

SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

1. NÁZOV LIEKU

Atropine Noridem

1 mg/ml injekčný roztok

2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

Jedna ampulka s objemom 1 ml obsahuje 1 mg atropínium-sulfátu, čo zodpovedá 0,83 mg atropínu.

Jeden mililiter (ml) lieku Atropine Noridem obsahuje približne 3,54 mg (0,154 mmol) sodíka.

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1.

3. LIEKOVÁ FORMA

Injekčný roztok.

Číry, bezfarebný roztok, bez viditeľných častíc.

pH: 3,0 – 4,5

Osmolalita: 270 – 310 mOsm/kg

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikácie

- Atropine Noridem je indikovaný pediatrickej populácii všetkých vekových skupín a dospelým na liečbu: Hemodynamicky závažnej bradykardie a/alebo atrioventrikulárnej blokády v dôsledku nadmerného vagálneho tonusu v núdzových situáciách. Kardiopulmonálnej resuscitácie: liečba symptomatickej bradykardie a atrioventrikulárnej blokády.
- V kombinácii s neostigmínom pre zvrátenie účinku nedepolarizujúcich myorelaxancií.
- Intoxikácia organofosfátovými pesticídmi a inými inhibítormi cholinesterázy.

Atropine Noridem sa môže použiť aj ako premedikácia pred úvodom do celkovej anestézie (znižuje riziko vagovej inhibície a znižuje slinnú a bronchiálnu sekréciu).

4.2 Dávkovanie a spôsob podávania

Dávkovanie

Dospelí

- Liečba bradykardie: podajte 0,5 mg intravenózne a v prípade potreby dávku opakujte každých 3 až 5 minút až do celkovej dávky 3 mg.
- V kombinácii s neostigmínom pre zvrátenie účinku nedepolarizujúcich myorelaxancií: podajte 0,6 – 1,2 mg intravenózne.
- Premedikácia (na zníženie rizika vagovej inhibície ako aj slinných a bronchiálnych sekrétov): podajte 0,3 až 0,6 mg intravenózne bezprostredne pred úvodom do anestézie alebo intramuskulárne/subkutánne 30 – 60 minút pred úvodom do anestézie.
- Ako antidotum (liečba intoxikácie inhibítormi cholinesterázy ako sú organofosfátové pesticídy a liečba otravy hubami): podávajte 0,5 až 2 mg atropínium-sulfátu intravenózne. Dávka sa môže

opakovať po 5 minútach a potom každých 10 až 15 minút podľa potreby, až kým prejavy a príznaky nevymiznú (túto dávku možno niekoľkokrát prekročiť).

Pediatrická populácia

- Liečba bradykardie: podajte 0,02 mg/kg telesnej hmotnosti intravenózne v jednej dávke až do maximálnej dávky 0,6 mg.
- V kombinácii s neostigmínom pre zvrátenia účinku nedepolarizujúcich myorelaxancií: podajte 0,02 mg/kg telesnej hmotnosti intravenózne.
- Premedikácia (na zníženie rizika vagovej inhibície ako aj slinných a bronchiálnych sekrétov): podajte 0,01 až 0,02 mg/kg telesnej hmotnosti (maximálne 0,6 mg na dávku) intravenózne bezprostredne pred úvodom do anestézie alebo intramuskulárne/subkutánne 30 – 60 minút pred úvodom do anestézie.
- Ako antidotum (liečba intoxikácie inhibítormi cholinesterázy ako sú organofosfátové pesticídy a liečba otravy hubami): podávajte 0,02 mg/kg telesnej hmotnosti intravenózne, opakujte niekoľkokrát až kým prejavy a príznaky muskarínovej intoxikácie nevymiznú.

Na zabezpečenie presného dávkovania u dojčiat sa odporúča použiť iný liek s najnižšou dostupnou koncentráciou atropínium-sulfátu.

Úpravy dávkovania

Vo všeobecnosti sa má dávkovanie upraviť podľa pacientovej reakcie na liečbu a tolerancie. Dávkovanie sa zvyčajne zvyšuje, kým sa vedľajšie účinky nestanú netolerovateľnými, až do maximálnej dávky 3 mg u dospelých a 0,6 mg u detí; mierne zníženie dávky potom poskytnite maximálnu dávku tolerovanú pacientom.

Osobitné populácie

Opatrnosť sa odporúča u starších ľudí a pacientov s poruchou funkcie obličiek alebo pečene (pozri časť 4.4).

Spôsob podávania

Atropín sa podáva intravenóznou, subkutánnou alebo intramuskulárnou injekciou.

4.3 Kontraindikácie

Precitlivenosť na liečivo alebo na ktorúkoľvek z pomocných látok uvedených v časti 6.1.

Použitie atropínu je tiež kontraindikované:

- pri hypertrofii prostaty a iných ťažkostiach s močením z dôvodu rizika zadržiavania moču
- pri obštrukcii gastrointestinálneho traktu (napr. pyloroduodenálnej stenóze)
- pri paralytickom ileu alebo črevnej atónii (najmä v prípade geriatrických a oslabených pacientov)
- pri závažnej ulceróznej kolitíde, pretože môže viesť k ileu alebo megakolónu
- pri glaukóme s uzavretým uhlom alebo glaukóme s úzkym uhlom medzi dúhovkou a rohovkou, pretože môže zvýšiť vnútroočný tlak
- pri vysokej teplote okolitého prostredia, najmä u detí a pri hypertermii
- pri srdcovom zlyhávaní, operácii srdca a tachykardii, pretože môže ďalej zvyšovať srdcovú frekvenciu
- pri akútnom krvácaní v spojení s nestabilnou kardiovaskulárnou funkciou
- pri tyreotoxikóze

Tieto kontraindikácie nie sú relevantné pri život ohrozujúcich stavoch ako je bradykardia alebo intoxikácia organofosfátovými pesticídmi.

4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní

Atropín sa má podávať s opatrnosťou deťom a starším ľuďom, pretože sú náchylnejší na vedľajšie účinky. Rovnaké opatrenia je potrebné prijať v prípade pseudomembranóznej kolitídy, hnačky, hypertyreózy, gastrointestinálnej infekcie (napr. dyzentéria), ochorenia pečene alebo obličiek a hypertenzie.

Systémové podávanie antimuskariník u oslabených pacientov s chronickým ochorením pľúc môže viesť k tvorbe bronchiálnych hlienových zátok v dôsledku zníženia bronchiálnej sekrécie.

Pri liečbe parkinsonizmu má byť zvyšovanie podávanej dávky atropínu ako aj zmena liečby postupné (antimuskarínová liečba sa nemá náhle ukončiť).

Zdá sa, že ľudia s Downovým syndrómom majú zvýšenú citlivosť na atropín. Na druhej strane ľudia s albinizmom prejavujú určitú odolnosť voči tomuto lieku.

Podávanie malých dávok môže viesť k paroxyzmálnej bradykardii.

Keďže antimuskariniká môžu spomaliť vyprázdňovanie žalúdka, môžu viesť u pacientov so žalúdočnými vredmi k stáze. Preventívne opatrenia sú potrebné aj u pacientov s problémami pažerákového refluxu alebo u pacientov s hiátovou herniou spojenou s gastroezofageálnym refluxom, pretože antimuskariniká znižujú motilitu žalúdka a tlak vyvíjaný dolným pažerákovým zvieračom.

Čo sa týka výsledkov laboratórnych testov, antimuskariniká ovplyvňujú test na sekréciu žalúdočnej kyseliny. Podávanie antimuskariník sa neodporúča 24 hodín pred testom, pretože tieto lieky antagonizujú účinok pentagastrínu a histamínu na hodnotenie funkcie sekrécie žalúdočnej kyseliny. Antimuskariniká a najmä atropín ovplyvňujú vylučovanie fenolsulfónftaleínu (PSP). Atropín využíva rovnaký tubulárny mechanizmus sekrécie ako fenolsulfónftaleín (PSP), čo spôsobuje zníženie vylučovania PSP močom. Pacientom, ktorí podstupujú toto vyšetrenie, sa nesmie súbežne podávať atropín.

Keďže antimuskariniká môžu zvyšovať vnútroočný tlak, u niektorých pacientov a v závislosti od ich stavu sa odporúča sledovať tento parameter.

Atropín sa nesmie podávať pacientom s myasténiou gravis, pokiaľ sa nepodáva za účelom zníženia nežiaducich účinkov muskarínu spôsobených inhibítormi cholinesterázy

Zlikvidujte liek, ak je roztok zakalený alebo s usadeninami, alebo ak je obal porušený. S liekom zaobchádzajte za obvyklých aseptických podmienok platných pre injekčné roztoky. Zlikvidujte všetok zvyškový objem roztoku.

Obsah sodíka

Tento liek obsahuje menej ako 1 mmol (23 mg) sodíka v jednom ml (jednej liekovke), t. j. v podstate zanedbateľné množstvo sodíka.

4.5 Liekové a iné interakcie

a) Lieky s anticholinergnými vlastnosťami

Pacienti užívajúci antimuskariniká spolu s amantadínom, antihistaminikami, antiparkinsonikami, butyrofenónmi alebo fenotiazínmi, tricyklickými antidepresívami alebo antiarytmikami s anticholinergnými vlastnosťami (napr. prokaínamid) majú zvýšené riziko vzniku nežiaducich anticholinergných účinkov.

b) Účinky na gastrointestinálnu absorpciu liečiva

Zníženie motility žalúdka spôsobené antimuskarinikami môže ovplyvniť absorpciu niektorých liekov. Napríklad súbežné podávanie antimuskariník a levodopy môže znížiť absorpciu levodopy v čreve, pretože zvyšuje metabolizmus liečiva v žalúdku. Ak sa podávanie antimuskarinika preruší bez

súbežného zníženia dávky levodopy, môžu sa objaviť toxické účinky v dôsledku zvýšenej absorpcie levodopy.

Pacienti užívajúci súbežne antimuskariniká a digoxín majú byť monitorovaní, pretože sa u nich môže vyvinúť digitálisová toxicita.

Keďže antimuskariniká môžu znižovať tvorbu kyseliny chlorovodíkovej v žalúdku a/alebo zvyšovať pH žalúdka, môžu znižovať gastrointestinálnu absorpciu ketokonazolu. Ak je potrebná súbežná liečba, antimuskarinikum sa má podať najmenej dve hodiny po podaní ketokonazolu.

Antimuskariniká môžu potenciálne oneskoriť terapeutický účinok (napr. analgéziu, antipyretický účinok) acetaminofénu.

c) Glukokortikoidy, kortikotropín (ACTH) alebo haloperidol

Súbežná dlhodobá antimuskarínová liečba môže viesť k zvýšenému vnútroočnému tlaku. Navyše sa u schizofrenických pacientov môže znížiť antipsychotická účinnosť haloperidolu.

d) Látky alkalizujúce moč (antacidá obsahujúce vápnik a/alebo horčík, inhibítory karboanhydrázy, citráty a hydrogénuhličitan sodný)

Vylučovanie antimuskarinika močom môže byť oneskorené v dôsledku alkalizácie moču s maximalizáciou terapeutických a/alebo nežiaducich účinkov tohto typu lieku.

e) Cyklopropán

Súbežné intravenózne podávanie antimuskarinika s cyklopropánovým anestetikom môže vyvolať ventrikulárne arytmie.

f) Guanadrel, guanetidín

Súbežné podávanie môže antagonizovať antimuskarínový inhibičný účinok na sekréciu kyseliny chlorovodíkovej v žalúdku.

g) Inhibítory monoaminoxidázy (MAO) vrátane furazolidónu, prokarbazínu a pargylínu

Súbežné podávanie môže zosilniť nežiaduce účinky muskarínu v dôsledku sekundárneho antimuskarínového účinku týchto liekov. Okrem toho môžu inhibítory MAO blokovať antimuskarínovú detoxikáciu, čím zvyšujú ich účinok.

h) Opioidné analgetiká

Súbežné podávanie s antimuskarinikami môže zvýšiť riziko závažnej zápchy, ktorá môže viesť k paralytickému ileu a/alebo retencii moču.

i) Chlorid draselný, najmä lieky na báze voskovej matrice

Súbežné podávanie s antimuskarinikami môže zvýšiť závažnosť gastrointestinálnej poruchy vyvolanej chloridom draselným.

4.6 Fertilita, gravidita a laktácia

Gravidita

Atropín prechádza do placenty.

Hoci neboli vykonané žiadne dobre kontrolované štúdie u ľudí, štúdie na zvieratách nepreukázali priame alebo nepriame škodlivé účinky vzhľadom na reprodukčnú toxicitu (pozri časť 5.3).

Intravenózne podávanie atropínu počas tehotenstva môže viesť k tachykardii plodu. Preto sa má atropín podávať počas gravidity len vtedy, ak pontenciálne prínosy prevyšujú možné riziká pre plod.

Dojčenie

U ľudí nie sú hlásené žiadne problémy týkajúce sa podávania atropínu počas dojčenia. Je však potrebné vziať do úvahy pomer rizika a prínosu, pretože stopy atropínu sa nachádzajú v materskom mlieku a deti sú na tieto lieky obzvlášť citlivé.

Antimuskariniká potláčajú laktáciu.

Fertilita

Atropínium-sulfát znížil plodnosť samcov potkanov, pravdepodobne v dôsledku inhibičného účinku na transport spermií a semena počas procesu emisie.

4.7 Ovplyvnenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

Keďže antimuskariniká môžu spôsobiť ospalosť a rozmazané videnie, pacienti nemajú počas takejto liečby vykonávať činnosti vyžadujúce bdelosť alebo zrakovú ostrosť (napr. obsluha strojov).

4.8 Nežiaduce účinky

Nežiaduce účinky atropínu sú zvyčajne časté a vo väčšine prípadov súvisia s predĺženým farmakologickým účinkom a závisia od dávky.

Nežiaduce reakcie, ktoré pravdepodobne súvisia s liekom, sú uvedené v tabuľke nižšie podľa triedy orgánových systémov MedDRA a frekvencie podľa nasledujúcej konvencie:

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).

Triedy orgánových systémov podľa MedDRA	Veľmi časté	Časté	Menej časté	Zriedkavé	Veľmi zriedkavé	Neznáme
Poruchy krvi a lymfatického systému						leukocytóza
Poruchy imunitného systému				hypersenzitivita	anafylaktické reakcie vrátane anafylaktického šoku	
Psychické poruchy		halucinácie				
Poruchy nervového systému		bolesť hlavy, temporospatálna dezorientácia, ospalosť	insomnia			
Poruchy oka	zahmlené videnie	rozšírenie zreníc (mydriáza) so stratou akomodácie oka (cykloplégia), fotofóbia, glaukóm				
Poruchy ucha a labiryntu			závraty			
Poruchy srdca a srdcovej činnosti		bradykardia (po podaní nízkych dávok), tachykardia (po podaní				

		vysokých dávok), palpitácie a srdcová arytmia				
Poruchy dýchacej sústavy, hrudníka a mediastína			upchatý nos			
Poruchy gastrointestinálneho traktu	sucho v ústach(xerostómia)	zníženie tonicity a motility gastrointestinálneho traktu, zápcha, vracanie, paralytický ileus, dysfágia, zmena vnímania chuti				
Poruchy kože a podkožného tkaniva		začervenanie a suchá koža, žihľavka				
Poruchy obličiek a močových ciest		dyzúria a retencia moču				
Poruchy reprodukčného systému a prsníkov			impotencia			
Celkové poruchy a reakcie v mieste podania			hypertermia			

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**Príznaky**

Intoxikácia atropínom nastáva, keď pacient dostane nadmerné dávky. Je potrebné vziať do úvahy, že citlivosť na atropín sa u jednotlivých osôb líši.

Podávanie toxických dávok tohto lieku spôsobuje tachykardiu, zrýchlené dýchanie, hyperpyrexiu a stimuláciu centrálného nervového systému. To vedie k úzkosti, zmätenosti, vzrušeniu, psychotickým reakciám, halucináciám a delíriu. Príležitostne sa môžu vyskytnúť záchvaty. Na tvári a hornej časti trupu sa môže vyskytnúť aj kožná vyrážka. V prípade závažnej intoxikácie môže centrálna stimulácia viesť k útlmu centrálného nervového systému, kóme, respiračnému alebo obehovému zlyhaniu a smrti.

Liečba

Na potlačenie anticholinergných symptómov sa môžu podávať cholinergné lieky ako je neostigmin (1 mg neostigminu intramuskulárne každé 2 – 3 hodiny). Najväčšie nebezpečenstvo spočíva v centrálnom účinku tohto lieku, pretože nie je antagonizovaný parasymptomimetickými liekmi a je možné liečiť len príznaky. Ak je teda príznakom vzrušenie, používame tlmiace lieky ako diazepam; ak sa dosiahne fáza útľmu, môže sa užiť aj kofeín. Keď krvný tlak príliš klesne, môžu sa podať vazopresorické amíny. Ak je útlm dýchania závažný, má sa použiť umelé dýchanie s podaním kyslíka.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: Alkaloidy beladony a jej deriváty, jednozložkové; alkaloidy beladony, terciárne amíny
ATC kód: A03BA01

Tropánové alkaloidy – atropín a skopolamín – majú dva základné účinky:

- a) anticholinergné alebo parasymptolytické účinky, blokujúce muskarínový účinok acetylcholínu
- b) stimulačné alebo tlmivé účinky na centrálny nervový systém podľa okolností. Prvý z týchto účinkov je najdôležitejší.

Farmakologický účinok atropínu (terciárny amín) je v podstate výsledkom účinku L-hyoscyamínu; D-hyoscyamín nemá prakticky žiadny antimuskarínový účinok.

Pôsobenie na kardiovaskulárny systém

Antimuskarínový účinok na srdce závisí od dávky. Podávanie priemerných dávok antimuskarinika (napr. 0,4 – 0,6 mg atropínu) môže spôsobiť mierne zníženie srdcovej frekvencie, čo možno pripísať centrálnej vagovej stimulácii; k tomu dochádza skôr, ako dôjde k periférnej cholinergnej blokade. Podávanie vyšších dávok (napr. 1 – 2 mg atropínu) vedie postupne k tachykardii blokováním normálnej vagovej inhibície sinoatriálneho uzla. Účinky antimuskariník na srdce sú niekedy nepredvídateľné a paradoxné v závislosti od prevodového systému srdcového stimulu a fyziologického stavu srdca.

Antimuskariniká môžu tiež spôsobiť kožnú vazodilatáciu, najmä ak sa podávajú v toxických dávkach.

Atropín je hlavné antimuskarinikum používané pri diagnostike, hodnotení a liečbe srdcových problémov. Atropín má pozitívny chronotropný účinok tým, že zrýchľuje sínusový rytmus prostredníctvom priamej parasymptatickej blokady. Hoci je atropín účinný v prípade sekundárnej sínusovej bradykardie, t. j. s mimokardiálnymi príčinami, má malú alebo žiadnu účinnosť v prípade sínusovej bradykardie spôsobenej ochorením sinoatriálneho uzla. Účinok atropínu na Hisov-Purkyneho systém je nepredvídateľný.

Počas liečby antimuskarinikami sa môžu vyskytnúť predsieňové arytmie, atrioventrikulárne disociácie, ventrikulárne tachykardie a fibrilácie. Zdá sa, že mladí zdraví dospelí sú náchylnejší na tieto účinky v porovnaní s inými vekovými skupinami, pravdepodobne kvôli zvýšenému významu srdcového vagového tonusu v tejto vekovej skupine. Nie je známe, či je táto vazodilatácia kompenzačnou reakciou pre útlm zvýšenia telesnej teploty alebo priamym účinkom lieku na povrchové krvné cievy.

Pôsobenie na respiračný systém

Antimuskariniká znižujú objem sekrétov z nosa, úst, hltana a priedušiek. Uvoľňujú hladké svaly priedušiek a priedušničiek, čím znižujú odpor pri prechode vzduchu. Atropín je silný bronchodilatátor, ktorý je obzvlášť účinný v prípade bronchokonstrikcie vyvolanej parasymptatickou stimuláciou.

Atropín aj skopolamín znižujú výskyt laryngospazmu počas celkovej anestézie. Pôsobia nepriamo na znižovanie sekrécií, čím zabránia reflexu laryngospazmu. Zdá sa, že nedochádza k žiadnej priamej blokade kostrového svalstva hrtana. Antimuskariniká blokujú stimuláciu acetylcholínom indukovanú

guanylycyklázy a tým znižujú tkanivové koncentrácie cyklického guanozínmonofosfátu (cGMP), mediátora bronchokonstrikcie.

Pôsobenie na centrálny nervový systém

Atropín stimuluje miechu a horné cerebrálne centrá a ovplyvňuje centrálny nervový systém, ako je antimuskarinikum, ktoré sa používa na liečbu Parkinsonovej choroby (trihexyfenidyl). Cholinergné vedenie centrálného nervového systému v podstate zahŕňa nikotínové receptory v mozgu. Účinky na centrálny nervový systém pri normálnych dávkach atropínu a príbuzných liečiv vyplývajú z jeho centrálného antimuskarínového účinku. Tento účinok je zvyčajne obmedzený na miernu vagovú stimuláciu, ktorá vedie k zníženiu srdcovej frekvencie.

Zdá sa, že antimuskariniká spôsobujú zvýšené uvoľňovanie a obrat acetylcholínu v centrálnom nervovom systéme, ktorý môže aktivovať nikotínové receptory v mozgu.

Pôsobenie na gastrointestinálny trakt

Antimuskariniká majú niekoľko antisekrečných účinkov na gastrointestinálny trakt. Znižujú objem slín a vyvolávajú xerostómiu. Účinky receptorov na slinné žľazy sú zvyčajne citlivejšie na antimuskarínovú blokádu než na akékoľvek iné muskarínové receptory (napr. tie, ktoré sprostredkujú žalúdočnú sekréciu). Vo všeobecnosti antimuskariniká tiež znižujú objem žalúdočných sekrétov. Sekrécia žalúdočnej kyseliny však nemusí byť nevyhnutne znížená. Zdá sa, že antimuskarinikum nemôže účinne kontrolovať sekréciu žalúdočnej kyseliny, keď použité dávky nemajú nežiaduce účinky.

Sekrécia žalúdočnej kyseliny stimulovaná esterami cholínu (napr. metacholínom, karbacholom) alebo pilokarpínom je úplne blokovaná atropínom. Stimulácia sekrécie žalúdočnej kyseliny alkoholom, histamínom alebo kofeínom je atropínom znížená, ale nie je odstránená. Antimuskariniká môžu znižovať koncentráciu mucínu a enzýmov v gastrointestinálnych sekrétoch. Atropín a iné antimuskariniká majú malý priamy účinok na pankreatické, biliárne alebo črevné sekrécie, pretože tieto sekrécie sú v podstate kontrolované hormonálnymi a nevagovými mechanizmami.

Podávanie terapeutických dávok antimuskariník vyvoláva predĺžené inhibičné účinky na pažerák, žalúdok, dvanástnik, jejunum, ileum a motilitu hrubého čreva. Tieto účinky sú charakterizované znížením tonusu a amplitúdy a frekvencie peristaltických kontrakcií. Antimuskariniká predlžujú gastrointestinálny tranzitný čas a potenciálne môžu zmeniť absorpciu iných liekov.

Zvýšený gastrointestinálny tonus a motilita vyplývajúce z hypoglykémie vyvolanej inzulínom, emocionálnej stimulácie alebo podávania morfinu a parasymphatomimetických liečiv sú zvyčajne rýchlo inhibované antimuskarinikom. Avšak v niektorých prípadoch je zvýšený gastrointestinálny tonus a motilita rezistentné voči antimuskarínovej inhibícii (napr. priama gastrointestinálna stimulácia v dôsledku pôsobenia vazopresínu alebo histamínu). Antimuskariniká uvoľňujú dolný pažerákový zvierač, čo vedie k zníženiu tlaku zvierača. Antimuskariniká majú spazmolytický účinok na žľezník a žľezové cesty, čo je zvyčajne nedostatočné pre terapeutický účinok.

Na zníženie sekrécie žalúdočnej kyseliny sú zvyčajne potrebné relatívne vysoké dávky antimuskarinika (napr. viac ako 1 mg atropínu i.v.). Tieto dávky vo všeobecnosti znižujú bazálnu alebo nočnú sekréciu žalúdočnej kyseliny približne o 50 %, sekréciu žalúdočnej kyseliny stimulovanú histamínom alebo pentagastrínom znižujú približne o 40 % a sekréciu žalúdočnej kyseliny stimulovanú príjmom potravy znižujú približne o 30 %. Podávanie týchto relatívne vysokých dávok antimuskarinika môže eliminovať sekréciu žalúdočnej kyseliny u zdravých ľudí. Tento účinok je však menej výrazný u ľudí s peptickými vredmi.

Hoci mechanizmus účinku nie je známy, predpokladá sa, že ak antimuskariniká oddiaľujú gastrointestinálny tranzit, môžu tiež oddialiť uvoľňovanie sekretínu, čím sa oneskorí vstup kyslého stimulu do dvanástnika. Tento účinok môže nepriamo znížiť objem a aktivitu pankreatických sekrétov. Atropín znižuje sekréciu amylázy u niektorých pacientov, ktorých sekrécia pankreasu je stimulovaná sekretínom, sekretínom a inzulínom alebo sekretínom a pankreozymínom, a u niektorých pacientov s akútnou pankreatitídou. Existuje však málo dôkazov o tom, že antimuskariniká zlepšujú prognózu akútnej pankreatitídy.

Antisekrečné účinky antimuskarinika zjavne nepretrvávajú dlhší čas (zvyčajne menej ako 48 hodín) po ukončení liečby.

Pôsobenie na urogenitálny systém

Atropín a iné antimuskariniká znižujú tonus a amplitúdu kontrakcie močovodov a močového mechúra. Avšak cholinergná inervácia nie je úplne blokovaná týmito liekmi. Zdá sa, že hladké svalstvo močového mechúra je menej citlivé na antimuskarínové účinky týchto liekov ako akékoľvek iné hladké svaly (napr. gastrointestinálny trakt). U pacientov s obštrukčnou uropatiou môže antimuskarinikum spôsobiť retenciu moču. Antimuskariniká vykazujú výraznejšie účinky na neurogénny močový mechúr. U pacientov s reflexným alebo neinhibovaným neurogénym močovým mechúrom sa rozsah a frekvencia neinhibovaných kontrakcií zníži a kapacita močového mechúra sa atropínom zvýši (1 – 4 mg atropínu podaného perorálne alebo 1,2 mg podaného intravenózne). Preto je inkontinencia spolu s neinhibovanými kontrakciami oslabená a zvyškový moč, objem a frekvencia močenia sa u týchto pacientov vrátia do normálu. Antimuskariniká sú neúčinné pri inhibícii neneurogénej alebo funkčnej enurézy.

Podanie atropínu (0,5 mg i.m.) zdravým ľuďom nemá žiadny vplyv na kapacitu močového mechúra, moč alebo uretrálny tlak.

Podanie 1,2 mg atropínu i.v. vedie k rozšíreniu obličkovej panvičky, kalichov a močovodov a používa sa na zlepšenie zobrazenia močového traktu v urografických štúdiách vylučovania.

Nezdá sa, že by atropín mal farmakologický účinok na maternicu.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Absorpcia

Atropín sa rýchlo vstrebáva v gastrointestinálnom trakte. Vstrebáva sa aj zo slizníc, z oka a do určitej miery aj z neporušenej pokožky.

Distribúcia

Rýchlo sa distribuuje do celého tela. Prechádza hematoencefalickou bariérou. Čiastočne sa metabolizuje v pečeni, mierne sa viaže na plazmatické bielkoviny a vylučuje sa močom v nezmenenej forme aj ako metabolizovaný. Polčas rozpadu je približne 4 hodiny.

Atropín prechádza placentou, pričom stopy liečiva sú prítomné v materskom mlieku.

Po intramuskulárnom podaní sa atropín rýchlo absorbuje, maximálne koncentrácie dosahuje po 15 – 50 minútach a maximálne účinky muskarínu do 30 – 45 minút.

Eliminácia

Približne 30 – 50 % dávky atropínu podanej i.m. sa vylúči močom bez premeny; atropín, kyselina tropová a iné metabolity sa tiež vylučujú močom. Malé množstvá (do 3 % z celkovej podanej dávky) atropínu sa môžu vylúčiť aj ako oxid uhličitý vo vydychovanom vzduchu.

Zdá sa, že atropín nemožno odstrániť hemodialýzou.

5.3 Predklinické údaje o bezpečnosti

Účinky v predklinických štúdiách boli pozorované len pri expozíciách, ktoré boli považované za dostatočne presahujúce maximálnu expozíciu u ľudí, čo naznačuje malý význam pre klinické použitie. Atropínium-sulfát znížil plodnosť samcov potkanov, pravdepodobne v dôsledku inhibičného účinku na transport spermií a spermy počas procesu emisie.

Výsledky testov mutagenity vykonaných na baktériách boli negatívne alebo nepresvedčivé.

6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

6.1 Zoznam pomocných látok

chlorid sodný

kyselina sírová (na úpravu pH)

voda na injekcie

6.2 Inkompatibility

Nevykonalí sa štúdie kompatibility, preto sa tento liek nesmie miešať s inými liekmi.

6.3 Čas použiteľnosti

3 roky

Po prvom otvorení: Tento liek sa má použiť ihneď. Ak sa nepoužije ihneď, za čas a podmienky uchovávaní pred použitím zodpovedá používateľ.

6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

Uchovávajú sa pri teplote do 30 °C. Uchovávajú sa ampulky vo vonkajšom obale na ochranu pred svetlom. Podmienky uchovávaní po prvom otvorení lieku, pozri časť 6.3.

6.5 Druh obalu a obsah balenia

Atropine Noridem 1 mg/ml injekčný roztok je dodávaný v 2 ml čírych, bezfarebných sklenených ampulkách typu I.

Veľkosti balení: 5 × 1 ml, 10 × 1 ml, 20 × 1 ml, 50 × 1 ml a 100 × 1 ml.

6.6 Špeciálne opatrenia na likvidáciu

Len na jednorazové použitie. Zlikvidujte všetok nepoužitý roztok.

Roztok má byť číry a bezfarebný.

Všetok nepoužitý liek alebo odpad vzniknutý z lieku sa má zlikvidovať v súlade s národnými požiadavkami.

7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCII

Noridem Enterprises Limited
Makariou & Evagorou 1
Mitsi Building 3, Office 115
1065 Nicosia, Cyprus

8. REGISTRAČNÉ ČÍSLO

53/0305/25-S

9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE/PREDLŽENIA REGISTRÁCIE

Dátum prvej registrácie: 25. septembra 2025

10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

05/2026