

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 precitlivosť 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 megakólomom,
- 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 anticholinergných 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 anticholinergný účinok liekov ako sú tri- a tetracyklické antidepresíva, antihistaminiká, antipsychotiká, chinidín, amantadín, disopyramid a ďalšie anticholinergiká (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 butylskopolamíumbromidu 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 obsluhu strojov. Ak pacienti pociatia 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:	($\geq 1/10$)
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

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 parasymptomimetiká. 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, 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 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 intravenóznei 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 LD₅₀ bola u myši 1 000 – 3 000 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 myši triaška a kŕče, u psov mydriáza, suchosť slizníc a tachykardia. Smrť spôsobená zastavením dýchania nastala do 24 hodín. Intravenózna LD₅₀ bola u myši 10 – 23 mg/kg a u potkanov 18 mg/kg.

Počas 4-týždňových štúdií perorálnej toxikkej 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 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 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 kationové 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 ušnic 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

Uchovávajúte 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

MAYOLY PHARMA FRANCE
3 Place Renault
92500 Rueil-Malmaison
Francúzsko

8. REGISTRÁČNÉ 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

11/2025