

## SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

### 1. NÁZOV LIEKU

Buscopan  
10 mg obalené tablety

### 2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

Jedna obalená tableta obsahuje 10,0 mg butylskopolamíniumbromidu.

Pomocná látka so známym účinkom: Jedna obalená tableta obsahuje 41,2 mg sacharózy.

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1.

### 3. LIEKOVÁ FORMA

Obalená tableta.

Biela okrúhla obojstranne vypuklá tableta.

### 4. KLINICKÉ ÚDAJE

#### 4.1 Terapeutické indikácie

Liek sa používa pri spazmoch gastrointestinálneho traktu, pri dyskinézii žlčových ciest a pri spazmoch urogenitálneho traktu.

#### 4.2 Dávkovanie a spôsob podávania

##### Dávkovanie

Presné dávkovanie vždy určí lekár. Pokiaľ lekár neodporučí inak, odporúča sa nasledovné dávkovanie:  
*Dospelí a deti staršie ako 6 rokov:* 3 až 5-krát denne 1 – 2 obalené tablety. Neprekračujte dávku 100 mg denne.

Buscopan sa nemá podávať kontinuálne alebo dlhodobo bez zistenia príčiny bolesti brucha.

##### *Pediatrická populácia*

Pre vysoký obsah liečiva nie sú tablety Buscopan 10 mg vhodné pre deti vo veku do 6 rokov.

##### Spôsob podávania

Na perorálne použitie.

Tablety sa musia užiť vcelku a zapiť dostatočným množstvom tekutiny.

#### 4.3 Kontraindikácie

Buscopan je kontraindikovaný u pacientov:

- u ktorých sa v minulosti prejavila precitlivosť na liečivo alebo na ktorúkoľvek z pomocných látok uvedených v časti 6.1,

- s myasténiou gravis,
- s megakolónom,
- s mechanickou stenózou v gastrointestinálnom trakte,
- s paralytickým alebo obštrukčným ileom.

V prípade zriedkavých dedičných ochorení, ktoré nemusia byť kompatibilné s pomocnými látkami lieku (pozri časť 4.4) je podanie lieku kontraindikované.

#### **4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní**

V prípade, že silná, nevysvetliteľná bolesť brucha pretrváva alebo sa zhoršuje alebo je sprevádzaná príznakmi, ako je horúčka, nauzea, vracanie, zmeny v pohyblivosti čriev, citlivosť brucha, zníženie krvného tlaku, mdloby alebo krv v stolici, sú potrebné vhodné diagnostické opatrenia na zistenie etiológie príznakov.

Kvôli možnému riziku komplikácií z anticholínergického účinku je potrebné butylskopolamíniumbromid podávať opatrne pacientom s predispozíciou na glaukóm s uzavretým uhlom, tiež pacientom náchylným na intestinálnu alebo urinárnu obštrukciu a pacientom so sklonom k tachyarytmii.

Jedna 10 mg tableta obsahuje 41,2 mg sacharózy, čo zodpovedá 411,8 mg sacharózy v maximálnej dennej odporúčanej dávke. Pacienti so zriedkavými dedičnými problémami intolerancie fruktózy, glukózo-galaktózovej malabsorpcie alebo deficitu sacharázy a izomaltázy nesmú užívať tento liek.

#### **4.5 Liekové a iné interakcie**

Butylskopolamíniumbromid môže zvyšovať anticholínergický účinok liekov ako sú tri- a tetracyklické antidepresíva, antihistaminiká, antipsychotiká, chinidín, amantadín, disopyramid a ďalšie anticholínergiká (napr. tiotropium, ipratropium, látky podobné atropínu).

Súbežné užívanie Buscopanu s antagonistami dopamínu, ako je metoklopramid, môže viesť k zníženiu účinku oboch látok v gastrointestinálnom trakte.

Buscopan môže zvyšovať tachykardický účinok beta-adrenergík.

#### **4.6 Fertilita, gravidita a laktácia**

##### Gravidita

O použití butylskopolamíniumbromidu u gravidných žien existujú obmedzené údaje. Štúdie na zvieratách nepreukázali priame alebo nepriame účinky z hľadiska reprodukčnej toxicity (pozri časť 5.3).

Ako opatrenie je vhodnejšie vyhnúť sa užívaniu Buscopanu počas gravidity.

##### Dojčenie

Nie je k dispozícii dostatok informácií o vylučovaní Buscopanu a jeho metabolitov do materského mlieka u ľudí.

Ako opatrenie je vhodnejšie vyhnúť sa užívaniu Buscopanu počas dojčenia.

##### Fertilita

Neuskutočnili sa žiadne štúdie vplyvu na fertilitu u ľudí (pozri časť 5.3).

#### **4.7 Ovplyvnenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje**

Neuskutočnili sa žiadne štúdie o vplyve na schopnosť viesť vozidlá a obsluhovať stroje.

#### 4.8 Nežiaduce účinky

Mnohé z uvedených nežiaducich účinkov možno pripisovať anticholinergickým vlastnostiam Buscopanu. Anticholinergické nežiaduce účinky Buscopanu sú väčšinou mierne a s obmedzeným trvaním.

Frekvencie podľa konvencií MedDRA:

veľmi časté:	( $\geq 1/10$ ),
časté:	( $\geq 1/100$ až $< 1/10$ ),
menej časté:	( $\geq 1/1\ 000$ až $< 1/100$ ),
zriedkavé:	( $\geq 1/10\ 000$ až $< 1/1\ 000$ ),
veľmi zriedkavé:	( $< 1/10\ 000$ ),
neznáme:	z dostupných údajov.

##### *Poruchy srdca a srdcovej činnosti*

Menej časté: tachykardia.

##### *Poruchy gastrointestinálneho traktu*

Menej časté: sucho v ústach.

##### *Poruchy obličiek a močových ciest*

Zriedkavé: retencia moču.

##### *Poruchy kože a podkožného tkaniva*

Menej časté: znížené potenie.

##### *Poruchy imunitného systému*

Menej časté: kožné reakcie (napr. žihľavka, svrbenie).

Neznáme: anafylaktický šok\*, anafylaktické reakcie\*, dyspnoe\*, vyrážka\*, erytém\*, hypersenzitivita\*.

\* = Tento nežiaduci účinok bol zaznamenaný na základe skúseností po uvedení lieku na trh. S 95 % istotou nie je kategória frekvencie výskytu vyššia než častá, ale môže byť aj menej. Presné stanovenie frekvencie výskytu nie je možné, keďže nežiaduci účinok sa nevyskytol v databáze 185 pacientov klinickej štúdie.

#### Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie po registrácii lieku je dôležité. Umožňuje priebežné monitorovanie pomeru prínosu a rizika lieku. Od zdravotníckych pracovníkov sa vyžaduje, aby hlásili akékoľvek podozrenia na nežiaduce reakcie na **národné centrum hlásenia uvedené v [Prílohe V](#)**.

#### 4.9 Predávkovanie

##### Symptómy

Pri predávkovaní sa môžu pozorovať anticholinergické účinky.

##### Terapia

Ak je to potrebné, podávajú sa parasymptikomimetiká. V prípade glaukómu sa má urgetne vyhľadať pomoc oftalmológa. Kardiovaskulárne komplikácie sa majú liečiť podľa obvyklých terapeutických postupov. V prípade respiračného zlyhania je potrebné zvážiť intubáciu a riadené dýchanie. Retencia moču môže vyžadovať katetrizáciu. Vhodný rozsah podpornej liečby sa určí podľa potreby.

## 5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

### 5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: Liečivá na funkčné gastrointestinálne poruchy; alkaloidy beladony, semisyntetické kvartérne bázy  
ATC kód: A03BB01

Buscopan má spazmolytický účinok na hladké svalstvo gastrointestinálneho, biliárneho a urogenitálneho traktu. Ako derivát kvartérnej amóniovej soli butylskopolamíniumbromid neprechádza do centrálného nervového systému. Preto sa ani nevyskytujú anticholínergické nežiaduce účinky na CNS. Periférne anticholínergické účinky vyplývajú z blokády ganglia v stene orgánu, ako aj z antimuskarínovej aktivity.

### 5.2 Farmakokinetické vlastnosti

#### Absorpcia

Butylskopolamíniumbromid je ako kvartérna amóniová soľ vysoko polarizovaný, a preto je len parciálne absorbovaný po perorálnom (8 %) alebo rektálnom (3 %) podaní. Po perorálnom podaní jednorazovej dávky butylskopolamíniumbromid v rozsahu 20 až 400 mg boli približne 2 hodiny po podaní zistené priemerné vrcholové plazmatické koncentrácie medzi 0,11 ng/ml a 2,04 ng/ml. Pozorované priemerné hodnoty  $AUC_{0-tz}$  sa v tom istom rozsahu dávok pohybovali medzi 0,37 a 10,7 ng.h/ml. Stredné hodnoty celkovej biologickej dostupnosti jednotlivých liekových foriem, t. j. obalené tablety, čapíky a perorálny roztok s obsahom 100 mg butylskopolamíniumbromidu boli nižšie ako 1 %.

#### Distribúcia

Pre svoju vysokú afinitu k muskarínovým receptorom a nikotínovým receptorom sa butylskopolamíniumbromid distribuuje najmä do svalových buniek v brušnej a panvovej oblasti ako aj do intramurálnych ganglií brušných orgánov. Väzba butylskopolamíniumbromidu na bielkoviny plazmy (albumín) je približne 4,4 %. Štúdie na zvieratách preukázali, že butylskopolamíniumbromid neprechádza hematoencefalickou bariérou, avšak o tomto účinku nie sú dostupné klinické údaje. Zistilo sa, že butylskopolamíniumbromid (1 mmol) interaguje s cholinovým transportom (1,4 nmol) v bunkách epitelu ľudskej placenty *in vitro*.

Po intravenóznom podaní sa látka rýchlo eliminuje z plazmy počas prvých 10 minút s polčasom 2 – 3 minúty. Distribučný objem ( $V_{ss}$ ) je 128 l.

Po orálnom a intravenóznom podaní sa butylskopolamíniumbromid koncentruje v tkanive gastrointestinálneho traktu, pečeni a obličkách. Napriek krátko merateľným extrémne nízkym hladinám v krvi zostáva butylskopolamíniumbromid dostupný v mieste účinku kvôli svojej vysokej afinite k tkanivu.

#### Metabolizmus a eliminácia

Po perorálnom podaní jednorazovej dávky v rozsahu 100 až 400 mg sa terminálny polčas pohyboval medzi 6,2 a 10,6 hodinami. Hlavná metabolická cesta je hydrolytické štiepenie esterových väzieb. Perorálne podaný butylskopolamíniumbromid sa vylučuje stolicou a močom. Štúdie u ľudí ukazujú, že 2 až 5 % izotopom značenej látky sa vylučuje obličkami po perorálnom a 0,7 až 1,6 % po rektálnom podaní. Približne 90 % izotopom značenej látky sa zistilo v stolici po perorálnom podaní. Vylučovanie butylskopolamíniumbromidu močom je menej ako 0,1 % dávky. Stredné zjavné perorálne klírensy po perorálnych dávkach v rozsahu 100 až 400 mg boli v rozsahu 881 až 1420 l/min, pokým zodpovedajúce distribučné objemy v tom istom rozsahu kolíšu medzi 6,13 až 11,3 x 10<sup>5</sup> l, pravdepodobne pre nízku systémovú dostupnosť. Metabolity, vylučované močom sa slabo viažu na muskarínové receptory a preto sa nepredpokladá, že prispievajú k účinku butylskopolamíniumbromidu.

Po užití tabliet s butylskopolamíniumbromidom sa terapeutický efekt pozoroval do 15 minút.

### 5.3 Predklinické údaje o bezpečnosti

V teste akútnej toxicity má butylskopolamíniumbromid nízky index toxicity: perorálne LD<sub>50</sub> bola u myší 1000 – 3000 mg/kg, u potkanov 1040 – 3300 mg/kg a u psov 600 mg/kg.

Príznaky toxicity boli ataxia a zníženie svalového tonusu, dodatočne, u myší triaška a kŕče, u psov mydriáza, suchosť slizníc a tachykardia. Smrť spôsobená zastavením dýchania nastala do 24 hodín. Intravenózna LD<sub>50</sub> bola u myší 10 – 23 mg/kg a u potkanov 18 mg/kg.

Počas 4-týždňových štúdií perorálnej toxickéj dávky po opakovanom podávaní potkany tolerovali dávku 500 mg/kg = „stupeň bez nežiaducich účinkov (NOAEL)“. V dávke 2000 mg/kg butylskopolamíniumbromid účinkom na parasympatické gangliá paralyzoval gastrointestinálne funkcie a spôsoboval obstipáciu. Jedenásť z 50 potkanov uhynulo. Hematologické výsledky a výsledky z klinickej biochémie nevykazovali zmenu pri zmenách dávkovania. Počas 26-týždňovej štúdie bola dávka 200 mg/kg u potkanov ešte tolerovaná. Pri dávke 250 – 1000 mg/kg došlo k útlmu gastrointestinálnych funkcií a následnému uhynutiu. NOAEL 39-týždňovej perorálnej (kapsuly) štúdie u psov bol 30 mg/kg. Väčšina klinických nálezov sa dá pripísať akútnym účinkom vysokých dávok butylskopolamíniumbromidu (200 mg/kg). Neboli zistené žiadne histopatologické nálezy.

Opakované intravenózne dávky 1 mg/kg boli veľmi dobre tolerované u potkanov počas 4-týždňovej štúdie. Pri dávke 3 mg/kg boli bezprostredne po podaní pozorované kŕče. Po dávke 9 mg/kg potkany uhynuli na respiračné zlyhanie. Pri podávaní lieku psom počas 5 týždňov v dávkach 2-krát 1 mg/kg, 2-krát 3 mg/kg a 2-krát 9 mg/kg bola prítomná od dávky závislá mydriáza u všetkých liečených zvierat, pri dávke 2-krát 9 mg/kg ataxia, slinenie, zníženie telesnej hmotnosti a znížený príjem potravy. Lokálne podávaný roztok bol dobre tolerovaný.

Po opakovanom intramuskulárnom podávaní dávky 10 mg/kg bola pozorovaná dobrá systémová tolerancia, ale v mieste podávania oproti kontrolnej skupine potkanov bol vyšší výskyt poškodení svalov.

Pri dávkach 60 a 120 mg/kg bola mortalita vysoká a lokálne poškodenia boli závislé od dávky.

Butylskopolamíniumbromid nemá embryotoxický ani teratogénny efekt v Seg. II pri perorálnom podávaní potravou až do 200 mg/kg (potkan) a 200 mg/kg sondovaním alebo 50 mg/kg subkutánne (NZW–králik). Fertilitu neovplyvňuje v Seg. I pri perorálnom dávkovaní až do 200 mg/kg.

Tak ako iné kationové liečivá, aj butylskopolamíniumbromid interaguje s cholínovým transportným systémom buniek epitelu ľudskej placenty *in vitro*. Nepotvrdil sa transfer butylskopolamíniumbromidu do kompartmentu plodu.

Butylskopolamíniumbromid vo forme čapíkov bol lokálne dobre tolerovaný.

Špeciálne štúdie sledovali lokálnu toleranciu pri opakovanom intramuskulárnom podávaní Buscopanu 15 mg/kg u psov a opíc počas 28 dní. Malé fokálne nekrózy v mieste podávania sa našli len u psov. Buscopan bol dobre tolerovaný pri arteriálnom a venóznom podávaní do ušnic králikov. Buscopan 2 % injekčný roztok nepreukázal *in vitro* žiadne hemolytické účinky po zmiešaní s 0,1 ml ľudskej krvi.

Butylskopolamíniumbromid nevykazuje mutagénnu ani klastogénnu aktivitu v Amesovom teste, v teste génových mutácií *in vitro* na ľudských V79 bunkách (HRPT test) a v teste chromozomálnych zmien *in vitro* v ľudských periférnych lymfocytoch. Butylskopolamíniumbromid bol *in vivo* negatívny pri mikronukleovom teste na kostnej dreni potkanov.

Štúdie kancerogenity *in vivo* sa neuskutočnili. V dvoch štúdiách na potkanoch počas 26 týždňov butylskopolamíniumbromid nevykazoval kancerogénny potenciál pri dávkach do 1000 mg/kg.

## **6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE**

### **6.1 Zoznam pomocných látok**

#### Jadro tablety

dihydrát fosforečnanu vápenatého  
kukuričný škrob  
rozpustý škrob  
koloidný oxid kremičitý  
kyselina vínna  
kyselina stearová/kyselina palmitová

#### Obal tablety

povidón  
sacharóza  
mastenec  
arabská guma  
oxid titaničitý (E171)  
makrogol 6 000  
karnaubský vosk  
biely vosk

### **6.2 Inkompatibility**

Neaplikovateľné.

### **6.3 Čas použiteľnosti**

3 roky

### **6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie**

Tento liek nevyžaduje žiadne zvláštne podmienky na uchovávanie.

### **6.5 Druh obalu a obsah balenia**

ALU/PVC blister alebo ALU/PVC/PVDC blister.

Veľkosť balenia: 10, 20 alebo 50 obalených tabliet.  
Na trh nemusia byť uvedené všetky veľkosti balenia.

### **6.6 Špeciálne opatrenia na likvidáciu a iné zaobchádzanie s liekom**

Žiadne zvláštne požiadavky.

## **7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCI**

IPSEN Consumer HealthCare  
65 Quai Georges Gorse  
92100 Boulogne-Billancourt  
Francúzsko

**8. REGISTRAČNÉ ČÍSLO**

73/0311/70-S

**9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE/PREDLŽENIA REGISTRÁCIE**

Dátum prvej registrácie: 27. októbra 1970

Dátum posledného predĺženia registrácie: 26. februára 2007

**10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU**

12/2023