

Spasmo-lyt® 20 mg

1. Наименование на лекарствения продукт

Spasmo-lyt

2. Качествен и количествен състав

Една обвита таблетка съдържа:

Лекарствено вещество:

Trospium chloride 20 mg

3. Лекарствена форма

Обвити таблетки (Кафяво-жълти, гланцирани, двойноизпъкнали).

4. Клинични свойства

4.1. Показания

За лечение на детрузорна нестабилност или детрузорна хиперрефлексия със симптоми често уриниране, императивна невъзможност за потискане на неконтролируеми позиви за уриниране и инконтиненция.

4.2. Дозировка и начин на употреба

Една обвита таблетка два пъти дневно (еквивал. на 40 mg trospium chloride дневно).

При пациенти с тежко увреждане на бъбреците (креатининов клирънс между 10 и 30 мл/мин/1.73м²) препоръчаната дозировка е: 1 обвита таблетка дневно или всеки втори ден (еквивал. на 20 mg trospium chloride дневно или всеки втори ден).

Обвитата таблетка трябва да се гълта цяла с чаша вода преди хранене на празен стомах.

Нуждата от продължаване на лечението трябва да се преценява на редовни интервали от 3-6 месеца.

Тъй като няма данни, употребата при деца под 12 години е противопоказана.

4.3. Противопоказания

Задържане на урина, тясноъгълна глаукома, тахиаритмия, миастения гравис, тежък улцерозен колит, токсичен мегаколон, бъбречна недостатъчност, изискваща хемодиализа (креатининов клирънс < 10 мл/мин/1.73м²) и при деца под 12 години.

4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

Троспиум хлорид трябва да се използва с внимание при пациенти:

- с обструктивни състояния на гастро-интестиналния тракт като стеноза на пилора
- с обструкция на уринарния ток с риск от задръжка на урина
- с автономна невропатия
- с хиатус херния, свързана с езофагиален рефлукс
- при които е нежелателен учестен сърдечен ритъм, напр. такива с хипертиреоидизъм, заболяване на коронарната артерия и конгестивна сърдечна недостатъчност.

Тъй като няма данни за пациенти с чернодробна недостатъчност, троспиум хлорид не се препоръчва при такива пациенти.

Троспиум хлорид се елиминира главно чрез бъбреците. Било е наблюдавано значително повишаване на плазмените нива при пациенти с тежка бъбречна недостатъчност. Поради това при такива, а също и при пациенти с лека до средна бъбречна недостатъчност трябва да се обръща специално внимание.

Преди започване на лечението трябва да се изключат органични причини за честотата на уриниране, невъзможността за задържане и уринарната инконтиненция като сърдечни заболявания, заболявания на бъбреците, полидипсия, диабет и тумори на пикочните органи.

АГЕНЦИЯ ЗА РЕГУЛИРАНЕ НА ОБРАЗОВАНИЕТО	
Имято на лекарството	
За медицинска употреба № 11-8139/17-10	
673/23.09.03	Менедж.



Тъй като лекарственият продукт съдържа пшеничено нишесте като ексципиент, хора с целиакия трябва да се консултират с лекар преди употреба.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Възможните взаимодействия са:

- Засилване на ефекта на лекарства с антихолинергично действие като напр. амантадин, трициклични антидепресанти, хинидин, антихистамини и дизопирамид, засилване на тахикардичното действие на бета-симпатомиметиците, намаляване ефикасността на засилващи перисталтиката агенти (метоклопрамид, цизаприд).

Тъй като троспиум хлорид може да повлиява гастро-интестиналните мотилитет и секреция, не трябва да се изключва възможността абсорбцията на други, едновременно приемани лекарства, да бъде променена.

Не трябва да се изключва възможността за потискане абсорбцията на троспиум хлорид от лекарства като гуар, холестирамин и холестипол. *Поради това едновременното прилагане на тези лекарства с троспиум хлорид не се препоръчва.*

Метаболитните взаимодействия на троспиум хлорид са били изпитвани *in vitro* върху цитохром Р450 ензими, включени в лекарствения метаболизъм (Р450 1А2, 2А6, 2С9, 2С19, 2А6, 2Е1, 3А4). Не е било наблюдавано влияние върху техните метаболитни способности. Тъй като троспиум хлорид се метаболизира само в малка степен и тъй като естерната хидролиза е единственият имащ значение метаболитен път, не могат да се очакват метаболитни взаимодействия.

Няма налични доказателства за клинически значими взаимодействия от клиничните изследвания или от непосредствена съобщителна система.

4.6. Бременност и кърмене

Изследванията върху животни не показват преки или непреки вредни въздействия по отношение на бременността, ембрионално/феталното развитие, раждането или постнаталното развитие (вж. т. 5.3.). При плъхове се наблюдава преминаване на троспиум хлорид през плацентата и в майчиното мляко.

За Спазмо-лит няма клинични наблюдения върху хора при налична бременност.

Трябва да се изписва с внимание на бременни или кърмачки.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

По принцип нарушенията на акомодацията могат да намалят способността за активно участие в пътният трафик и работата с машини.

Обаче изпитването на параметри, характеризиращи възможността за участие в движението (визуална ориентация, обща способност за реагиране, реакции при стрес, концентрация и координация на движенията), не са показали никакво влияние от страна на троспиум хлорид.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Могат да настъпят антихолинергични ефекти като сухост в устата, диспепсия и запек по време на лечение с троспиум хлорид.

Чести (> 1%):

Стомашно-чревна система: сухост в устата, диспепсия, запек, абдоминални болки, повръщане.

Редки (< 1%):

Пикочна система: смущения в уринирането (напр. образуване на остатъчна урина).

Сърдечно-съдова система: тахикардия.

Зрителни смущения: смущения в акомодацията (това се отнася особено за пациенти, които са далекогледни и чието зрение не е било адекватно коригирано)

Стомашно-чревна система: диария, флатуленция

Дихателна система: диспнея

Кожа: сърбежи

Организма като цяло: астения, болки в гърдния кош

В изолирани случаи (< 0.1%)

Пикочна система: задържане на урина



Сърдечно-съдова система: тахиаритмия

Кожа: ангиоедем

Черен дроб и жлъчни пътища: леко до средно повишение на нивото на серумните трансминази

4.9. Предозиране

След прилагане на максимална еднократна доза от 360 mg trospium chloride върху здрави доброволци са били наблюдавани в засилена степен сухост в устата, тахикардия и смущения в уринирането. Не е съобщавано за прояви на тежко предозиране или отравяне при хора досега. Като белези на интоксикация могат да се очакват засилени антихолинергични симптоми.

В случай на интоксикация трябва да бъдат взети следните мерки:

- стомашна промивка и намаляване на абсорбцията (напр. с активен въглен)
- локално прилагане на пилокарпин в окото при пациентите с глаукома
- катетеризация при пациенти със задръжка на урина
- лечение с парасимпатомиметици (напр. неостигмин) в случай на тежки симптоми
- назначаване на бета-блокери в случай на недостатъчно повлияване, изразена тахикардия и/или циркулаторна нестабилност (напр. първоначално 1 mg пропранолол интравенозно наред със следене на ЕКГ и кръвното налягане).

5. Фармакологични свойства

5.1. Фармакодинамични свойства

Троспиум хлорид е четвъртично производно на нортропана и поради това принадлежи към класа на парасимпатолитиците или антихолинергичните лекарства, тъй като се конкурира по зависим от концентрацията начин с ацетилхолина, ендогенен трансмитер в организма, в постсинаптичните парасимпатикови места на свързване.

Троспиум хлорид проявява голям афинитет на свързване с мускариновите рецептори на т.нар. M₁-, M₂- и M₃- подвидове, а показва незначителен афинитет към никотиновите рецептори.

Следователно антихолинергичният ефект на троспиум хлорид упражнява релаксиращо действие върху гладкомускулните тъкани и върху органите, които функционират посредством мускариновите рецептори. При предклинични, както и при клинични експерименти троспиум хлорид намалява контрактилитета на гладките мускули на гастроинтестиналния и урогениталния тракт.

Освен това той може да потисне отделянето на бронхиален секрет, слюнка, пот и очната акомодция. Досега не са наблюдавани ефекти върху ЦНС.

5.2. Фармакокинетика

След орално прилагане на троспиум хлорид максималните плазмени нива се достигат след 4-6 часа. След еднократна доза от 20 mg максималното плазмено ниво е около 6 ng/ml. В тестваните граници - 20 до 60 mg като еднократна доза - плазмените нива са пропорционални на предписаната доза. Абсолютната бионаличност на еднократна орална доза 20 mg trospium chloride (1 обвита таблетка Spasmo-lyt 20 mg) е $9.6 \pm 4.5\%$ (средна стойност \pm стандартно отклонение). При стационарни плазмени концентрации видовата вариабилност е 16%, а междувидовата е 36%.

Едновременното приемане на храна, особено ако е богата на мазнини, понижава бионаличността на троспиум хлорид. След мазна храна средната C_{max} и AUC намаляват с 15-20% от стойностите при постна храна.

Повечето от наличния в организма троспиум хлорид се екскретира непроменен чрез бъбреците, макар че малко количество (10% от реналната екскреция) се открива в урината като спироалкохол, метаболит, получен чрез естерна хидролиза. Предепното време на полуелиминиране е в границите на 10-20 часа. Не се наблюдава кумулиране. Свързването с плазмените протеини е 50-80%.

Фармакокинетичните данни при пациенти в напреднала възраст не показват големи различия. Също така няма междуполови различия.



При изследване на пациенти с тежки бъбречни нарушения (креатининов клирънс 8-32 ml/min) средната AUC е била 4-кратно по-висока, C_{max} 2-кратно по-висока и средното време на полуелиминиране е било удължено два пъти в сравнение със здрави пациенти. Няма данни при пациенти с по-малка степен на бъбречни нарушения.

Няма данни при пациенти с чернодробни заболявания.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Предклиничните данни не показват особен риск за хората, базирайки се на конвенционалните фармакологични изследвания за безопасност, токсичност на повтарящи се дози, генотоксичност, канцерогенност и репродуктивна токсичност.

При плъхове се наблюдава преминаване на троспиум хлорид през плацентата и в майчиното мляко.

6. Фармацевтични данни

6.1. Списък на помощните вещества

Sucrose, wheat starch, microcrystalline cellulose, talc, lactose monohydrate, calcium carbonate (E 170), titanium dioxide (E171), stearic acid, croscarmellose sodium, povidone, macrogol 8000, silica colloidal anhydrous, iron oxide hydrate (E 172), carmellose sodium, white bees wax, carnauba wax.

Забележка за диабетците: 1 обвита таблетка отговаря на 0.06 г въглехидрати (еквивал. на 0.005 BE)

6.2. Физико-химични несъвместимости

Няма

6.3. Срок на годност

5 години

6.4. Специални условия на съхранение

Няма

6.5. Данни за опаковката

Алуминиев блистер с ПВЦ-фолио

6.6. Препоръки при употреба

Няма

7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба

MADAUS AG

D-51101 Cologne

Germany

8. Регистрационен номер

/

9. Дата на разрешаване за употреба на лекарствения продукт

/

10 Дата на актуализация на текста

02 май 2000 г.

