

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

Бускопан[®]

(Buscopan[®])

Склад:

діюча речовина: гіосцину бутилбромід;

1 мл містить гіосцину бутилброміду 20 мг;

допоміжні речовини: натрію хлорид, вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: безбарвний або майже безбарвний розчин, вільний від видимих часток.

Фармакотерапевтична група. Засоби для лікування функціональних розладів травного тракту. Напівсинтетичні алкалоїди красавки (беладони), четвертинні амонійні сполуки.

Код АТХ А03В В01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Гіосцину бутилбромід, який є діючою речовиною препарату Бускопан[®], є напівсинтетичною похідною скополаміну — природної речовини рослинного походження. Гіосцину бутилбромід чинить спазмолітичну дію на гладкі м'язи шлунково-кишкового тракту, жовчних шляхів та сечостатевої системи. Як четвертинна амонієва похідна гіосцину бутилбромід не проникає у центральну нервову систему. Периферичні антихолінергічні ефекти обумовлені гангліоблокуючою дією на стінках внутрішніх органів, а також антиму斯卡риновою активністю. Він пригнічує секрецію бронхіального секрету, слини та поту, а у високих дозах — також секрецію соляної кислоти в шлунку. Він також спричиняє циклоплегію.

Фармакокінетика.

Абсорбція та розподіл

Після внутрішньовенного застосування гіосцину бутилбромід швидко розподіляється ($t_{1/2a} = 4$ хв, $t_{1/2b} = 29$ хв) у тканинах. Об'єм розподілу (V_{ss}) становить 128 л (що відповідає приблизно 1,7 л/кг). Через високу спорідненість з мускариновими та нікотиновими рецепторами гіосцину бутилбромід розподіляється головним чином у м'язових клітинах абдомінальної та тазової ділянки, а також в інтрамуральних гангліях органів черевної порожнини. Зв'язування гіосцину бутилброміду з білками плазми крові (альбуміном) становить приблизно 4,4 %. У дослідженнях на тваринах було показано, що гіосцину бутилбромід не проникає через гематоенцефалічний бар'єр, хоча наразі відсутні які-небудь клінічні дані щодо цього ефекту.

Дослідження *in vitro* показали, що гіосцину бутилбромід (1мМ) взаємодіє з системою транспорту холіну (1,4 нМ) в епітеліальних клітинах плаценти людини.

Метаболізм та виведення

Основний метаболічний шлях - це гідроліз ефірних зв'язків. Кінцевий період напіввиведення ($t_{1/2g}$) становить приблизно 5 годин. Загальний кліренс - 1,2 л/хв. Клінічні дослідження з радіоактивно міченим гіосцину бутилбромідом показали, що після внутрішньовенної ін'єкції 42-61 % радіоактивної дози виводиться нирками, а 28,3-37 % - секретується у жовч і у подальшому виводиться з калом. З огляду на низький рівень абсорбції у кишечнику, малоймовірно, щоб гіосцину бутилбромід зазнавав значної ентоерогепатичної рециркуляції.

Приблизно 50 % незміненої діючої речовини виводиться з сечею. Метаболіти, що виводяться нирками, погано зв'язуються з мускариновими рецепторами, і тому вважається, що вони не мають такої дії, як гіосцину бутилбромід.

Клінічні характеристики.

Показання. Для лікування спазмів шлунково-кишкового тракту, жовчовивідних шляхів, нижніх сечовивідних шляхів та жіночих статевих органів. Застосовують як допоміжний засіб при ендоскопічних дослідженнях і для функціональної діагностики при дослідженнях шлунково-кишкового тракту.

Протипоказання. Бускопан® протипоказаний у таких випадках:

- підвищена чутливість до гіосцину бутилброміду або будь-якого іншого компонента препарату;
- нелікована закритокутова глаукома;
- затримка виведення сечі у зв'язку з інфравезикальною обструкцією (наприклад, доброякісна гіперплазія передміхурової залози);
- механічний стеноз шлунково-кишкового тракту;
- паралітична чи обструктивна кишкова непрохідність;

- тахікардія і тахіаритмія;
- мегаколон;
- міастенія гравіс.

Протипоказано застосування препарату Бускопан® шляхом внутрішньом'язових ін'єкцій пацієнтам, які отримують антикоагулянти, через можливе утворення внутрішньом'язової гематоми. Цій категорії пацієнтів препарат вводять підшкірно або внутрішньовенно.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. Бускопан® може підсилювати антихолінергічну дію таких лікарських засобів, як три- та тетрациклічні антидепресанти, антигістамінні препарати, нейролептичні препарати, хінідин, амантадин, дизопірамід та інші антихолінергічні засоби (наприклад тіотропій, іпратропій, атропіноподібні сполуки).

Супутнє застосування антагоністів допаміну (наприклад метоклопраміду) може призвести до послаблення дії обох препаратів на шлунково-кишковий тракт.

Бускопан® може підсилювати тахікардію, спричинену бета-адренергічними засобами.

Особливості застосування.

Якщо сильний абдомінальний біль невизначеної етіології зберігається або погіршується, або виникає разом з такими симптомами, як гарячка, нудота, блювання, зміна перистальтики кишечника, больові відчуття в черевній порожнині, зниження артеріального тиску, непритомність або кров у калі, необхідно вжити відповідних діагностичних заходів для визначення етіології симптомів.

Необхідно дотримуватися обережності щодо пацієнтів із захворюваннями серця, яким показане парентеральне введення препарату Бускопан®. Рекомендовано спостерігати за станом таких пацієнтів.

При застосуванні таких антихолінергічних засобів, як Бускопан®, у пацієнтів з недиагностованою і, отже, нелікованою закритокутовою глаукомою може підвищуватися внутрішньоочний тиск. Тому при болючому почервонінні очей із втратою зору після ін'єкції препарату Бускопан® пацієнтам слід негайно звернутися до офтальмолога.

Після парентерального введення препарату Бускопан® повідомляли про випадки анафілаксії, у тому числі з епізодами шоку. Як і при застосуванні будь-яких інших лікарських засобів, які спричиняють подібні реакції, при ін'єкційному застосуванні препарату Бускопан® пацієнт повинен перебувати під спостереженням.

Даний лікарський засіб містить менш ніж 1 ммоль натрію (23 мг) на дозу.

Після відкриття ампули увесь невикористаний розчин має бути утилізований.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Дані щодо застосування гіосцину бутилброміду вагітним жінкам обмежені. Дані досліджень на тваринах стосовно токсичності для репродуктивної функції є недостатніми. Як застережний захід бажано не застосовувати Бускопан® під час вагітності.

Годування груддю

Антихолінергічні препарати можуть пригнічувати лактацію. Невідомо, чи виділяється гіосцину бутилбромід або його метаболіти в грудне молоко. Було виявлено, що новонароджені мають підвищену чутливість до деяких антихолінергічних препаратів. Ризик для новонароджених/немовлят виключити не можна.

Необхідно прийняти рішення щодо доцільності припинення вигодовування дитини грудним молоком або повної/тимчасової відміни препарату Бускопан®, врахувавши користь вигодовування грудним молоком для дитини та користь терапії цим препаратом для жінки.

Фертильність

Жодних досліджень впливу цього препарату на фертильність у людини не проводилося.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Досліджень здатності впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами не проводили. Однак пацієнтів необхідно попередити про можливі прояви побічних реакцій, таких як порушення акомодатії або запаморочення, при застосуванні препарату Бускопан®. Тому потрібно бути обережними при керуванні автотранспортом та роботі з іншими механізмами. Якщо у пацієнтів спостерігаються порушення акомодатії або запаморочення, вони повинні утримуватися від виконання потенційно небезпечних завдань, таких як керування автотранспортом та робота з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Препарат призначений для внутрішньом'язового, підшкірного або внутрішньовенного введення.

Можна вводити шляхом внутрішньом'язової, підшкірної або повільної внутрішньовенної ін'єкції.

Дорослі

При гострому спазматичному болю дорослим призначають вміст 1-2 ампул препарату Бускопан® залежно від тяжкості симптомів (разова доза - 20-40 мг гіосцину бутилброміду; максимальна добова доза - 100 мг гіосцину бутилброміду).

Діти віком від 6 років до 18 років

Препарат призначають у дозі 0,3–0,6 мг/кг (максимальна добова доза – 1,5 мг/кг).

Бускопан® не слід застосовувати постійно щоденно більш ніж 3 дні без встановлення причини абдомінального болю.

Діти. Препарат застосовують дітям віком від 6 років.

Передозування.

Симптоми

Дотепер у людей не спостерігалось ознак отруєння цим препаратом.

У разі передозування можуть спостерігатися антихолінергічні ефекти, такі як розлади зору, тахікардія, сухість у роті, затримка сечі, дисгідроз та почервоніння шкіри.

У дослідженнях на тваринах після застосування надзвичайно високих доз препарату спостерігалися атаксія, тремор, судоми, задишка та антихолінергічні ефекти (мідріаз, сухість слизових оболонок, тахікардія та пригнічення шлунково-кишкової перистальтики із накопиченням їжі у шлунку та кишечнику). Смерть наступала внаслідок паралічу дихання.

Лікування

Оскільки не повідомлялося про жодні випадки отруєння препаратом Бускопан®, наведені нижче заходи були визначені на основі теоретичних міркувань.

При необхідності можна застосовувати парасимпатоміметичні засоби (неостигмін 0,5–2,5 мг внутрішньом'язово або внутрішньовенно). При появі симптомів глаукоми необхідно застосовувати пілокарпін місцево та терміново проконсультуватися з офтальмологом. Ускладнення з боку серцево-судинної системи усувають згідно зі звичайними терапевтичними підходами. При зупинці дихання потрібна інтубація та проведення штучної вентиляції легень. При затримці сечі може бути потрібна катетеризація сечового міхура. Окрім того, необхідно вживати відповідних підтримуючих заходів.

Побічні реакції.

Більшість наведених побічних ефектів можна пояснити антихолінергічними властивостями препарату Бускопан®. Антихолінергічні побічні ефекти препарату Бускопан® загалом легкі та проходять самостійно.

Частота за класифікацією MedDRA:

дуже часто $\geq 1/10$;

часто $\geq 1/100$, $< 1/10$;

нечасто $\geq 1/1000$, $< 1/100$;

рідко $\geq 1/10000$, $< 1/1000$;

дуже рідко $< 1/10000$; невідомо (неможливо визначити за наявними даними).

Порушення з боку серцевої системи

Часто: тахікардія.

Порушення з боку органів зору

Часто: порушення акомодациї, особливо у пацієнтів з далекозорістю, яка не була належним чином відкоригована.

Невідомо: мідріаз, підвищення внутрішньоочного тиску.

Порушення з боку шлунково-кишкового тракту

Часто: зниження секреції слини (наприклад сухість у роті).

Порушення з боку нирок та сечовидільної системи

Невідомо: утруднення сечовиділення (наприклад затримка сечі та дизурія).

Порушення з боку шкіри та підшкірної тканини

Невідомо: зниження потовиділення.

Порушення судинної системи

Часто: запаморочення.

Невідомо: зниження артеріального тиску, припливи.

Порушення з боку імунної системи

Невідомо: шкірні реакції (такі як кропив'янка, висипання, еритема і свербіж), реакції гіперчутливості, анафілактичні реакції, диспное, анафілактичний шок (який може мати летальний наслідок).

Повідомлення про підозрювані побічні реакції

Повідомлення про підозрювані побічні реакції після реєстрації лікарського засобу є важливою процедурою. Це дає змогу продовжувати контролювати співвідношення користь/ризик для цього лікарського засобу. Медичних працівників просять повідомляти про усі підозрювані побічні реакції за допомогою Національної системи фармаконагляду.

Термін придатності. 3 роки. Не застосовувати препарат після закінчення терміну придатності, зазначеного на упаковці.

Умови зберігання. Зберігати при температурі не вище 25 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. 1 мл розчину в ампулі, по 5 ампул у картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

Берінгер Інгельхайм Еспана, СА / Boehringer Ingelheim Espana, SA

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Прат де ла Ріба, 50, 08174 САНТ КУГАТ ДЕЛ ВАЛЛЕС (Барселона), Іспанія/

Prat de la Riba, 50, 08174 SANT CUGAT DEL VALLES (Barcelona), Spain.

Заявник.

ТОВ «Опелла Хелскеа Україна».

Місцезнаходження заявника.

Україна, 01033, м. Київ, вул. Жилинська, 48-50А.