženo plazmatické koncentrace od 0,5 do 14 µg/ml. Při střední terapeutické dávce okolo 9 mg/kg tělesné hmotnosti se dosahuje plazmatické koncentrace kolem 8 µg/ml (s rozpětím 3,3–17,6 µg/ml).

Distribuce

V plazmě se léčivá látka váže z cca 29 % na plazmatické bílkoviny.

Eliminace

Vylučování látky probíhá z 80–90 % močí, zbytek, t.j. 10–20 % se vylučuje biliární sekrecí do stolice. V průběhu 24 hodin bylo 32 % podané látky v nezměněné podobě vyloučeno ledvinami.

Linearita/nelinearita

Vyšetření biologické dostupnosti sultiamu nebylo dosud předloženo.

5.3 Předklinické údaje vztahující se k bezpečnosti

Akutní toxicita

Při jednorázovém podání je LD₅₀ u potkanů 5,0 g/kg tělesné hmotnosti, LD₅₀ u králíků je 1,0 g/kg tělesné hmotnosti per os. U koček a psů bylo po podání dávky 50 mg/kg tělesné hmotnosti pozorováno přechodné snížení chuti k jídlu a ochablost. Zvířata se však velmi rychle zotavila.

Chronická toxicita

Dlouhodobým experimentálním sledováním u různých druhů laboratorních zvířat (potkani, psi) nebyly zjištěny žádné známky toxických změn, způsobených podávanou látkou.

Kancerogenní a mutagenní potenciál

Ve třech různých *in vivo* a *in vitro* studiích nebyl zjištěn žádný mutagenní potenciál sultiamu. Dlouhodobé studie zaměřené na kancerogenitu nebyly provedeny.

Reprodukční toxicita

Toxický vliv sultiamu na reprodukci není dostatečně prozkoumaný. V jedné studii zaměřené na pozorování toxického vlivu na plody potkanů se při nižších zkoumaných dávkách (30 mg/kg/den) objevily embryotoxické vlivy. Studie zaměřené na poruchy fertility a vliv na peri- a postnatální vývoj potomstva chybějí. K dispozici nejsou žádné systematické údaje o podávání sultiamu během těhotenství a kojení u lidí.

6. FARMACEUTICKÉ ÚDAJE

6.1 Seznam pomocných látek

Kukuřičný škrob, monohydrát laktózy, mastek, koloidní bezvodý oxid křemičitý, želatina, magnesium-stearát, hypromelóza, makrogol 4000, oxid titaničitý.

6.2 Inkompatibility

Neuplatňuje se.

6.3 Doba použitelnosti

3 roky.

6.4 Zvláštní opatření pro uchovávání

Tento léčivý přípravek nevyžaduje žádné zvláštní podmínky uchovávání.

6.5 Druh obalu a obsah balení

Bílá PE lahvička s PP šroubovacím uzávěrem "twist-off" s dětskou pojistkou, krabička.

Velikosti balení: 50 a 250 potahovaných tablet

Na trhu nemusí být všechny velikosti balení.

6.6 Zvláštní opatření pro likvidaci přípravku

Žádné zvláštní požadavky.

Veškerý nepoužitý léčivý přípravek nebo odpad musí být zlikvidován v souladu s místními požadavky.

7. DRŽITEL ROZHODNUTÍ O REGISTRACI

DESITIN ARZNEIMITTEL GmbH

Weg beim Jäger 214

D-22335 Hamburg, Německo

8. REGISTRAČNÍ ČÍSLO

21/041/70-C

9. DATUM PRVNÍ REGISTRACE/PRODLOUŽENÍ REGISTRACE

Datum první registrace: 20.3.1970

Datum posledního prodloužení registrace: 5.12.2012

10. DATUM REVIZE TEXTU

15. 9. 2023