

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування лікарського засобу

СПАЗМЕКС® (SPASMEX®)

Склад:

діюча речовина: троспію хлорид;

1 таблетка, вкрита плівковою оболонкою, містить 15 мг троспію хлориду;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, целюлоза мікрокристалічна, крохмаль кукурудзяний, натрію крохмальгліколят (тип А), кремнію діоксид колоїдний безводний, кислота стеаринова, повідон, Сепіфілм® LP 770 білий (гіпромелоза, целюлоза мікрокристалічна, титану діоксид (Е 171), кислота стеаринова).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: майже білі, без запаху таблетки, вкриті плівковою оболонкою, круглі, двоопуклі, з лінією розлому «SNAP-TAB» з одного боку, та тисненням «О» з другого боку, діаметром близько 9 мм. Таблетка може бути розділена на дві рівні частини.

Фармакотерапевтична група. Засоби, що застосовуються в урології. Троспії.

Код АТХ G04B D09.

Фармакологічні властивості.

Фармакокінетика.

Троспію хлорид є четвертинною амонієвою основою, похідним нортропанолу і відноситься до групи парасимпатолітиків або антихолінергетиків. Залежно від концентрації препарату конкурує з ендогенними трансмітерами ацетилхоліну на постсинаптичному рівні. Є конкурентним антагоністом ацетилхоліну на рецепторах постсинаптичних мембран гладкої мускулатури, має високу подібність до M₁- і M₃-рецепторів, більш низьку подібність до M₂-рецепторів і зв'язується з нікотинними рецепторами на незначному низькому рівні. М-холінолітик діє на периферичні М-холінорецептори. Механізм дії полягає в конкурентному інгібуванні ацетилхоліну на рецепторах постсинаптичних мембран гладкої мускулатури шлунково-кишкового тракту і сечостатевої системи. Препарат знижує тонус гладкої мускулатури сечовидільних шляхів і послаблює детрузор сечового міхура як за рахунок антихолінергічного ефекту, так і за рахунок прямої антиспастичної дії.

Має гангліоблокуючу активність. Інгібує секрецію слинних та потових залоз, паралізує акомодацию. Вплив на центральну нервову систему не спостерігається.

Виявляє дозозалежний вплив на частоту серцевих скорочень, прискорюючи їх.

Фармакокінетика.

При пероральному застосуванні препарату максимальна концентрація у плазмі крові досягається через 4–6 годин. Період напіввиведення варіює від 5 до 18 год. Не накопичується в організмі, зв'язується з білками плазми крові до 50–80 %.

Одночасний прийом їжі, особливо дієта з високим вмістом жиру, зменшує біодоступність троспію хлориду. Після прийому їжі з високим вмістом жиру середня максимальна концентрація (C_{max}) та АUC зменшувалися до 15–20 % від величин, отриманих натщесерце.

При застосуванні одноразових доз у діапазоні 20–60 мг його концентрація у плазмі крові збільшується пропорційно прийнятій дозі. Виводиться нирками, більша частина – у незміненому вигляді, менша (приблизно 10 %) – у вигляді циклічних спиртів, метаболіт формується шляхом гідролізу ефіру. Граничний період напіввиведення – 10–20 годин. Накопичення препарату не відбувається.

Не проникає через гематоенцефалічний бар'єр (не спричиняє побічних ефектів з боку центральної нервової системи).

Немає фармакокінетичних відмінностей у пацієнтів різного віку та статі.

Обмежена роль печінкового метаболізму в елімінації троспію хлориду.

Клінічні характеристики.

Показання.

Симптоматичне лікування порушень функцій сечового міхура, в тому числі нетримання сечі та/чи збільшення частоти сечовипускання, а також гострі позиви до сечовипускань у пацієнтів з гіперактивним сечовим міхуром (ідіопатична чи нейрогенна гіперактивність детрузора).

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до будь-якого компонента препарату;
- затримка сечі;
- закритокутова глаукома;
- тахіаритмія;
- міастенія гравіс;
- тяжкі хронічні запальні захворювання кишечника (виразковий коліт та хвороба Крона);
- токсичний мегаколон;
- ниркова недостатність, що потребує діалізу (кліренс креатиніну < 10 мл/хв/1,73 м²);
- гіперплазія передміхурової залози;
- інфекції сечовивідних шляхів;
- тяжкі порушення функції печінки;
- період вагітності і годування груддю;
- дитячий вік.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

При одночасному застосуванні посилює антихолінергічний ефект амантадину, трициклічних антидепресантів, хінідину, блокаторів гістамінових H₁-рецепторів, діазепіраміду.

При прийомі разом з бета-адреноміметиками посилює частоту серцевих скорочень.

При одночасному застосуванні з прокінетиками (метоклопрамідом та цисапридодом) зменшує ефект прокінетиків.

Оскільки троспію хлорид може чинити вплив на перистальтику та секрецію шлунково-кишкового тракту, не можна виключати можливість порушення абсорбції інших препаратів, що застосовуються одночасно.

При одночасному застосуванні з лікарськими засобами, які містять гуар, коlestирамін і коlestипол, зменшується резорбція троспію хлориду, тому не рекомендується одночасне застосування цих препаратів.

Троспію хлорид не змінює активності ферментативної системи цитохрому P450, тому його можна приймати разом із лікарськими засобами, які метаболізуються цією системою.

Троспію хлорид не має впливу на фармакокінетику дикоксику.

Особливості застосування.

Перед початком терапії слід виключити органічні причини збільшення частоти сечовипускань, імперативних позивів до сечовипускання та нетримання сечі, такі як захворювання серця, порушення діяльності нирок, полідіпсія, інфекції чи пухлини органів сечовивідлення.

Препарат містить лактози моногідрат як допоміжну речовину, тому пацієнтам із рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, недостатності лактази або синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції не можна застосовувати препарат.

Хворим на цукровий діабет слід враховувати, що 1 таблетка відповідає 0,14 г вуглеводу (еквівалентно 0,0115 ХО).

З обережністю застосовують препарат пацієнтам при:

- обструкції шлунково-кишкового тракту (наприклад, пілоричний стеноз);
- обструкційних порушеннях відтоку сечі з ризиком наявності залишкової сечі;
- вегетативній (автономній) невропатії;
- з хітальною грижею, що супроводжується рефлюкс-езофагітом.

З особливою обережністю застосовують пацієнтам з ішемічною хворобою серця та застійною серцевою недостатністю, пацієнтам з тахікардією, яка пов'язана з гіпертиреозом.

При печінковій та нирковій недостатності від легкого до середнього ступеня тяжкості застосовувати з обережністю.

При призначенні препарату пацієнтам з порушенням функції детрузору сечового міхура потрібно забезпечити можливість повного вивільнення сечового міхура (у тому числі катетеризація).

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність.

Безпека застосування у період вагітності не встановлена, тому дані стосовно впливу препарату на перебіг вагітності та/або ембріональний розвиток, розвиток плода, пологи і постнатальний розвиток недостатні. У зв'язку з цим Спазмекс* у період вагітності не застосовують.

Період годування груддю.

Препарат не рекомендовано застосовувати у період годування груддю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

На період лікування рекомендовано утримуватися від керування автотранспортом та роботи з потенційно небезпечними видами діяльності, що потребують підвищеної уваги і швидкості психомоторних реакцій, оскільки існує ризик розладів акомодаци та запаморочення.

Спосіб застосування та дози.

Застосовують дорослим. Приймають внутрішньо натще (до прийому їжі), не розжовуючи, запиваючи достатньою кількістю води.

Режим дозування і тривалість лікування встановлює лікар індивідуально для кожного пацієнта залежно від клінічної картини і тяжкості захворювання. Необхідність продовження лікування визначається за результатами регулярного нагляду за станом пацієнта, який проводиться з інтервалом 3-6 місяців.

Рекомендована добова доза становить 45 мг тропісію хлориду. Ця доза може бути зменшена лікарем до 30 мг.

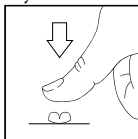
Добова доза	Режим прийому	Відповідає одно-разовій дозі
45 мг (рекомендована добова доза)	По 1 таблетці 3 рази на добу	15 мг тропісію хлориду
	або 2 таблетки вранці і 1 таблетка ввечері	30 мг тропісію хлориду 15 мг тропісію хлориду
30 мг	2 рази на добу по 1 таблетці	15 мг тропісію хлориду

Пацієнти з порушенням функції нирок

Для пацієнтів з помірною або тяжкою дисфункцією нирок (кліренс креатиніну від 10 до 50 мл/хв/1,73 м²) початкову дозу слід скоригувати залежно від тяжкості порушення функції нирок.

Рекомендована добова доза становить 1x15 мг або 2-3x7,5 мг (що відповідає 2-3x ½ таблетки). Індивідуальна доза повинна бути визначена з урахуванням індивідуальної ефективності та переносимості. Щоб добову дозу зменшити вдвічі, таблетки, вкриті оболонкою, по 15 мг можна розламати на рівні дози по 7,5 мг кожна, як показано на малюнку нижче.

Для цього таблетку слід помістити на тверду поверхню і великим пальцем натиснути на лінію розлому (різко із застосуванням сили).



Пацієнтам з тяжкими порушеннями функції нирок препарат слід застосовувати під час їди.

Пацієнти з порушенням функції печінки

Пацієнтам з легкими або помірними порушеннями функції печінки не потрібне коригування дози.

Пацієнтам з тяжкими порушеннями функції печінки препарат не слід застосовувати.

Діти.

Ефективність та безпека застосування препарату

дітям не вивчені, тому препарат не слід призначати цій віковій категорії пацієнтів.

Передозування.

Після прийому максимальної разової дози 360 мг тропісію хлориду здоровими добровольцями спостерігалися сухість у роті, тахікардія і порушення сечовипускання. До цього часу про прояви тяжкого передозування чи інтоксикації у пацієнтів не повідомлялося. Передбачуваною ознакою інтоксикації є посилення антихолінергічних проявів.

У випадку інтоксикації необхідно вжити такі заходи:

- промивання шлунка та зниження всмоктування (наприклад, активоване вугілля);
- місцеве застосування пілокарпіну пацієнтам із глаукомою;
- катетеризація у пацієнтів із затримкою сечі;
- лікування парасимпатоміметиками (наприклад, неостигміном) у випадку тяжких симптомів;
- застосування β-блокаторів у випадку недостатньої відповідної реакції, вираженої тахікардії і/чи циркуляторної нестабільності (наприклад, 1 мг пропранололу внутрішньовенно разом із контролем стану серця за допомогою ЕКГ та вимірювання артеріального тиску).

Побічні реакції.

Побічні реакції, що зустрічаються при застосуванні тропісію хлориду, систематизовані за класами органів і систем та за частотою їх виникнення: дуже часто (≥ 1/10), часто (≥ 1/100, < 1/10), нечасто (≥ 1/1 000, < 1/100), рідко (≥ 1/10 000, < 1/1 000), дуже рідко (< 1/10 000), невідомо (частоту випадків оцінити неможливо).

Найчастіше можуть виникати антихолінергічні реакції: сухість у роті, диспнесія, запор, абдомінальний біль, нудота.

Щодо інших систем в окремих випадках можна спостерігати такі побічні ефекти:

з боку сечовидільної системи: рідко – порушення сечовипускання (наприклад, утворення залишкової сечі, затримка сечі);

з боку серцево-судинної системи: нечасто – тахікардія, тахіаритмія;

з боку органів зору: рідко – порушення зору, включаючи порушення акомодаци (особливо це стосується пацієнтів з далекозорістю та пацієнтів, зр вік яких не може бути відповідним чином відкоригований);

з боку травної системи: дуже часто – сухість у роті; часто – диспнесія, запор, абдомінальний біль, нудота; нечасто – гастрит, діарея, метеоризм;

з боку гепатобіліарної системи: дуже рідко – слабке або помірне підвищення рівня трансаміназ у сироватці крові;

з боку органів дихання: невідомо – диспное;

з боку шкіри: рідко – висипання; дуже рідко – ангіоневротичний набряк; невідомо – свербіж, кропив'янка, синдром Стівенса-Джонсона (ССД)/токсичний епідермальний некроліз (ТЕН);

з боку кістково-м'язової системи: рідко – міалгія, артралгія;

з боку центральної нервової системи: нечасто – головний біль; рідко – запаморочення; невідомо – галюцинація*, сплутаність свідомості*, збудження*; з боку імунної системи: невідомо – анафілаксія; загальні розлади: астенія, біль у грудях.

*Ці побічні ефекти спостерігалися, головним чином, у пацієнтів літнього віку. Розвитку цих ефектів можуть сприяти неврологічні захворювання та/або одночасне застосування інших антихолінергічних лікарських засобів.

Термін придатності. 5 років.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці у недоступному для дітей місці при температурі не вище 25 °С.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері, 3 блістери у картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

«Др. Р. Пфлегер Хімічна Фабрика ГмбХ», Німеччина («Dr. R. Pflieger Chemische Fabrik GmbH», Germany).

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Др. Роберт Пфлегер штр. 12, 96052, Бамберг, Німеччина (Dr.-Robert-Pflieger-Str. 12, 96052, Bamberg, Germany).

Дата останнього перегляду.