

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Спазмекс, 5 мг, таблетки

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: тропсия хлорид.

Каждая таблетка содержит 5 мг тропсия хлорида.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат (см. раздел 4.3, 4.4), карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) (см. раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки.

Круглые, двояковыпуклые таблетки почти белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

Препарат Спазмекс показан к применению у взрослых и детей в возрасте от 12 лет:

- гиперактивность мочевого пузыря, сопровождающаяся недержанием мочи, императивными позывами к мочеиспусканию и увеличением частоты мочеиспусканий (при идиопатической гиперактивности детрузора негормональной и неорганической этиологии);
- смешанные формы недержания мочи;
- спастические нейрогенные нарушения функции мочевого пузыря (при нейрогенной гиперактивности (гиперрефлексии) детрузора: рассеянный склероз, спинальные травмы, врожденные и приобретенные заболевания спинного мозга, инсульты, паркинсонизм);
- детрузор-сфинктер-диссинергия на фоне интермиттирующего катетеризма;
- поллакиурия, никтурия;
- ночной и дневной энурез;
- в комплексной терапии циститов, сопровождающихся императивной симптоматикой.

4.2. Режим дозирования и способ примененияРежим дозирования

Взрослым препарат назначают индивидуально, в зависимости от клинической картины и тяжести заболевания.

Препарат принимают по 2–3 таблетки 3 раза в сутки (30–45 мг) с интервалами в 8 часов.

При суточной дозе 45 мг допустимо принимать по 30 мг утром и 15 мг вечером.

При нейрогенной гиперактивности детрузора принимают по 4 таблетки утром и вечером (что соответствует 40 мг тропсия хлорида в сутки).

Особые группы пациентов

Пациенты с нарушением функции почек

У пациентов с почечной недостаточностью (клиренс креатинина (КК) 10–30 мл/мин/1,73 м²) суточная доза препарата не должна превышать 20 мг.

В среднем, продолжительность лечения составляет 2–3 месяца. При необходимости более длительного лечения вопрос о продолжении лечения пересматривается врачом каждые 3–6 месяцев.

Дети

Детям в возрасте от 12 лет препарат назначают индивидуально, в зависимости от клинической картины и тяжести заболевания. Режим дозирования для детей в возрасте от 12 до 18 лет не отличается от режима дозирования для взрослых.

Безопасность и эффективность троспия хлорида у детей в возрасте до 12 лет не установлены (см. раздел 4.3). Данные отсутствуют.

Способ применения

Принимают внутрь, до еды, не разжевывая и запивая достаточным количеством воды.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к троспия хлориду или любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- задержка мочи;
- узкоугольная и закрытоугольная глаукома;
- тахикардия;
- миастения (myasthenia gravis);
- тяжелые хронические воспалительные заболевания кишечника (язвенный колит и болезнь Крона), токсический мегаколон, замедление эвакуации пищи из желудка и состояния, предрасполагающие к их развитию;
- почечная недостаточность, требующая проведения диализа (КК <10 мл/мин/1,73 м²);
- непереносимость галактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- детский возраст (до 12 лет) из-за отсутствия данных.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Следует соблюдать осторожность при применении препарата Спазмекс у пациентов со следующими заболеваниями:

- заболевания сердечно-сосудистой системы, при которых увеличение частоты сердечных сокращений может быть нежелательно: мерцательная аритмия, тахикардия, хроническая сердечная недостаточность (ХСН), ишемическая болезнь сердца (ИБС), митральный стеноз, артериальная гипертензия, острое кровотечение;
- тиреотоксикоз (возможно усиление тахикардии);
- повышенная температура тела (может также повышаться вследствие подавления активности потовых желез);
- рефлюкс-эзофагит, грыжа пищеводного отверстия диафрагмы, сочетающаяся с рефлюкс-эзофагитом (снижение моторики пищевода и желудка и расслабление нижнего пищеводного сфинктера могут способствовать замедлению опорожнения желудка и усилению гастроэзофагеального рефлюкса через сфинктер с нарушенной функцией);

- заболевания желудочно-кишечного тракта (ЖКТ), сопровождающиеся непроходимостью: ахалазия и стеноз привратника (возможно снижение моторики и тонуса, приводящее к непроходимости и задержке содержимого желудка);
- атония кишечника у больных пожилого возраста или ослабленных больных (возможно развитие непроходимости), паралитическая непроходимость кишечника (возможно развитие непроходимости);
- заболевание с повышенным внутриглазным давлением: открытоугольная глаукома (мидриатический эффект может вызывать некоторое повышение внутриглазного давления; может потребоваться коррекция терапии); возраст старше 40 лет (опасность проявления недиагностированной глаукомы);
- сухость во рту (длительное применение может вызывать дальнейшее усиление выраженности ксеростомии);
- почечная недостаточность (риск развития побочных эффектов вследствие снижения выведения);
- хронические заболевания легких, особенно у детей и ослабленных больных (уменьшение бронхиальной секреции может приводить к сгущению секрета и образованию пробок в бронхах);
- миастения (состояние может ухудшаться из-за ингибирования действия ацетилхолина);
- вегетативная (автономная) невропатия (задержка мочи и паралич аккомодации могут усиливаться), гиперплазия предстательной железы без обструкции мочевыводящих путей, задержка мочи или предрасположенность к ней или заболевания, сопровождающиеся обструкцией мочевыводящих путей (в т. ч. шейки мочевого пузыря вследствие гипертрофии предстательной железы);
- гестоз (возможно усиление артериальной гипертензии);
- заболевания головного мозга у детей (эффекты со стороны центральной нервной системы могут усиливаться);
- болезнь Дауна (возможно необычное расширение зрачков и повышение частоты сердечных сокращений);
- центральный паралич у детей (реакция на антихолинэргические лекарственные средства может быть наиболее выражена);
- печеночная недостаточность.

Пациентам с нарушением функции печени легкой и умеренной степени тяжести препарат следует назначать с осторожностью.

В связи с отсутствием данных о применении тропия хлорида у пациентов с тяжелым нарушением функции печени не рекомендуется назначать препарат таким пациентам.

Тропия хлорид выводится в основном через почки. У пациентов с тяжелым нарушением функции почек наблюдалось значительное повышение уровня тропия хлорида в плазме крови. Поэтому у данной группы пациентов, а также у пациентов с нарушением функции почек легкой и средней степени тяжести лечение следует проводить с осторожностью (см. раздел 4.2).

Прием препарата при нарушении функции внутреннего сфинктера уретры или детрузора мочевого пузыря должен сопровождаться полным его освобождением путем катетеризации. При вегетативных нарушениях деятельности мочевого пузыря причина дисфункции должна быть определена до начала лечения, исключены органические причины поллакиурии, никтурии и недержания мочи, такие как: сердечная недостаточность, полидипсия, возможность инфекции мочевыводящих путей и рак мочевого пузыря, так как они требуют назначения этиотропной терапии.

Вспомогательные вещества

Препарат содержит лактозу. Пациентам с редкой наследственной непереносимостью галактозы, абсолютной лактазной недостаточностью или синдромом мальабсорбции глюкозы-галактозы не следует принимать данный препарат (см. раздел 4.3).

Данный препарат содержит менее 1 ммоль (23 мг) натрия на одну таблетку, то есть, по сути, не содержит натрия.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

При одновременном применении тропия хлорид усиливает антихолинэргическое действие амантадина, трициклических антидепрессантов, хинидина, антигистаминных лекарственных средств и дизопирамида, а также положительный хронотропный эффект (увеличение частоты сердечных сокращений) бета-адреномиметиков.

Тропия хлорид ослабляет действие прокинетиков (например, метоклопрамида и цизаприда).

Так как тропия хлорид может оказывать влияние на двигательную и секреторную функции ЖКТ, не исключено, что всасывание одновременно принимаемых лекарственных средств изменится.

При одновременном приеме препаратов, содержащих такие вещества, как гуар, колестирамин и колестипол, возможно снижение всасывания тропия хлорида. Поэтому одновременное применение лекарственных средств, содержащих эти вещества, не рекомендуется.

Исследования метаболических взаимодействий с тропия хлоридом проводились *in vitro* с изоферментами цитохрома P450, участвующими в метаболизме лекарственных препаратов (CYP1A2, 2A6, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4). При этом не было выявлено влияния тропия хлорида на их метаболическую активность. Поскольку тропия хлорид метаболизируется лишь в незначительной степени и гидролиз сложных эфиров является единственным значимым путем его метаболизма, метаболических взаимодействий не ожидается.

Помимо этого, ни в ходе клинических исследований, ни в ходе фармаконадзора не было получено результатов, свидетельствующих о клинически значимых взаимодействиях.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Исследования на животных не выявили прямого или косвенного вредного воздействия на течение беременности, развитие эмбриона/плода, роды или постнатальное развитие.

При беременности препарат Спазмекс следует применять только при наличии строгих показаний, так как опыт применения препарата у беременных отсутствует.

Лактация

Применение препарата Спазмекс в период грудного вскармливания возможно только при наличии строгих показаний, так как опыт применения препарата в период грудного вскармливания отсутствует.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

В начале лечения, при увеличении дозы препарата, замене препарата, а также при взаимодействии с алкоголем возможно ухудшение зрения, что следует учитывать при управлении транспортными средствами и работе с механизмами.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

В период лечения препаратом Спазмекс могут развиваться побочные действия, вызванные, прежде всего, типичным антихолинэргическим действием тропия хлорида, такие как сухость во рту, расстройство пищеварения и запор.

Табличное резюме нежелательных реакций

Возможные нежелательные реакции, выявленные в ходе пострегистрационного применения лекарственных средств, содержащих тропия хлорид, приведены ниже в соответствии с системно-органной классификацией и с указанием частоты их возникновения. Частота возникновения нежелательных реакций классифицирована следующим образом: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Системно-органный класс	Частота	Нежелательные реакции
Нарушения со стороны иммунной системы	редко:	Анафилаксия
	частота неизвестна:	Синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз
Нарушения со стороны нервной системы	редко:	Спутанность сознания, галлюцинации
	очень редко:	Головная боль, головокружение
Нарушения со стороны органа зрения	нечасто:	Нарушение аккомодации (особенно у дальнозорких пациентов и у пациентов с недостаточной коррекцией остроты зрения)
Нарушения со стороны сердца	нечасто:	Тахикардия
	редко:	Боль за грудиной, тахиаритмия
Нарушения со стороны сосудов	редко:	Обморок, гипертензивный криз
Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения	редко:	Одышка
Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта	очень часто:	Сухость во рту
	часто:	Диспепсия, запор, боли в животе, тошнота
	нечасто:	Диарея, метеоризм
	редко:	Гастрит
Нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки	нечасто:	Кожная сыпь
	редко:	Ангioneвротический отек
Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани	редко:	Острый некроз скелетных мышц (рабдомиолиз)
Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей	нечасто:	Нарушение опорожнения мочевого пузыря
	редко:	Задержка мочи
Общие нарушения и реакции в месте введения	нечасто:	Слабость, боль в груди
Лабораторные и инструментальные данные	редко:	Повышение уровня трансаминаз от легкого до умеренного

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Телефон: +7 (800) 550-99-03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

<http://www.roszdravnadzor.gov.ru>

4.9. Передозировка

Симптомы

Максимальная разовая доза троспия хлорида при пероральном введении человеку составляла 360 мг. При этом наблюдались сухость во рту, тахикардия и нарушение мочеиспускания. О случаях серьезной передозировки или интоксикации на данный момент не сообщалось.

Признаками передозировки является усиление антихолинергических эффектов, таких как: нарушения зрения, тахикардия, сухость во рту и гиперемия кожных покровов.

Лечение

В случае интоксикации следует принять следующие меры:

- промывание желудка и прием адсорбентов (активированный уголь и др.);
- инстилляционная пилокарпина – пациентам с глаукомой;
- катетеризация мочевого пузыря при задержке мочи.

При развитии тяжелых симптомов назначают холиномиметики (неостигмина метилсульфат).

При недостаточном эффекте, выраженной тахикардии и/или нестабильности кровообращения вводят внутривенно бета-адреноблокаторы (например, 1 мг пропранолола) под контролем электрокардиограммы (ЭКГ) и артериального давления.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: средства, применяемые в урологии; средства для лечения учащенного мочеиспускания и недержания мочи.

Код АТХ: G04BD09

Механизм действия

Троспия хлорид является четвертичным аммониевым основанием, производным нортропана, относится к группе м-холиноблокаторов. Является конкурентным антагонистом ацетилхолина на рецепторах постсинаптических мембран гладкой мускулатуры. Имеет высокое сродство к м₁- и м₃-холинорецепторам, низкое сродство к м₂-холинорецепторам и незначительное сродство к никотиновым рецепторам.

Фармакодинамические эффекты

Наиболее значимым антихолинергическим эффектом тропия хлорида является расслабляющее действие на гладкомышечные ткани и органы, реализуемое через мускариновые рецепторы. Тропия хлорид снижает тонус гладкой мускулатуры желудочно-кишечного и мочеполового трактов. Снижает повышенную активность детрузора мочевого пузыря. Оказывает спазмолитическое и некоторое ганглиоблокирующее действие. Тормозит секрецию бронхиальных, слюнных и потовых желез, вызывает паралич аккомодации. Не обладает центральными эффектами.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Максимальная концентрация тропия хлорида в плазме крови ($C_{\max}$) достигается через 4–6 часов после перорального приема тропия хлорида.

Биодоступность тропия хлорида снижается при одновременном приеме пищи, особенно пищи с высоким содержанием жиров. После приема пищи с высоким содержанием жиров средние $C_{\max}$ и AUC снижались до 26 % от уровня, наблюдаемого при приеме натощак.

Распределение

Связывание с белками плазмы составляет 50–80 %.

Биотрансформация и элиминация

Период полувыведения ($T_{1/2}$) значительно варьирует и при пероральном применении составляет от 5 до 18 часов. Тропия хлорид не накапливается в организме. Концентрация тропия хлорида в плазме крови при однократном приеме внутрь 20–60 мг пропорциональна принятой дозе. Преобладающее количество тропия хлорида выводится почками в неизмененном виде, меньшая часть (около 10 %) – в виде спироалкоголя – метаболита, образующегося при гидролизе сложноэфирной связи.

Особые группы пациентов

Фармакокинетические данные не выявили существенных различий у пациентов пожилого возраста и пациентов разных полов.

Почечная недостаточность

В исследовании с участием пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (КК 8–32 мл/мин) среднее значение AUC было в 4 раза выше, а $C_{\max}$ в 2 раза выше. Период полувыведения был в два раза больше, чем у здоровых людей. Исследования с участием пациентов с нарушением функции почек умеренной степени не проводились.

Печеночная недостаточность

Результаты фармакокинетического исследования, проведенного у пациентов с нарушением функции печени умеренной и средней степени тяжести, не выявили необходимости коррекции дозы у данной группы пациентов.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Лактозы моногидрат
Крахмал кукурузный
Карбоксиметилкрахмал натрия (тип А)
Стеариновая кислота
Повидон К 25
Кремния диоксид коллоидный безводный

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

5 лет.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

При температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 10 таблеток в упаковку ячейковую контурную (блистер) из ПВХ/алюминиевой фольги.

По 3 или 5 упаковок ячейковых контурных (блистеров) вместе с инструкцией по применению помещают в картонную пачку с перфорацией места вскрытия и дополнительными клапанами для контроля первого вскрытия.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата и другие манипуляции с препаратом.

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Чешская Республика

ПРО.МЕД.ЦС Прага а.о.

Телчска 377/1, Михле, 140 00 Прага 4, Чешская Республика

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

АО «ПРО.МЕД.ЦС»,

115193, г. Москва, ул. 7-я Кожуховская, д. 15, стр. 1, этаж 4, помещение 4

Тел.: +7 (495) 664-44-11, +7 (929) 546-90-29

Эл. почта: info@promedcs.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Спазмекс доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://eec.eaeunion.org/>