# SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

## 1. NÁZOV LIEKU

Buscopan
20 mg/ml injekčný roztok

## 2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

Jedna ampulka (1 ml) obsahuje 20 mg butylskopolamíniumbromidu.

Pomocná látka so známym účinkom: Jedna ampulka (1 ml) obsahuje 6 mg chloridu sodného.

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1.

## 3. LIEKOVÁ FORMA

Injekčný roztok

Číry, bezfarebný roztok.

## 4. KLINICKÉ ÚDAJE

### 4.1 Terapeutické indikácie

Buscopan sa môže podávať pri dyskinézach žlčových ciest a tráviaceho traktu, pri kŕčovitej dysmenorei.

Buscopan je vhodný pri akútnych gastrointestinálnych, biliárnych a urogenitálnych spazmoch vrátane biliárnej a obličkovej koliky.

Ako prostriedok k diagnostickým a terapeutickým postupom, u ktorých môže byť vlastné prevedenie komplikované spazmom, napr. gastroduodenálna endoskopia a rádiológia.

Buscopan sa môže podávať aj deťom.

### 4.2 Dávkovanie a spôsob podávania

Dospelí a dospievajúci starší ako 12 rokov

1 – 2 ampulky Buscopanu (20 – 40 mg) sa môžu podávať pomaly intravenózne, intramuskulárne alebo subkutánne niekoľkokrát denne.

Maximálna denná dávka nesmie prekročiť 100 mg.

Dojčatá a deti

V ťažších prípadoch: 0,3 – 0,6 mg/kg telesnej hmotnosti; podáva sa pomaly intravenózne, intramuskulárne alebo subkutánne niekoľkokrát denne.

Maximálna denná dávka nesmie prekročiť 1,5 mg/kg telesnej hmotnosti.

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

## 4.3 Kontraindikácie

Injekčný roztok Buscopan je kontraindikovaný u pacientov:
- u ktorých sa v minulosti prejavila precitlivenosť na liečivo alebo na ktorúkoľvek z pomocných látok uvedených v časti 6.1,
- s neliečeným glaukómom s úzkym uhlom,
- s hypertrofiou prostaty s retenciou moču,
- s mechanickou stenózou gastrointestinálneho traktu,
- s tachykardiou,
- s megakólonom,
- s myasténiou gravis,
- s paralytickým alebo obštrukčným ileom.

Pri intramuskulárnej injekcii je Buscopan kontraindikovaný:
- u pacientov liečených antikoagulanciami, pretože sa môže objaviť intramuskulárny hematóm. U týchto pacientov sa má Buscopan podať intravenózne alebo subkutánne.

## 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.

U pacientov s nediagnostikovaným, a teda neliečeným glaukómom s uzavretým uhlom, sa môže po podaní anticholínergných liekov, ako je Buscopan, vyskytnúť zvýšenie vnútroočného tlaku. Preto majú pacienti ihneď vyhľadať pomoc oftalmológa, ak sa u nich po podaní Buscopanu vyskytne bolesť alebo sčervenanie očí so stratou zraku.

Po parenterálnej aplikácii Buscopanu sa pozorovali prípady anafylaxie zahŕňajúce šok. Tak ako u všetkých liekov spôsobujúcich podobné reakcie, aj pacientov, ktorým sa podáva injekčný roztok Buscopanu, je potrebné sledovať.

U pacientov so srdcovými ochoreniami navrhnutými na parenterálnu liečbu Buscopanom je potrebná opatrnosť. Odporúča sa sledovať týchto pacientov.

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

## 4.5 Liekové a iné interakcie

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

Súbežná liečba antagonistami dopamínu, ako napr. metoklopramid, môže viesť k zníženiu účinku oboch týchto liečiv na gastrointestinálny trakt.

Buscopan môže zvyšovať tachykardický účinok betaadrenergík.

## 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 použitiu Buscopanu počas gravidity.

Dojčenie
Nie je dostatok informácií o vylučovaní Buscopanu a jeho metabolitov do materského mlieka u ľudí. Ako opatrenie je vhodnejšie vyhnúť sa použitiu Buscopanu počas dojčenia.

Fertilita
Neuskutočnili sa žiadne štúdie o vplyve na fertilitu u ľudí (pozri časť 5.3).

## 4.7 Ovplyvnenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

Neuskutočnili sa žiadne štúdie o účinkoch na schopnosť viesť vozidlá a obsluhovať stroje. Pacientov je však potrebné upozorniť, že počas liečby Buscopanom môžu pociťovať nežiaduce účinky, ako napr. poruchy akomodácie alebo závrat. Preto sa odporúča opatrnosť pri vedení vozidiel a obsluhe strojov. Ak pacienti pocítia poruchy akomodácie alebo závrat, majú sa vyhnúť potenciálne nebezpečným činnostiam ako je vedenie vozidiel a obsluha strojov.

## 4.8 Nežiaduce účinky

Mnohé z uvedených nežiaducich účinkov možno pripísať anticholínergným vlastnostiam Buscopanu. Anticholínergné vedľajšie účinky Buscopanu sú väčšinou mierne a s obmedzeným trvaním.

Frekvencie podľa konvencií MedDRA:
veľmi časté: (≥ 1/10)
časté: (≥ 1/100 až < 1/10)
menej časté: (≥ 1/1 000 až < 1/100)
zriedkavé: (≥ 1/10 000 až < 1/1 000
veľmi zriedkavé: (< 1/10 000)
neznáme: (z dostupných údajov)

*Poruchy srdca a srdcovej činnosti*
Časté: tachykardia.

*Poruchy oka*
Časté: poruchy zaostrenia zraku.
Neznáme: mydriáza*, zvýšený vnútroočný tlak*.

*Poruchy gastrointestinálneho traktu*
Časté: sucho v ústach.

*Poruchy obličiek a močových ciest*
Neznáme: retencia moču*.

*Poruchy kože a podkožného tkaniva*
Neznáme: znížené potenie.

*Poruchy ciev*
Časté: závraty.
Neznáme: pokles krvného tlaku*, návaly horúčavy*.

*Poruchy imunitného systému*
Neznáme: anafylaktický šok* vrátane smrteľného konca, anafylaktické reakcie*, dyspnoe*, kožné reakcie* (napr. žihľavka*, vyrážka*, erytém*, svrbenie*) a ďalšie hypersenzitivity*.

* = 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
V prípade predávkovania sa môžu objaviť anticholínergné účinky.

Liečba
V prípade potreby sa majú podať parasympatomimetiká. V prípade glaukómu sa má okamžite vyhľadať pomoc oftalmológa. Kardiovaskulárne komplikácie sa majú liečiť podľa bežných liečebných postupov. V prípade respiračnej paralýzy sa má zvážiť intubácia, arteficiálna respirácia. Retencia moču môže vyžadovať katetrizáciu. Ak je to potrebné, musia sa tiež použiť vhodné podporné opatrenia.

## 5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

### 5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: Liečivá na funkčné gastrointestinálne poruchy; alkaloidy beladony, semisyntentické 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 centrálneho nervového systému. Preto sa ani nevyskytujú anticholínergné nežiaduce účinky CNS. Periférne anticholínergné účinky vyplývajú z blokády ganglia v stene orgánu, ako aj z antimuskarínovej aktivity.

### 5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Absorpcia a distribúcia

Po intravenóznom podaní sa látka rýchlo eliminuje z plazmy počas prvých 10 minút s polčasom 2 – 3 minúty. Distribučný objem (Vss) 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. Autorádiografia potvrdzuje, že butylskopolamíniumbromid neprechádza hematoencefalickou bariérou. Butylskopolamíniumbromid má nízku väzbu na plazmatické bielkoviny.

Biotransformácia a eliminácia
Hlavná metabolická cesta je hydrolytické štiepenie esterových väzieb. Polčas koncovej fázy vylučovania ($t_{1/2\gamma}$) je približne 5 hodín. Celkový klírens je 1,2 l/min. Klinické štúdie s izotopom značeným butylskopolamíniumbromidom ukázali, že po intravenóznej injekcii sa 42 až 61 % izotopom značenej látky vylúči obličkami a 28,3 až 37 % stolicou.

Podiel nezmeneného liečiva vylúčeného do moču je približne 50 %. Metabolity vylučované obličkami sa slabo viažu na muskarínové receptory, a preto sa nepredpokladá, že by prispievali k účinku butylskopolamíniumbromidu.

## 5.3 Predklinické údaje o bezpečnosti

V teste akútnej toxicity má butylskopolamíniumbromid nízky index toxicity: perorálna $LD_{50}$ bola u myší 1 000 – 3000 mg/kg, u potkanov 1 040 – 3 300 mg/kg a u psov 600 mg/kg. Znakmi 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 $LD_{50}$ bola u myší 10 – 23 mg/kg a u potkanov 18 mg/kg.

Počas 4-týždňových štúdií perorálnej toxickej dávky po opakovanom podávaní potkany tolerovali dávku 500 mg/kg =„stupeň bez nežiaducich účinkov (NOAEL)“. V dávke 2 000 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 – 1 000 mg/kg došlo k útlmu gastrointestinálnych funkcii 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 i.v. dávky 1 mg/kg boli veľmi dobre tolerované u potkanov počas 4-týždňovej štúdie. Pri dávke 3 mg/kg sa bezprostredne po podaní pozorovali kŕče. Po dávke 9 mg/kg potkany uhynuli na respiračné zlyhanie. Pri podávaní lieku psom počas 5 týždňov v dávkach 2-krát 1, 2-krát 3 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 i.m. podávaní dávky 10 mg/kg sa pozorovala dobrá systémová tolerancia, ale v mieste podávania oproti kontrolnej skupine potkanov bol vyšší výskyt poškodení svalov. V 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 katiónové liečivá, aj butylskopolamíniumbromid interaguje s cholínovým transportným systémom buniek epitelu ľudskej placenty *in vitro*. Nepotvrdil sa transfer butylskopolamíniumbromidu do kompartmentu plodu.

Čapíky s butylskopolamíniumbromidom sú lokálne dobre tolerované.

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 ušníc králikov. 2 % injekčný roztok Buscopanu 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 na kancerogenitu *in vivo* sa neuskutočnili. V dvoch štúdiách u potkanov počas 26 týždňov butylskopolamíniumbromid nevykazoval kancerogénny potenciál pri dávkach do 1 000 mg/kg.

## 6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

### 6.1 Zoznam pomocných látok

chlorid sodný
voda na injekcie

### 6.2 Inkompatibility

Tento liek sa nesmie miešať s inými liekmi, pretože nie sú dostupné štúdie kompatibility.

### 6.3 Čas použiteľnosti

5 rokov

### 6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

Uchovávajte na suchom mieste pri teplote do 25 °C.

### 6.5 Druh obalu a obsah balenia

Sklenené ampulky.

Veľkosť balenia: 5 alebo 6 ampuliek po 1 ml.
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 REGISTRÁCII

Zentiva, k.s.
U kabelovny 130
102 37 Praha 10 – Dolní Měcholupy
Česká republika

## 8. REGISTRAČNÉ ČÍSLO

73/0009/71-S

## 9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE/PREDĹŽENIA REGISTRÁCIE

Dátum prvej registrácie: 25. marca 1971
Dátum posledného predĺženia registrácie: 26. februára 2007

## 10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

10/2026