

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

K léčbě epilepsie s centrotemporálními hroty SeLECTS (*Self-Limited Epilepsy with Centrotemporal Spikes*) (dříve rolandická epilepsie) u dětí a dospívajících ve věku od 3 let, kteří nereagují na jinou léčbu/netolerují ji, nebo u nich nejsou jiné terapeutické alternativy.

4.2 Dávkování a způsob podání

Léčbu přípravkem Ospolot má zahajovat, provádět a sledovat lékař se zkušenostmi s léčbou epilepsie.

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.

Délka léčby

Léčba přípravkem Ospolot se nemá ukončovat náhle. O délce léčby a jejím ukončení má rozhodnout individuálně u každého pacienta dětský neurolog se zkušenostmi s léčbou epilepsie.

Pokud léčba není úspěšná, má být léčba sultiamem přibližně po jednom až dvou měsících ukončena.

Pacienti s poruchou funkce ledvin

Použití u pacientů s poruchou funkce ledvin nebylo hodnoceno. U pacientů s poruchou funkce ledvin je třeba postupovat s opatrností a může být vyžadována pomalejší titrace. Vzhledem k tomu, že sultiam a jeho metabolity se vylučují ledvinami, je třeba léčbu ukončit u pacientů, u kterých se rozvine selhání ledvin nebo u kterých je pozorováno klinicky významné setrvalé zvýšení sérového kreatininu.

Pacienti s poruchou funkce jater

Použití u pacientů s poruchou funkce jater nebylo hodnoceno, proto se použití u pacientů s těžkou poruchou funkce jater nedoporučuje. U pacientů s lehkou až středně těžkou poruchou funkce jater je třeba postupovat s opatrností a může být vyžadována pomalejší titrace přípravku Ospolot.

Způsob podání

Tablety se užívají nerozkousané a zapíjejí dostatečným množstvím tekutiny (nejméně 1/2 sklenice 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

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

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

4.4 Zvláštní upozornění a opatření pro použití

Přípravek Ospolot nemá být podáván nebo má být podáván pouze se zvláštní opatrností

- u pacientů s poruchou funkce ledvin
- u pacientů s psychiatrickými poruchami v anamnéze.

Laboratorní sledování

Před zahájením léčby přípravkem Ospolot, v prvním měsíci léčby v týdenních intervalech a poté v měsíčních intervalech se doporučuje sledovat krevní obraz, jaterní enzymy a parametry funkce ledvin. Po šesti měsících léčby stačí dvě až čtyři kontroly ročně.

Poznámka:

Pokud dojde k trvalému zvýšení kreatininu, má být léčba přerušena.

Hypersenzitivní reakce:

Pacient, resp. rodiče pacienta mají být poučeni, aby se v případě výskytu horečky, bolesti v krku, alergických kožních reakcí s otokem lymfatických uzlin a/nebo příznaků podobných chřipce během léčby přípravkem Ospolot okamžitě obrátili na ošetřujícího lékaře. V případě závažných alergických reakcí je nutné léčbu přípravkem Ospolot okamžitě přerušit.

Progresivní trombocytopenie nebo leukopenie doprovázené klinickými příznaky vyžadují přerušeni léčby přípravkem Ospolot.

Sebevražedné myšlenky a chování

Během léčby antiepileptiky v různých indikacích byly u některých pacientů hlášeny případy sebevražedných myšlenek a chování. Metaanalýza randomizovaných, placebem kontrolovaných klinických studií antiepileptik rovněž prokázala mírně zvýšené riziko sebevražedných myšlenek a

chování. Mechanismus vzniku není znám a dostupné údaje nevyklučují možnost zvýšeného rizika u sultiamu.

Proto u pacientů mají být sledovány příznaky sebevražedných myšlenek a chování a zvažena vhodná léčba. Pacienti (a jejich pečovatelé) mají být upozorněni na to, že v případě výskytu příznaků sebevražedných myšlenek či chování mají vyhledat lékařskou pomoc.

Pomocné látky

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

Vliv jiných léčivých přípravků na sultiam

Primidon

Pokud se sultiam kombinuje s primidonem, může se zvýšit intenzita nežádoucích účinků sultiamu; zejména u dětí se mohou objevit závratě, nestabilní chůze a somnolence.

Karbamazepin

Existují náznaky, že při současném užívání karbamazepinu může dojít ke snížení sérových hladin sultiamu.

Vliv sultiamu na jiné léčivé přípravky

Fenytoin

Pokud se sultiam kombinuje s fenytoinem, může dojít k výraznému zvýšení plazmatických hladin fenytoinu. Tato kombinace vyžaduje zvláště přísné sledování a časté kontroly plazmatických hladin fenytoinu, zejména v případě poruchy funkce ledvin.

Lamotrigin

V kombinaci s lamotriginem bylo v jednotlivých případech také pozorováno zvýšení hladin lamotriginu v krvi. Proto se na začátku takové léčby mají hladiny lamotriginu kontrolovat častěji.

Inhibitory karboanhydrázy

Současné užívání sultiamu a jiných inhibitorů karboanhydrázy (např. topiramátu, acetazolamidu) může zvýšit riziko nežádoucích účinků v důsledku inhibice karboanhydrázy (viz také bod 4.8).

Alkohol

Během léčby sultiamem se má pacient zdržet konzumace alkoholu. Sultiam jako derivát sulfonamidu může teoreticky mít podobný účinek jako disulfiram. Mezi tyto příznaky patří velmi nepříjemná, avšak obvykle samovolně odeznívající systémová reakce způsobená vazodilatací, která se projevuje pulzujícími bolestmi hlavy, respirační depresí, nauceou, zvracením, tachykardií, hypotenzí, amblyopií, zmateností, šokovými reakcemi, arytmiemi, ztrátou vědomí a epileptickými záchvaty. Stupeň a trvání těchto příznaků se mohou značně lišit.

4.6 Fertilita, těhotenství a kojení

Těhotenství

Údaje o použití sultiamu u těhotných žen nejsou k dispozici nebo jsou omezené. Studie na zvířatech jsou z hlediska reprodukční toxicity nedostatečné, ale odhalily embryotoxické účinky (viz bod 5.3).

Podávání antiepileptik během těhotenství je obecně spojeno se zvýšeným rizikem malformací, které se může zvýšit při kombinaci různých antiepileptik. Proto se přípravek Ospolot nedoporučuje během těhotenství a u žen ve fertilním věku, které nepoužívají antikoncepci.

V případě těhotenství má být podávána nejnižší dávka přípravku Ospolot dostatečná ke kontrole záchvatů, pokud možno jako monoterapie. Doporučují se prenatální diagnostická opatření pro včasné

odhalení malformací (ultrazvuk s vysokým rozlišením a stanovení alfa-fetoproteinu). V žádném případě nemá být léčba antiepileptiky přerušena bez souhlasu lékaře, protože nekontrolované záchvaty mohou mít závažné důsledky pro matku i nenarozené dítě.

Kojení

Není známo, zda se sultiam/metabolity vylučují do lidského mateřského mléka. Riziko pro novorozence/kojené děti nelze vyloučit. Přípravek Ospolot se nemá používat v období kojení.

Fertilita

Údaje o účincích sultiamu na fertilitu nejsou k dispozici žádné údaje.

4.7 Účinky na schopnost řídit a obsluhovat stroje

Tento léčivý přípravek může i při správném používání ovlivnit (zejména na začátku léčby) reakce natolik, že může dojít k narušení schopnosti řídit dopravní prostředky nebo obsluhovat stroje. To platí ve zvýšené míře při současné konzumaci alkoholu (viz bod 4.5 Alkohol).

4.8 Nežádoucí účinky

Pro hodnocení nežádoucích účinků se používají následující kategorie četnosti:

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

Časté: nechutenství a pokles tělesné hmotnosti

Psychiatrické poruchy

Méně časté: halucinace, úzkost, nedostatek energie

Není známo: depresivní nálada/deprese, změny osobnosti a abnormální chování (např. agresivita, podrážděnost, výkyvy nálady), kognitivní porucha

Poruchy nervového systému

Časté: parestázie v končetinách a obličejí*, závratě, bolest hlavy

Méně časté: myastenické příznaky, generalizovaný konvulzivní status epilepticus, zvýšení četnosti záchvatů

Není známo: polyneuritida

Poruchy oka

Časté: dvojité vidění

Není známo: postižení zraku, které může být závažné

Srdeční poruchy

Časté: stenokardie, tachykardie

Respirační, hrudní a mediastinální poruchy

Časté: tachypnoe*, hyperpnoe*, dyspnoe, singultus

Gastrointestinální poruchy

Velmi časté: zažívací obtíže jako např. nauzea, zvracení (přibližně u 10 % pacientů)

Není známo: průjem

Poruchy jater a žlučových cest

Není známo: hepatotoxické reakce, zvýšení jaterních enzymů

Poruchy kůže a podkožní tkáň

Není známo: Stevensův-Johnsonův syndrom, TEN (toxická epidermální nekrolýza)

Poruchy svalové a kosterní soustavy a pojivové tkáň

Méně časté: bolest kloubů

Poruchy ledvin a močových cest

Není známo: akutní renální selhání

*Závislé na dávce, v případě potřeby je nutné dávku upravit.

U jednoho pacienta s dlouhotrvající refrakterní epilepsií se objevila progresivní slabost končetin, hypersalivace, nezřetelná řeč a narůstající somnolence až kóma. Tyto příznaky vymizely během několika hodin po vysazení sultiamu.

Sultiam je inhibítorem karboanhydrázy. Proto se při podávání sultiamu mohou vyskytnout nežádoucí účinky související s inhibicí karboanhydrázy, jako je tvorba ledvinových kamenů, metabolická acidóza, únava/vyčerpání, hemodiluce a změny hodnot elektrolytů v séru (např. hypokalcemie) (viz také bod 4.5).

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 intoxikace

Bolest hlavy, závratě, ataxie, poruchy vědomí, metabolická acidóza, krystaly v moči. 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 úzdavě *ad integrum*.

Léčba předávkování

Specifické antidotum není známé. Je třeba přijmout standardní opatření (výplach žaludku a podání aktivního uhlí) k minimalizaci absorpce a zachování vitálních funkcí. K léčbě acidózy lze podat infuzi hydrogenuhličitanu sodného. K prevenci poškození ledvin a krystalurie se doporučuje alkalizující diuretická terapie.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: Jiná antiepileptika.

ATC kód: N03AX03

Sultiam patří do skupiny inhibitorů karboanhydrázy a vykazuje antikonvulzivní účinek u experimentálně elektricky vyvolaných záchvatů (u myši a u potkanů) a u záchvatů experimentálně vyvolaných pentametylentetrazolem (u myši). Existuje málo důkazů z kontrolovaných klinických hodnocení ohledně účinnosti a bezpečnosti tohoto léčivého přípravku. Sultiam je derivát sulfonamidu a přesný mechanismus jeho účinku není znám.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Farmakokinetika sultiamu nebyla u různých věkových kategorií dětí a dospívajících systematicky zkoumána.

Absorpce

Po perorálním podání se sultiam rychle a úplně vstřebává, převážně v horní části tenkého střeva. Maximální plazmatické koncentrace jsou naměřeny po 1 až 5 hodinách.

Ve farmakokinetické studii s jednou dávkou u 16 probandů byl zkoumán vliv příjmu potravy na absorpci potahovaných tablet přípravku Ospolot 200 mg. Výsledky ukazují, že podávání přípravku Ospolot s jídlem vede k mírně snížené biologické dostupnosti sultiamu. Vzhledem k tomu, že dávka je titrována individuálně, není tento vliv považován za relevantní (viz bod 4.2).

Distribuce

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

Eliminace

80 až 90 % se vylučuje močí a 10 až 20 % stolicí po sekreci do žluči. Během 24 hodin se 32 % podané dávky vylučuje v nezměněné formě ledvinami. V farmakokinetické studii s jednou dávkou u 16 zdravých dospělých probandů byl stanoven poločas přibližně 12 hodin. Na základě publikovaných farmakokinetických studií se u dětí předpokládá kratší poločas.

5.3 Předklinické údaje vztahující se k bezpečnosti

Neklinické údaje získané na základě konvenčních farmakologických studií toxicity po opakovaném podávání neodhalily žádné zvláštní riziko pro člověka.

Mutagení a kancerogenní potenciál

Sultiam nevykazoval žádný mutagení potenciál *in vitro* ani *in vivo*. Dlouhodobé studie kancerogenity nebyly provedeny.

Reprodukční toxicita

Reprodukční toxicita sultiamu nebyla dostatečně zkoumána. Ve studii embryotoxicity na potkanech byly embryotoxické účinky zaznamenány při nejnižší testované dávce (30 mg/kg/den). Studie týkající se vlivu na fertilitu a peri- a postnatální vývoj potomstva chybí.

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

29. 10. 2025