

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Бусколизин Форте 10 mg филмирани таблетки
Бусколизин Форте 20 mg филмирани таблетки

Buscolysin Forte 10 mg film-coated tablets
Buscolysin Forte 20 mg film-coated tablets

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към Рег. №	20260082/83
Разрешение №	71454-5, 17-03-2026
BG/MA/MP -	
Одобрение №	

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Бусколизин Форте 10 mg филмирани таблетки

Всяка таблетка съдържа 10 mg хиосцинов бутилбромид (hyoscine butylbromide).

Бусколизин Форте 20 mg филмирани таблетки

Всяка таблетка съдържа 20 mg хиосцинов бутилбромид (hyoscine butylbromide).

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филмирана таблетка

Бусколизин Форте 10 mg филмирани таблетки

Бели до почти бели, кръгли, двойноизпъкнали, филмирани таблетки с надпис „1Н“ от едната страна с черно мастило и гладки от другата страна. Приблизителен диаметър на таблетката: 5,60 mm.

Бусколизин Форте 20 mg филмирани таблетки

Бели до почти бели, кръгли, двойноизпъкнали, филмирани таблетки с надпис „2Н“ от едната страна с черно мастило и гладки от другата страна. Приблизителен диаметър на таблетката: 7,00 mm.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Бусколизин Форте е предназначен за облекчаване на спазми на стомашно-чревния тракт при възрастни и деца над 6 годишна възраст.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Възрастни и деца над 12 години: По една таблетка от 10 mg / 20 mg 3-4 пъти дневно.

Деца от 6 до 12 години: По една таблетка от 10 mg 3 пъти на ден.

Бусколизин Форте не трябва да се приема непрекъснато ежедневно или за продължителни периоди, без да се изследва причината за коремната болка.

Старческа възраст



Няма специфична информация за употребата на този продукт при пациенти в старческа възраст. Клиничните проучвания включват пациенти над 65 години, като не са докладвани нежелани реакции, специфични за тази възрастова група.

Употреба при деца

Поради дозировката, това лекарство не е показано за деца под 6-годишна възраст.

Пациенти с бъбречна и/или чернодробна недостатъчност

Не се налага корекция на дозата при пациенти с бъбречно и/или чернодробно увреждане.

Начин на приложение

Само за перорално приложение. Бусколизин Форте филмирани таблетки трябва да бъдат поглъщани цели, с достатъчно количество вода.

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активното вещество или към някоя от останалите съставки, изброени в точка 6.1
- Нелекувана тесноъгълна глаукома
- Хипертрофия на простатата
- Механична стеноза на гастроинтестиналния тракт
- Паралитичен или обструктивен илеус
- Мегаколон
- Задържане на урина поради субвезикална обструкция (напр. аденом на простата)
- Тахикардия или тахиаритмия
- Миастения гравис

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Незабавно трябва да се потърси медицинска помощ, ако силната коремна болка продължава или се влошава, или се проявява със симптоми като висока температура, гадене, повръщане, промени в чревния мотилитет, чувствителност на корема (при натиск), понижаване на кръвното налягане, загуба на съзнание или кръв в изпражненията.

Бусколизин Форте трябва да се използва с повишено внимание при състояния, характеризиращи се с тахикардия, като тиреотоксикоза, сърдечна недостатъчност и при сърдечна хирургия, където може допълнително да ускори сърдечната честота. Поради риска от антихолинергични усложнения, е необходимо повишено внимание при пациенти, предразположени към интестинална или уринарна обструкция, както и в случаи на хипертрофия на простатата със задържане на урина.

Поради възможността антихолинергичните средства да намалят изпотяването, Бусколизин Форте трябва да се прилага с повишено внимание при пациенти с пирексия.

При пациенти с недиагностицирана и следователно нелекувана тесноъгълна глаукома може да се наблюдава повишаване на вътреочното налягане при прилагането на антихолинергични средства като Бусколизин Форте. Поради това пациентите трябва да потърсят спешна офталмологична помощ, в случай че развият болезнено, зачервено око със загуба на зрение по време или след прием на Бусколизин Форте.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Антихолинергичният ефект на лекарства като три- и тетрациклични антидепресанти, антихистамини, хинидин, амантадин, антипсихотици (напр. фенотиазини, бутирофенони)



дизопирамид и други антихолинергици (напр. тиотропиум, ипратропиум, атропиноподобни съединения) може да бъде засилен от Бусколизин Форте.

Едновременната терапия с допаминови антагонисти, като метоклопрамид може да доведе до взаимно отслабване на действието върху гастро-интестиналния тракт.

Тахикардичните ефекти на бета-адренергичните средства и други лекарства, като дигоксин, могат да бъдат засилени от Бусколизин Форте.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Данните за употребата на хиосцин бутилбромид при бременни жени са ограничени. Проучванията при животни са недостатъчни по отношение на репродуктивната токсичност (вж. точка 5.3). Като превантивна мярка, Бусколизин Форте не се препоръчва по време на бременност.

Кърмене

Антихолинергичните средства могат да потиснат лактацията. Няма достатъчно данни за екскрецията на хиосцинов бутилбромид и неговите метаболити в кърмата. Не може да се изключи риск за кърмачето. Не се препоръчва употребата на Бусколизин Форте по време на кърмене.

Трябва да се вземе решение дали кърменето трябва да бъде преустановено или да се избягва лечение с Бусколизин Форте. Трябва да се вземат предвид и ползата от кърменето за детето, и ползата от терапията за майката.

Фертилитет

Не са провеждани проучвания за въздействието върху фертилитета при хората (вж. точка 5.3).

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Когато използвате Бусколизин Форте в предписаната доза, не се очаква да се прояви някакво нарушение. Въпреки това, способността за шофиране и работа с машини може да бъде намалена, ако се появят симптоми като умора, замаяност или нарушено зрение на близко разстояние.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Повечето от известните нежелани реакции се дължат на антихолинергичните свойства на Бусколизин Форте. Тези антихолинергични ефекти обикновено са леки и се отшумяват сами.

Нежеланите реакции са класифицирани по честота, като е използвана следната конвенция: нечести ($\geq 1/1\ 000$ до $< 1/100$), редки ($\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1\ 000$), много редки ($< 1/10\ 000$) и с неизвестна честота (не може да се оцени от наличните данни).

Нарушения на имунната система

Нечести: алергични кожни реакции (уртикария, обриви, сърбеж);

С неизвестна честота:* затруднено дишане (диспнея), реакции на свръхчувствителност, анафилактични реакции, анафилактичен шок с понижаване на кръвното налягане, зачервяване, обрив, зачервяване на кожата, еритем.



* Тази нежелана реакция е наблюдавана в постмаркетинговия опит. Категорията на честотата не е по-висока от „Нечести“, но може да бъде по-ниска с вероятност от 95%. Точна оценка на честотата не е възможна, тъй като нежеланата реакция не е съобщена в база данни от клинично изпитване с 1368 пациенти..

Нарушения на очите

Много редки: нарушения на акомодацията, особено при пациенти с хиперметропия, която не е подходящо коригирана; пристъп на глаукома;

Сърдечни нарушения

Нечести: тахикардия;

Съдови нарушения

Нечести: понижаване на кръвното налягане, замайване;

Стомашно-чревни нарушения

Нечести: сухота в устата (потискане на секрецията на слюнка), диария, гадене, повръщане, стомашни проблеми;

Нарушения на кожата и подкожната тъкан

Нечести: суха кожа (потискане на потната секреция), абнормно изпотяване;

Нарушения на бъбреците и пикочните пътища

Редки: нарушения на уринирането като: задържане на урина, дизурия;

Общи нарушения

Нечести: умора

Съобщаване на нежелани реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез: Изпълнителна агенция по лекарствата, ул. „Дамян Груев” №8, 1303 София, тел.: +359 2 8903417, уебсайт: www.bda.bg

4.9 Предозиране

Симптоми:

Все още не са били докладвани симптоми на отравяне в резултат на остро предозиране при хора.

В случай на предозиране трябва да се очакват антихолинергични симптоми като нарушения на зрението, тахикардия, сухота в устата, задържане на урина и зачервяване на кожата.

Експериментите с животни показват следните симптоми на отравяне при екстремно високи дози: атаксия, тремор, конвулсии, диспнея и антихолинергични ефекти (мидриаза, сухи лигавици, тахикардия и намален гастро-интестинален мотилитет с натрупване на храна в стомаха и червата). Смъртта е настъпила поради респираторна парализа.

Предприемане на мерки:

Тъй като досега не са докладвани случаи на отравяне с Бусколизин Форте, мерките по-долу се основават на теоретични съображения:

В случай на перорално натравяне – първично елиминиране на отровата. Пилокарпин локално при пациенти с глаукома; незабавно трябва да се направи консултация с офталмолог. При задължане на урина се поставя катетър. При необходимост – парасимпатомиметици.



(неостигмин 0,5 – 2,5 mg im или iv). Сърдечно-съдовите усложнения трябва да се лекуват съгласно обичайните терапевтични принципи. В случай на респираторна парализа – интубиране, механична вентилация.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Лекарства за функционални гастро-интестинални разстройства, Алкалоиди на беладона, Полусинтетични, кватернерни амониеви съединения.
АТС код: A03BB01

Хиосцинов бутилбромид е полусинтетично производно на растителното вещество скополамин. Като четвъртично амониево съединение, хиосцинов бутилбромид, няма централен, а по-скоро периферен антихолинергичен ефект. Това се основава както на инхибирането на ганглийната трансмисия, така и на инхибирането на мускариновите рецептори в гладкомускулните клетки.

Хиосцинов бутилбромид, приложен ентерално, намалява тонуса на гладката мускулатура на стомашно-чревния тракт и следователно има спазмолитичен ефект. Клинично доказаната ефективност при спазми и болки в корема може да се обясни с целевото локално действие върху никотиновите и мускариновите ацетилхолинови рецептори в мускулния слой на стомашно-чревния тракт.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция

Поради своя четвъртичен азотен атом, хиосциновият бутилбромид се абсорбира слабо само след перорално или ректално приложение. Средната абсолютна бионаличност на 100 mg хиосцинов бутилбромид (приложен като напр. филмирани таблетки, супозитории или капки) е по-малка от 1%. Въз основа на резултатите от експерименти с животни може да се приеме, че приложеният ентерално хиосцинов бутилбромид има насочен локален ефект.

След перорално приложение на единични дози бутилскополамин бромид в диапазона от 20 до 400 mg средните пикови плазмени концентрации са установени между 0,11 ng/ml и 2,72 ng/ml приблизително след 2 часа.

В същия дозов диапазон средните стойности на AUC_{0-tz} варират от 0,37 до 14,7 ng h/ ml. Средната абсолютна бионаличност на различните лекарствени форми, т.е. филмирани таблетки, супозитории и перорален разтвор, всяка от които съдържа 100 mg бутилскополамин бромид, е по-малка от 1%.

Разпределение

Хиосциновият бутилбромид има висок афинитет към мускариновите и никотиновите ацетилхолинови рецептори, като след парентерално приложение се разпределя главно в гладкомускулните клетки и интрамуралните ганглии на коремните и тазовите органи. Свързването с плазмените протеини е приблизително 4,4%.

Проучванията при животни показват, че хиосциновият бутилбромид не преминава през кръвно-мозъчната бариера (все още няма налични данни). Хиосциновият бутилбромид взаимодейва слабо с транспорта на холин в човешките клетъчни култури на плацентарния епител (K_i = 0.63 mM/L).

Биотрансформация и елиминиране



След перорално приложение на единични дози от 100 до 400 mg, крайният елиминационен полуживот е 6.2 до 10.6 часа. Хиосциновият бутилбромид се метаболизира главно чрез хидролитично разцепване на естерната връзка. Приложеният перорално хиосцинов бутилбромид се екскретира с изпражненията и урината. Приблизително 90% от радиоактивността се открива във фекалиите след перорално приложение. В зависимост от начина на приложение, до 5% от радиоактивността се открива в урината. След перорално приложение на 100 до 400 mg, средният клирънс е между 881 и 1420 L/min, като съответните обеми на разпределение са 6.13 – 11.3*10⁵ L (вероятно поради ниската системна наличност). Екскретираните през бъбреците метаболити е малко вероятно да допринесат за ефектите на хиосциновия бутилбромид поради техния нисък афинитет към мускариновите рецептори.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Остра и хронична токсичност

В проучванията за остра и хронична токсичност не са наблюдавани ефекти, свързани с терапевтичната употреба. Нивото без наблюдавани неблагоприятни ефекти (НБННЕ) за перорално приложение в 39-седмично токсикогично проучване при кучета е 30 mg/kg.

Бусколизин Форте има нисък индекс на остра токсичност: стойностите на пероралната LD50 са били 1 000-3 000 mg/kg при мишки, 1 040-3 300 mg/kg при плъхове и 600 mg/kg при кучета. Признаци на токсичност са били атаксия и намален мускулен тонус, допълнително тремор и конвулсии при мишки, мидриаза, тахикардия и сухота на лигавиците при кучета. Смъртни случаи са настъпили в рамките на 24 часа поради спиране на дишането. Стойностите на интравенозната LD50 са били 10-23 mg/kg при мишки и 18 mg/kg при плъхове.

При многократни перорални дози в проучвания с продължителност над 4 седмици, плъховете са понасяли 500 mg/kg без нежелани реакции. При 2 000 mg/kg, бутилскополамин бромид е парализирал стомашно-чревната функция, водеща до запек, чрез действие върху парасимпатиковия ганглий на висцералната област. Единадесет от 50 плъха са починали. Хематологичните и биохимичните резултати не показват дозозависими вариации.

Плъховете са понасяли 200 mg/kg в продължение на 26 седмици, докато смъртни случаи поради потискане на стомашно-чревната функция са настъпили при 250 и 1 000 mg/kg. НБННЕ (без алергични реакции) в 39-седмично перорално (капсула) проучване при кучета е бил 30 mg/kg. Повечето от клиничните находки се дължат на острите ефекти на висока доза бутилскополамин бромид (200 mg/kg). Не са наблюдавани свързани с веществото промени в хистопатологичните находки.

Многократна интравенозна доза от 1 mg/kg е била добре понесена от плъхове в 4-седмично проучване. При дози от 3 mg/kg, конвулсии са се появили веднага след инжектирането. Плъховете, на които са приложени дози от 9 mg/kg, са починали от респираторна парализа.

Кучета, третирани в продължение на 5 седмици с интравенозни дози от 2 x 1, 2 x 3 и 2 x 9 mg/kg, показват дозозависима мидриаза при всички третирани животни. Тези, получили дозата 2 x 9 mg/kg, допълнително показват атаксия, слюноотделяне и загуба на тегло и апетит. Локалната поносимост е добра.

В сравнение с контролните плъхове, многократните дози от 10 mg/kg, приложени интрамускулно, са били добре поносими системно, въпреки че мускулните лезии на мястото на инжектиране са били значително увеличени. При дози от 60 и 120 mg/kg смъртността е била повишена, а локалните лезии са се увеличили по дозозависим начин.

Мутагенен и туморогенен потенциал



Хиосциновият бутилбромид не показва никакви мутагенни или кластогенни свойства в теста на Ames или in vitro при теста за генни мутации върху V79 клетки и при теста за хромозомни аберации върху човешки лимфоцити. Хиосциновият бутилбромид не показва генотоксичност in vivo (микронуклеарен тест с костен мозък на плъх).

Няма дългосрочни проучвания върху животни за потенциал за образуване на тумори.

Две проучвания за хронична токсичност при плъхове в продължение на 26 седмици при дози до 1 000 mg/kg не показват данни за неоплазменни свойства на хиосциновия бутилбромид.

Репродуктивна токсичност

В ембриотоксични проучвания при плъхове и зайци, хиосцин бутилбромид не е показал никакви тератогенни ефекти в сегмент II при перорални дози до 200 mg/kg, приложени на плъхове с диетата; 200 mg/kg, приложени през сонда; или 50 mg/kg, приложени подкожно на зайци. Фертилитетът на плъхове не е бил повлиян от хиосцин бутилбромид. Не са провеждани пре/постнатални проучвания с хиосцин бутилбромид в перорални дози до 200 mg/kg.

Подобно на други катионни лекарства, бутилскополамин бромидът взаимодейства in vitro с холинтранспортната система на човешките плацентарни епителни клетки. Преносът на бутилскополамин бромид към феталното отделение не е доказан.

Хиосцин бутилбромид супозитории се понасят добре локално.

Специфични проучвания за локална поносимост са проведени при кучета и маймуни при многократни интрамускулни дози от 15 mg/kg в продължение на 28 дни. Само при кучета са наблюдавани малки огнища на некроза в местата на инжектиране. Хиосцин бутилбромидът е добре поносим в артериите и вените на ухото на зайци. In vitro, 2% разтвор на инжекционен бутилскополамин бромид не е предизвикал хемолитично действие при смесване с 0,1 ml човешка кръв.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Ядро на таблетката

Калциев хидроген фосфат, безводен
Нишесте, прежелатинизирано
Винена киселина
Изопропилов алкохол
Вода, пречистена
Безводен колоиден силициев диоксид
Стеаринова киселина

Филмово покритие

Поливинилов алкохол - частично хидролизиран (E 1203)
Макрогол (MW 3350) (E 1521)
Талк (E 553b)
Титанов диоксид (E 171)

Съдържание на мастилото за отпечатване

Шеллак (E 904)
Черен железен оксид (E 172)



Пропиленгликол (Е 1520)

6.2 Несъвместимости

Неприложимо.

6.3 Срок на годност

2 години

6.4 Специални условия на съхранение

Този лекарствен продукт не изисква специални условия на съхранение.

6.5 Вид и съдържание на опаковката

Alu-Alu блистери

Alu-PVC/PVDC блистери

Alu-Alu блистер в картонена опаковка, съдържаща 10, 14, 15, 20, 28, 30, 40, 50, 56, 60, 100 филмирани таблетки.

Alu-PVC/PVDC блистер в картонена опаковка, съдържаща 10, 14, 15, 20, 28, 30, 40, 50, 56, 60, 100 филмирани таблетки.

Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати на пазара.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне <и работа>

Всеки неизползван лекарствен продукт или отпадъчните материали от него трябва да се изхвърлят в съответствие с местните изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

СОФАРМА АД

ул. Илиенско шосе 16, 1220 София, България

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Бусколизин Форте 10 mg филмирани таблетки:

Бусколизин Форте 20 mg филмирани таблетки:

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Дата на първо разрешаване:

Дата на подновяване:

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

