

Торговое название: Бусемид.

Международное непатентованное название: гиосцина бутилбромид.

Лекарственная форма: таблетки для приема внутрь.

Состав: каждая таблетка содержит:

Гиосцина бутилбромид ВР 10 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, МКЦ, ПВП К-30, изопропиловый спирт, тальк, магнезия стеарат, натрия крахмалгликолят, кремния диоксид коллоидный безводный.

Фармакотерапевтическая группа: м-холиноблокатор.

Код АТХ: А03ВВ01.

Фармакологическое действие:

Фармакодинамика:

Оказывает местное спазмолитическое действие на гладкую мускулатуру внутренних органов (желудочно-кишечного тракта, желчевыводящих путей, мочевыводящих путей), снижает секрецию пищеварительных желез. Местное спазмолитическое действие объясняется ганглиоблокирующей и антимускариновой активностью препарата.

Будучи четвертичным аммониевым производным, гиосцина бутилбромид не проникает через ГЭБ, поэтому антихолинергическое влияние на ЦНС отсутствует.

Препарат начинает проявлять спазмолитическое действие через 15 минут после приема.

Фармакокинетика:

Будучи четвертичным аммониевым производным и обладая высокой полярностью, гиосцина бутилбромид незначительно всасывается в желудочно-кишечном тракте. После применения внутрь всасывание препарата составляет 8%. Средняя абсолютная биодоступность составляет менее 1%. После однократного применения гиосцина бутилбромида внутрь в дозах 20-400 мг средние пиковые концентрации в плазме достигались примерно через 2 часа и составляли от 0,11 до 2,04 нг/мл. Гиосцина бутилбромид вследствие высокой аффинности к мускариновым и никотиновым рецепторам распределяется главным образом в мышечных клетках органов брюшной полости и малого таза, а также в интрамуральных ганглиях органов брюшной полости. Связь с белками плазмы (альбумином) - низкая и составляет около 4,4%. Установлено, что препарат (в концентрации 1 ммоль) *in vitro* взаимодействует с транспортом холина (1,4 ммоль) в эпителиальных клетках человеческой плаценты. Терминальный период полувыведения препарата после однократного применения внутрь в дозах 100-400 мг колебался от 6,2 до 10,6 часов. Метаболизм осуществляется в основном путем гидролиза эфирной связи. После приема внутрь экскреция препарата происходит с калом и мочой. После применения препарата внутрь: почечная элиминация составляет от 2 до 5%, элиминация через кишечник - 90%. Почечная экскреция метаболитов гиосцина бутилбромида составляет менее 0,1% от величины дозы. После приема препарата внутрь в дозах 100-400 мг средние величины клиренса составляют от 881 до 1420 л/мин, тогда как соответствующие объемы распределения для того же диапазона доз варьируют от 6,13 до 11,3×10⁵ л, что может объясняться низкой системной биодоступностью.

Метаболиты, экскретирующиеся с мочой, слабо связываются с мускариновыми рецепторами, поэтому они не активны и не обладают фармакологическими свойствами.

Показания к применению:

- почечная колика;
- желчная колика;
- спастическая дискинезия желчевыводящих путей и желчного пузыря;
- холецистит;
- кишечная колика;
- пилороспазм;
- язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения (в составе комплексной терапии);
- альгодисменорея;
- синдром раздраженного кишечника (симптомы которого могут включать боли в области живота, болезненные спазмы кишечника, вздутие и метеоризм, диарею, запор).

Противопоказания:

- повышенная чувствительность к компонентам препарата;
- механический стеноз желудочно-кишечного тракта;
- паралитическая или обструктивная кишечная непроходимость;
- миастения гравис;
- мегаколон;
- беременность и период лактации;
- детский возраст до 6 лет;
- закрытоугольная глаукома;
- редкие наследственные заболевания (такие как непереносимость фруктозы, мальабсорбция глюкозы-галактозы, недостаточность сахаразы-изомальтазы).

С осторожностью следует назначать препарат в следующих клинических ситуациях: подозрение на кишечную непроходимость (в т.ч. стеноз привратника); обструкция мочевыводящих путей (в т.ч. доброкачественная гиперплазия предстательной железы), тахикардии (в т.ч. мерцательная тахикардия).

Беременность и период лактации:

Данные о применении препарата при беременности и проникновении препарата и его метаболитов в грудное молоко ограничены. Применение препарата при беременности и в период лактации не рекомендуется.

Способ применения и дозы:

Внутрь.

Если врачом не назначено иначе, рекомендуется следующий режим дозирования:

Взрослые и дети старше 6 лет: по 1 -2 таблетки 3-5 раз в день. Таблетку следует принимать целиком, запивая необходимым количеством воды.

Препарат не должен приниматься ежедневно более 3 дней без консультации врача.

Побочные действия:

Многие из перечисленных нежелательных эффектов могут быть связаны с антихолинергическими свойствами препарата. Антихолинергические побочные эффекты обычно выражены слабо и проходят самостоятельно.

Со стороны иммунной системы: анафилактический шок, анафилактические реакции, одышка, кожные реакции (например крапивница, сыпь, эритема, зуд) и другие реакции гиперчувствительности.

Со стороны ССС: тахикардия.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту.

Со стороны кожи и подкожных тканей: дисгидротическая экзема.

Со стороны мочевыделительной системы: задержка мочи.

Передозировка:

В настоящее время случаи передозировки гиосцина бутилбромида не описаны.

Симптомы: возможны антихолинергические симптомы: задержка мочи, сухость во рту, покраснение кожи, тахикардия, дыхание Чейна-Стокса, угнетение моторики ЖКТ, а также переходящие нарушения зрения.

Лечение: показано применение холиномиметиков. При глаукоме местно назначают пилокарпин (в виде глазных капель). При необходимости назначают холиномиметики для системного применения (например, вводят в/м или в/в неостигмин в дозе 0,5-2,5 мг). Сердечно-сосудистые осложнения лечат согласно обычным терапевтическим правилам. При параличе дыхательной мускулатуры показана интубация и ИВЛ. При задержке мочи - катетеризация мочевого пузыря. Проводится поддерживающая терапия.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Гиосцина бутилбромид может усиливать антихолинергическое действие трициклических и тетрациклических антидепрессантов, антигистаминных, антипсихотических препаратов, хинидина, амантадина и дизопирамида и антихолинергических препаратов (например, титропия бромида, ипратропия бромида, атропиноподобных соединений).

Одновременное применение гиосцина бутилбромида и антагонистов дофамина, например, метоклопрамида, приводит к ослаблению действия обоих препаратов на желудочно-кишечный тракт. Гиосцина бутилбромид может усиливать тахикардию, вызываемую бета-адренергическими средствами.

Особые указания:

В тех случаях, когда боль в животе неизвестного происхождения продолжается или усиливается, или когда одновременно отмечаются такие симптомы, как лихорадка, тошнота, рвота, изменения консистенции кала и частоты дефекаций, болезненность живота, снижение АД, обморок или кровь в кале, необходимо немедленно обратиться за медицинской консультацией.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами.

Исследований о влиянии препарата на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами не проводилось, однако, в связи с возможными нарушениями зрительной аккомодации, следует воздержаться от управления транспортными средствами и механизмами при наличии подобных нарушений.

Форма выпуска:

10 таблеток для приема внутрь в алу-алу блистере. Два блистера вместе с мускулатурой по применению в картонной упаковке.

Условия хранения:

Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

Указано на упаковке. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска:

Без рецепта.