

VALMISTEYHTEENVETO

1. LÄÄKEVALMISTEEN NIMI

Toilax 2 mg/ml peräruiskesuspensio

2. VAIKUTTAVAT AINEET JA NIIDEN MÄÄRÄT

1 millilitra sisältää bisakodyyliä 2 mg.

Täydellinen apuaineluettelo, ks. kohta 6.1.

3. LÄÄKEMUOTO

Peräruiskesuspensio.

Harmaa, ohuena kerroksena läpikuultava, viskoosi suspensio.

4. KLIINISET TIEDOT

4.1 Käyttöaiheet

- Eri syistä johtuvan ummetuksen tilapäinen hoito
- Suolen tyhjentäminen ennen leikkausta ja paksusuolen alueen täyhystystutkimuksia sekä ennen suoliston, munuaisten, lantion ja lanneselän kuvantamistutkimuksia.

4.2 Annostus ja antotapa

Annostus

Alle 10-vuotiaiden lasten krooninen ummetus on hoidettava lääkärin ohjeiden mukaan. Bisakodyyliä ei saa käyttää alle 2-vuotiaille lapsille.

Vaikutus alkaa nopeasti, noin 5–20 minuutissa (ks. kohta 5.2).

Ummetuksen tilapäinen hoito:

Aikuiset ja yli 10-vuotiaat lapset

Yksi peräruiske (10 mg) vuorokaudessa tarvittaessa.

2–10-vuotiaat lapset

½ peräruisketta (5 mg) tarvittaessa.

Leikkaukseen tai tutkimukseen valmistelu

Käyttö vain lääkärin valvonnassa.

Aikuiset ja yli 10-vuotiaat lapset

2 tablettia (10 mg) aamulla ja 2 tablettia (10 mg) illalla leikkausta/tutkimusta edeltävänä päivänä sekä yksi peräruiske leikkaus-/tutkimusaamuna.

4–10-vuotiaat lapset:

Yksi tabletti (5 mg) illalla leikkausta/tutkimusta edeltävänä päivänä ja ½ peräruisketta (5 mg) leikkaus-/tutkimusaamuna.

Iäkkäät

Annostus sama kuin aikuisille. Joissakin tapauksissa ei pidä antaa enempää kuin ½ peräruisketta (5 mg).

Antotapa

Anna peräruiskeen lämmetä huoneenlämpöiseksi ennen käyttöä.

Kun peräruiske annetaan lapselle, tuubin kärkeä saa työntää vain puolet peräaukkoon. Toilax on tarkoitettu vain tilapäisen, lyhytkestoisen ummetuksen hoitoon (korkeintaan 7 päivää). Pitkäaikaiskäyttöä ei suositella.

4.3 Vasta-aiheet

- Yliherkkyys vaikuttavalle aineelle tai kohdassa 6.1 mainituille apuaineille
- Diagnosoimattomat kivuliaat vatsaoireet, jotka voivat johtua akuutista umpilisäkkeentulehduksesta ja/tai muut kiireellistä leikkausta vaativat tilat, kuten suolitukos tai akuutti tulehduksellinen suolistosairaus
- Ileus
- Vaikeat kuivumistilat, joissa on veden ja elektrolyyttien vajuus (hypokalemia)
- Peräruiske on kontraindisoitu anaalifissuurioissa, haavaisissa peräpukamissa ja haavaisessa proktiitissa, johon liittyy limakalvovaurioita

4.4 Varoitukset ja käyttöön liittyvät varotoimet

Jos laksatiiveja tarvitaan joka päivä, ummetuksen syy tulisi selvittää.

Liiallinen ja pitkittynyt käyttö on vaarallista ja voi aiheuttaa ripulin, kuivumistilan, hypokalemian, imeytymishäiriön ja enteropatian, joka aiheuttaa veren valkuaisaineiden menetystä ulosteisiin. Laksatiiviriippuvuuden ja kroonisen ummetuksen kehittyminen tai suoliston liikkeiden hidastuminen (ns. katarttinen koolon, johon voi liittyä velttoutta, laajentumia ja ulseratiivista koliittia tai proktiittia muistuttavia oireita) on myös mahdollista.

Pitkäaikainen ja päivittäinen käyttö voi aiheuttaa myös ummetuksen uusiutumisen.

Anaalifissuurioissa ja haavaisessa proktiitissa peräruiskeen käyttö voi aiheuttaa kipua ja perianaalista verenvuotoa.

Bisakodyylin on raportoitu aiheuttaneen heitehuimausta ja/tai pyörtymistä, joka voi johtua defekaatiosta tai vasovagaalisesta vasteesta ylävatsan kipuun.

Veriulosteita voi esiintyä. Runsas veriripuli voi viitata paksusuolen limakalvon iskemiaan.

4.5 Yhteisvaikutukset muiden lääkevalmisteiden kanssa sekä muut yhteisvaikutukset

Bisakodyylin samanaikainen käyttö suurina annoksina diureettien, sydänglykosidien tai adrenokortikosteroidien kanssa voi pahentaa elektrolyyttitasapainon häiriötä.

Bisakodyyli lisää ohutsuolen motiliteettia ja voi muuttaa joidenkin ohutsuoletta imeytyvien lääkeaineiden (kuten digoksiinin ja säädellysti lääkeainetta vapauttavien valmisteiden) biologista

hyötyosuutta.

4.6 Hedelmällisyys, raskaus ja imetys

Vaikka raskaudenaikaisessa käytössä ei ole havaittu teratogeenisiä vaikutuksia, bisakodyylin käyttöä raskauden aikana tulee harkita tarkasti.

Bisakodyyli erittyy ihmisen rintamaitoon, joten bisakodyylin käyttöä imetyksen aikana tulee harkita tarkasti.

4.7 Vaikutus ajokykyyn ja koneiden käyttökykyyn

Bisakodyylin vaikutusta ajokykyyn ja koneiden käyttökykyyn ei ole tutkittu.

Bisakodyylin on raportoitu aiheuttaneen heitehuimausta ja pyörtymistä. Jos potilailla ilmenee heitehuimausta, heidän on vältettävä mahdollisesti vaarallisia toimintoja, kuten ajamista ja koneiden käyttöä.

4.8 Haittavaikutukset

Haittavaikutusten yleisyysluokat on määritelty seuraavasti:

Hyvin yleinen ($\geq 1/10$)

Yleinen ($\geq 1/100$, $< 1/10$)

Melko harvinainen ($\geq 1/1\ 000$, $< 1/100$)

Harvinainen ($\geq 1/10\ 000$, $< 1/1\ 000$)

Hyvin harvinainen ($< 1/10\ 000$), tuntematon (koska saatavissa oleva tieto ei riitä esiintyvyyden arviointiin)

	Yleiset	Melko harvinaiset	Harvinaiset	Tuntemattomat
Immuunijärjestelmä			Yliherkkyysoireet, kuten urtikaria, angioedeema ja anafylaktiset reaktiot	
Hermosto				Heitehuimaus, pyörtyminen
Ruoansulatuselimistö	Vatsakipu, pahoinvointi, ripuli	Paikallisärsytys, kipu ja verenvuoto peräruiskeen annon yhteydessä	Oksentelu	Veriulosteet, koliitti, iskeeminen koliitti

Epäillyistä haittavaikutuksista ilmoittaminen

On tärkeää ilmoittaa myyntiluvan myöntämisen jälkeisistä lääkevalmisteen epäillyistä haittavaikutuksista. Se mahdollistaa lääkevalmisteen hyöty-haitta-tasapainon jatkuvan arvioinnin. Terveystieteiden ammattilaisia pyydetään ilmoittamaan kaikista epäillyistä haittavaikutuksista seuraavalle taholle:

www-sivusto: www.fimea.fi

Lääkealan turvallisuus- ja kehittämiskeskus Fimea

Lääkkeiden haittavaikutusrekisteri

PL 55

00034 FIMEA

4.9 Yliannostus

Oireet

Yliannostus voi aiheuttaa vetisiä ulosteita (ripulia) ja vatsakipua. Myös kliinisesti merkittäviä elektrolyyttitasapainon häiriöitä, kuten kaliumin ja muiden elektrolyyttien vajetta, sekä näihin liittyvää lihasheikkoutta ja EKG-muutoksia voi kehittyä.

Kroonisen yliannostelun on raportoitu aiheuttavan sekundaarista hyperaldosteronismia ja munuaiskiviä. Kroonisesta väärinkäytöstä johtuvan hypokalemian on raportoitu aiheuttavan myös munuaistubulusten vaurioita, metabolista alkaloosia, lihasheikkoutta ja EKG-muutoksia.

Hoito

Hoitona on asianmukainen nesteytys ja elektrolyyttivajeen korjaaminen. Tämä on erityisen tärkeää iäkkäillä ja nuorilla. Spasmolyttien antamisesta voi olla hyötyä.

5. FARMAKOLOGISET OMINAISUUDET

5.1 Farmakodynamiikka

Farmakoterapeuttinen ryhmä: ummetuslääkkeet, peräruiskeet, ATC-koodi: A06AG02.

Bisakodyyli on paikallisesti vaikuttava triaryylimetaaniryhmän laksatiivi, joka hydrolysoituaan stimuloi paksusuolen limakalvoa ja voimistaa sen peristaltiikkaa. Bisakodyyli vähentää elektrolyyttien ja veden imeytymistä suolesta inhiboimalla todennäköisesti enterosyyttien Na/K-ATP-aasia.

5.2 Farmakokinetiikka

Bisakodyylin hydrolysoituessa suoliston limakalvoentsyymien vaikutuksesta muodostuu deasetyylibisakodyyliä, joka imeytyy ja erittyy osittain virtsaan sekä sappeen glukuronidina. Vaikuttava aine, vapaa difenoli, muodostuu paksusuolen bakteerien vaikutuksesta. Bisakodyylicalvasteet, jotka ovat resistenttejä mahahapolle ja ohutsuolinsteelle, etenevät imeytymättä paksusuoleen ja ohittavat siten enterohepaattisen kierron. Niinpä näiden valmisteiden vaikutus alkaa 6–12 tunnissa. Bisakodyyli-peräruiskeet ovat nopeavaikutteisia, vaikutus alkaa 5–20 minuutissa, joskin joissakin tapauksissa 5–60 minuutissa. Vaikutuksen alkaminen määräytyy vaikuttavan aineen vapautumisella valmisteesta. Laksatiivivaikutuksen ja plasman aktiivisen difenolin pitoisuuksien välillä ei ole yhteyttä.

5.3 Prekliiniset tiedot turvallisuudesta

Bisakodyylin toksisuutta ei ole tutkittu deskriptiivisissä eläintoksisuuskoeksissa. Eläimillä kroonisen bisakodyylihoidon on todettu aiheuttavan suolen epiteelisolujen proliferaatiota. Annosteltaessa bisakodyyliä rotille 32 viikon ajan 0,3 % konsentraatiolla ravinnon mukana bisakodyyli on aiheuttanut virtsatiekivien muodostumista ja epiteeliproliferatiivisia virtsarakkovaurioita.

6. FARMASEUTTISET TIEDOT

6.1 Apuaineet

Makrogoli
Sitruunahappomonohydraatti
Natriumsitraatti
Puhdistettu vesi

6.2 Yhteensopimattomuudet

Ei oleellinen.

6.3 Kestoaika

2 vuotta

6.4 Säilytys

Säilytä jääkaapissa (2–8 °C).

6.5 Pakkaustyyppi ja pakkauskoot

Keltainen pitkäkärkinen LD-muoviputkilo.

Pakkauskoot: 5 x 5 ml ja 50 x 5 ml.

6.6 Erityiset varotoimet hävittämiselle ja muut käsittelyohjeet

Peräruiske annetaan seuraavasti:

1. Ravista tuubia.
 2. Poista tuubin kärjessä oleva kolmio.
 3. Työnnä kärki kokonaisuudessaan peräaukkoon.
 4. Purista tuubi tyhjäksi.
 5. Vedä kärki ulos pitäen tuubi kokoonpainettuna.
- Vaikutus alkaa yleensä 15–30 minuutin kuluessa.

7. MYYNTILUVAN HALTIJA

Orion Corporation

Orionintie 1

02200 Espoo

8. MYYNTILUVAN NUMERO

6038

9. MYYNTILUVAN MYÖNTÄMISPÄIVÄMÄÄRÄ/UUDISTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ

Myyntiluvan myöntämisen päivämäärä: 13. toukokuuta 1970

Viimeisimmän uudistamisen päivämäärä: 18. marraskuuta 2008

10. TEKSTIN MUUTTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ

31.5.2022

PRODUKTRESUMÉ

1. LÄKEMEDLETS NAMN

Toilax 2 mg/ml rektalsuspension

2. KVALITATIV OCH KVANTITATIV SAMMANSÄTTNING

1 milliliter innehåller 2 mg bisakodyl.

För fullständig förteckning över hjälpämnen, se avsnitt 6.1.

3. LÄKEMEDELSFORM

Rektalsuspension.

Grå, transparent som tunt lager, viskös suspension.

4. KLINISKA UPPGIFTER

4.1 Terapeutiska indikationer

- Tillfällig behandling av förstoppning av olika orsaker
- Tarmtömning innan operation och koloskopi samt innan röntgenundersökningar av tarmkanalen, njurarna, bäckenet och ländryggen.

4.2 Dosering och administreringsätt

Dosering

Behandling av kronisk förstoppning hos barn under 10 år ska ske enligt läkarens instruktioner. Bisakodyl får inte användas hos barn under 2 år.

Effekten börjar snabbt, inom ca 5–20 minuter (se avsnitt 5.2).

Tillfällig behandling av förstoppning:

Vuxna och barn över 10 år

En tub rektalsuspension (10 mg) per dygn vid behov.

2–10-åriga barn

½ tub rektalsuspension (5 mg) vid behov.

Förberedning inför operation eller undersökning

Användning endast under läkarens uppsyn.

Vuxna och barn över 10 år

2 tabletter (10 mg) på morgonen och 2 tabletter (10 mg) på kvällen dagen innan operationen/undersökningen samt en tub rektalsuspension på morgonen då

operationen/undersökningen sker.

4–10-åriga barn:

En tablett (5 mg) på kvällen dagen innan operationen/undersökningen och ½ tub rektalsuspension (5 mg) på morgonen då operationen/undersökningen sker.

Äldre patienter

Doseringen är samma som för vuxna. I vissa fall får man inte ge mera än ½ tub rektalsuspension (5 mg).

Administreringssätt

Låt rektalsuspensionen bli rumstempererad innan användning.

När rektalsuspensionen administreras till barn får endast hälften av tubens spets införas i ändtarmsmynningen. Toilax är endast indicerat för behandling av tillfällig, kortvarig förstoppning (högst 7 dagar). Långvarig användning rekommenderas inte.

4.3 Kontraindikationer

- Överkänslighet mot den aktiva substansen eller mot något hjälpämne som anges i avsnitt 6.1
- Odiagnostiserade smärtsamma magsymptom som kan orsakas av akut appendicit och/eller andra tillstånd som kräver brådskande operation, såsom tarmobstruktion eller akut inflammatorisk tarmsjukdom
- Ileus
- Svår uttorkning med vatten- och elektrolytbrist (hypokalemi)
- Rektalsuspensionen är kontraindicerad vid analfissurer, såriga hemorrojder och vid ulcerös proktit med slemhinneskador

4.4 Varningar och försiktighet

Om laxermedel behövs dagligen ska orsaken till förstoppningen utredas.

Överdriven och förlängd användning är farligt och kan orsaka diarré, uttorkning, hypokalemi, malabsorption och enteropati, som orsakar förlust av blodets proteiner i avföringen. Utveckling av laxermedelberoende och kronisk förstoppning eller fördröjning av tarmmotiliteten (s.k. katartisk kolon associerad med slöhet, dilatationer och symptom som liknar ulcerös kolit eller proktit) är också möjligt.

Långvarig och daglig användning kan även orsaka förnyad förstoppning.

Vid analfissurer och ulcerös proktit kan användning av rektalsuspension orsaka smärta och perianal blödning.

Bisakodyl har rapporterats orsaka svindel och/eller synkope som kan bero på defekation eller vasovagalt svar på övre buksmärta.

Blodig avföring kan förekomma. Riklig melena kan tyda på ischemi i tjocktarmens slemhinna.

4.5 Interaktioner med andra läkemedel och övriga interaktioner

Samtidig användning av bisakodyl i höga doser tillsammans med diuretika, hjärtglykosider eller adrenokortikosteroider kan förvärra störningar i elektrolytbalansen.

Bisakodyl ökar motiliteten i tunntarmen och kan förändra biotillgängligheten av vissa läkemedel som

absorberas i tunntarmen (såsom digoxin och läkemedel med modifierad frisättning).

4.6 Fertilitet, graviditet och amning

Trots att inga teratogena effekter upptäckts vid användning under graviditet, ska användning av bisakodyl under graviditet övervägas noggrant.

Bisakodyl utsöndras i bröstmjolk hos människa, varvid användning av bisakodyl under amning ska övervägas noggrant.

4.7 Effekter på förmågan att framföra fordon och använda maskiner

Effekten av bisakodyl på förmågan att framföra fordon och använda maskiner har inte undersökts.

Bisakodyl har rapporterats orsaka svindel och synkope. Om patienterna uppvisar svindel ska de undvika eventuellt farliga aktiviteter, såsom bilkörning och användning av maskiner.

4.8 Biverkningar

Biverkningarnas frekvensklasser är definierade enligt följande:

Mycket vanliga ($\geq 1/10$)

Vanliga ($\geq 1/100$, $< 1/10$)

Mindre vanliga ($\geq 1/1\ 000$, $< 1/100$)

Sällsynta ($\geq 1/10\ 000$, $< 1/1\ 000$)

Mycket sällsynta ($< 1/10\ 000$), ingen känd frekvens (kan inte beräknas från tillgängliga data)

	Vanliga	Mindre vanliga	Sällsynta	Ingen känd frekvens
Immunsystemet			Överkänslighetsreaktioner, såsom urtikaria, angioödem och anafylaktiska reaktioner	
Centrala och perifera nervsystemet				Svindel, svimning
Magtarmkanalen	Magsmärta, illamående, diarré	Lokal irritation, smärta och blödning vid administrering av rektalsuspensionen	Kräkningar	Blodig avföring, kolit, ischemisk kolit

Rapportering av misstänkta biverkningar

Det är viktigt att rapportera misstänkta biverkningar efter att läkemedlet godkänts. Det gör det möjligt att kontinuerligt övervaka läkemedlets nytta-riskförhållande. Hälso- och sjukvårdspersonal uppmanas att rapportera varje misstänkt biverkning till:

webbplats: www.fimea.fi

Säkerhets- och utvecklingscentret för läkemedelsområdet Fimea

Biverkningsregistret

PB 55

00034 FIMEA

4.9 Överdoser

Symptom

Överdoseringen kan orsaka lös avföring (diarré) och magsmärtor. Även kliniskt signifikanta störningar i elektrolytbalansen, såsom brist på kalium och andra elektrolyter, samt associerad muskelsvaghet och EKG-förändringar kan utvecklas.

Kronisk överdosering har rapporterats orsaka sekundär hyperaldosteronism och njurstenar. Hypokalemi orsakad av kroniskt missbruk har även rapporterats orsaka skador i njurtubuli, metabolisk alkalos, muskelsvaghet och EKG-förändringar.

Behandling

Behandlingen sker genom lämplig rehydrering och korrigerande av elektrolytbristen. Detta är särskilt viktigt hos äldre personer och hos unga. Administrering av spasmolytika kan vara till nytta.

5. FARMAKOLOGISKA EGENSKAPER

5.1 Farmakodynamiska egenskaper

Farmakoterapeutisk grupp: medel vid förstoppning, klymsma, ATC-kod: A06AG02.

Bisakodyl är ett lokalt verkande laxermedel tillhörande triarylmetylgruppen, som genom hydrolys stimulerar slemhinnan i tjocktarmen och förstärker dess peristaltik. Bisakodyl minskar absorptionen av elektrolyter och vatten från tarmen troligtvis genom att inhibera enterocyternas Na/K-ATPaser.

5.2 Farmakokinetiska egenskaper

Då bisakodyl hydrolyseras av enzymer i tarmslemhinnan bildas deacetylbisakodyl som absorberas och utsöndras delvis i urinen och i gallan som glukuronid. Den aktiva substansen, fritt difenol, bildas av tjocktarmens bakterier. Bisakodylpreparat som är resistent mot magsyror och tarmsaft, framskrider utan att absorberas till tjocktarmen och passerar därmed det enterohepatiska kretsloppet. Därmed inträffar effekten av dessa preparat inom 6–12 timmar. Rektalsuspensioner med bisakodyl är snabbverkande, effekten börjar inom 5–20 minuter, i vissa fall inom 5–60 minuter. Effektens inträffande bestäms enligt frigörelsen av den aktiva substansen från preparatet. Det finns inget samband mellan den laxerande effekten och plasmakoncentrationen av aktivt difenol.

5.3 Prekliniska säkerhetsuppgifter

Toxiciteten av bisakodyl har inte studerats i deskriptiva djurtoxicitetsprövningar. Hos djur har en kronisk bisakodylbehandling visats orsaka proliferation av tarmens epitelceller. Vid administrering av bisakodyl till råttor under 32 veckor med en koncentration på 0,3 % tillsammans med föda har bisakodyl orsakat bildning av urinstenar och epitelproliferativa urinblåseskador.

6. FARMACEUTISKA UPPGIFTER

6.1 Förteckning över hjälpämnen

Makrogol
Citronsyramonohydrat
Natriumcitrat
Vatten, renat

6.2 Inkompatibiliteter

Ej relevant.

6.3 Hållbarhet

2 år

6.4 Särskilda förvaringsanvisningar

Förvaras i kylskåp (2–8 °C).

6.5 Förpackningstyp och innehåll

Gult, långspetsat LD-plaströr.

Förpackningsstorlekar: 5 x 5 ml och 50 x 5 ml.

6.6 Särskilda anvisningar för destruktion och övrig hantering

Rektalsuspensionen ges enligt följande:

1. Omskaka tuben.
 2. Ta bort triangeln från tubspetsen.
 3. För in hela spetsen i ändtarmen.
 4. Krama tuben tom.
 5. Dra ut spetsen medan du fortfarande kramar tuben.
- Effekten börjar vanligen verka inom 15–30 minuter.

7. INNEHAVARE AV GODKÄNNANDE FÖR FÖRSÄLJNING

Orion Corporation
Orionvägen 1
FI-02200 Esbo
Finland

8. NUMMER PÅ GODKÄNNANDE FÖR FÖRSÄLJNING

6038

9. DATUM FÖR FÖRSTA GODKÄNNANDE/FÖRNYAT GODKÄNNANDE

Datum för det första godkännandet: 13 maj 1970

Datum för den senaste förnyelsen: 18 november 2008

10. DATUM FÖR ÖVERSYN AV PRODUKTRESUMÉN

31.5.2022