

FICHA TÉCNICA

1. NOMBRE DEL MEDICAMENTO

Buscapina 20 mg solución inyectable

2. COMPOSICIÓN CUALITATIVA Y CUANTITATIVA

Una ampolla contiene 20 mg de butilbromuro de escopolamina.

Para consultar la lista completa de excipientes, ver sección 6.1.

3. FORMA FARMACÉUTICA

Solución inyectable.

Es una solución clara, desde incolora a casi incolora.

4. DATOS CLÍNICOS

4.1. Indicaciones terapéuticas

Espasmos agudos del tracto gastrointestinal, biliar y genitourinario, incluyendo cólico biliar y renal y coadyuvante en aquellos procesos de diagnóstico y terapéutica en los que el espasmo puede suponer un problema, como la endoscopia gastro-duodenal y la radiología, en adultos y adolescentes mayores de 12 años y en niños y lactantes.

4.2. Posología y forma de administración

Posología

Adultos y adolescentes mayores de 12 años: 1-2 ampollas (20-40 mg) mediante inyección intravenosa lenta, intramuscular o subcutánea, varias veces al día.

La dosis diaria máxima no debe sobrepasar los 100 mg.

Población pediátrica

Niños y lactantes: en casos graves: 0,3-0,6 mg/kg de peso corporal, administrados mediante inyección intravenosa lenta, intramuscular o subcutánea, varias veces al día.

La dosis diaria máxima no debe sobrepasar 1,5 mg/kg de peso corporal.

La duración óptima del tratamiento sintomático depende de la indicación, recomendándose para tratamientos a corto plazo. Buscapina no debe administrarse de forma continuada o durante periodos de tiempo largos sin conocer la causa del dolor abdominal.

Pacientes con insuficiencia renal y/o hepática

No se requiere ajuste de la dosis en pacientes con insuficiencia renal y/o hepática.

Forma de administración

Vía intravenosa lenta, intramuscular o subcutánea.

4.3. Contraindicaciones

Buscapina está contraindicado en las siguientes situaciones:

- hipersensibilidad al principio activo o a alguno de los excipientes (ver sección 4.4 Advertencias y precauciones especiales de empleo)
- glaucoma de ángulo estrecho no tratado
- hipertrofia prostática
- retención urinaria por cualquier patología uretro-prostática
- estenosis mecánicas del tracto gastrointestinal
- estenosis de píloro
- íleo paralítico u obstructivo
- megacolon
- taquicardia
- miastenia gravis

Buscapina administrada por inyección intramuscular está contraindicada en pacientes que están siendo tratados con medicamentos anticoagulantes puesto que pueden producirse hematomas intramusculares. En estos pacientes, se debe aplicar vía subcutánea o intravenosa.

4.4. Advertencias y precauciones especiales de empleo

En caso de que el dolor abdominal grave y de origen desconocido persista o empeore, o se presente con síntomas como fiebre, náuseas, vómitos, cambios en las defecaciones, dolor abdominal con la palpación, disminución de la tensión arterial, desmayo o presencia de sangre en heces, se deben aplicar las medidas de diagnóstico apropiadas para averiguar la etiología de los síntomas.

Debido al riesgo potencial de complicaciones anticolinérgicas debe administrarse con precaución en pacientes susceptibles de padecer glaucoma de ángulo estrecho, taquicardia, obstrucciones intestinales o urinarias, así como en caso de hipertrofia prostática con retención urinaria.

La administración de Buscapina a pacientes con glaucoma de ángulo estrecho no diagnosticado y no tratado puede producir elevación de la presión intraocular. Por esta razón, se debe advertir al paciente que si presenta después de la inyección de Buscapina un ojo rojo, doloroso, con pérdida de visión debe acudir inmediatamente al oftalmólogo.

Tras la administración parenteral de Buscapina, se han observado casos de anafilaxis incluyendo episodios de shock. Como con todos los medicamentos que producen este tipo de reacciones, los pacientes a los que se les administre Buscapina solución inyectable deberán mantenerse bajo observación.

Este medicamento contiene menos de 23 mg de sodio (1 mmol) por ampolla; esto es esencialmente “exento de sodio”.

Se requiere precaución en pacientes con afecciones cardiacas sometidos a tratamiento parenteral con Buscapina. Se recomienda la monitorización de estos pacientes.

4.5. Interacción con otros medicamentos y otras formas de interacción

Buscapina puede potenciar el efecto anticolinérgico de medicamentos como los antidepresivos tricíclicos y tetracíclicos, antihistamínicos, antipsicóticos, quinidina, amantadina, disopiramida y otros anticolinérgicos (por ejemplo tiotropio, ipratropio y compuestos similares a atropina).

El tratamiento concomitante con antagonistas dopaminérgicos tales como la metoclopramida, puede dar como resultado la disminución del efecto de ambos fármacos sobre el tracto gastrointestinal.

Puede potenciar los efectos taquicárdicos de los fármacos beta-adrenérgicos y alterar el efecto de otros fármacos, como la digoxina.

4.6. Fertilidad, embarazo y lactancia

Los datos sobre el uso de butilbromuro de escopolamina en mujeres embarazadas son limitados.

Los estudios en animales no muestran efectos dañinos directos o indirectos en referencia a la toxicidad reproductiva (ver sección 5.3. Datos preclínicos sobre seguridad).

No existen datos suficientes sobre la eliminación de Buscapina y sus metabolitos a través de la leche humana.

Como medida de precaución, es preferible evitar el uso de Buscapina durante el embarazo y la lactancia.

No se han realizado estudios de los efectos sobre la fertilidad humana (ver sección 5.3. Datos preclínicos sobre seguridad).

4.7. Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

No se han realizado estudios de los efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas. Sin embargo, debe advertirse a los pacientes que pueden experimentar efectos indeseables tal y como alteraciones de la acomodación visual o mareo durante el tratamiento parenteral con butilbromuro de escopolamina.

Por lo tanto, debe recomendarse precaución en el momento de conducir y utilizar máquinas. Si los pacientes experimentan alteraciones de la acomodación visual o mareo, deben evitar la realización de tareas peligrosas como conducir o utilizar maquinaria.

4.8. Reacciones adversas

Muchas de las reacciones adversas pueden ser asociadas a las propiedades anticolinérgicas de Buscapina solución inyectable, que por lo general son leves y autolimitadas.

Las reacciones adversas se presentan en orden decreciente de gravedad dentro de cada intervalo de frecuencia.

Trastornos del sistema inmunológico:

Frecuencia no conocida (no puede estimarse a partir de los datos disponibles): shock anafiláctico (con posible desenlace letal)*, reacción anafiláctica*, disnea*, reacción cutánea*, urticaria*, exantema*, eritema*, prurito*, hipersensibilidad*.

Trastornos oculares:

Frecuentes ($\geq 1/100$, $< 1/10$): trastornos de la acomodación visual.

Frecuencia no conocida (no puede estimarse a partir de los datos disponibles): midriasis*, aumento de la presión intraocular*.

Trastornos cardíacos:

Frecuentes ($\geq 1/100$, $< 1/10$): taquicardia.

Trastornos vasculares:

Frecuentes ($\geq 1/100$, $< 1/10$): mareo.

Frecuencia no conocida (no puede estimarse a partir de los datos disponibles): disminución de la presión arterial* y rubor*.

Trastornos gastrointestinales:

Frecuentes ($\geq 1/100$, $< 1/10$): sequedad de boca.

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo:

Frecuencia no conocida (no puede estimarse a partir de los datos disponibles): sudoración anormal*.

Trastornos renales y urinarios:

Frecuencia no conocida (no puede estimarse a partir de los datos disponibles): retención urinaria*.

*Esta reacción adversa se ha observado en la experiencia post comercialización. La frecuencia de la categoría no es mayor que Frecuente pero podría ser menor con una probabilidad del 95%. No es posible una estimación precisa de la frecuencia ya que la reacción adversa no se notificó en una base de datos de ensayos clínicos de 185 pacientes.

Notificación de sospechas de reacciones adversas:

Es importante notificar sospechas de reacciones adversas al medicamento tras su autorización. Ello permite una supervisión continuada de la relación beneficio/riesgo del medicamento. Se invita a los profesionales sanitarios a notificar las sospechas de reacciones adversas a través del Sistema Español de Farmacovigilancia de medicamentos de Uso Humano: <https://www.notificaram.es>

4.9. Sobredosis

Síntomas

En caso de sobredosificación pueden presentarse síntomas anticolinérgicos, tales como retención urinaria, sequedad de boca, rubefacción cutánea, taquicardia, inhibición de la motilidad gastrointestinal y trastornos pasajeros de la visión.

Tratamiento

Si fuera necesario, pueden administrarse parasimpaticomiméticos. Los pacientes deben consultar urgentemente a un oftalmólogo en caso de glaucoma. Las complicaciones cardiovasculares deben tratarse de acuerdo con las medidas terapéuticas habituales. Si se produce parálisis respiratoria, se practicará intubación y respiración artificial. Sondar en caso de retención urinaria.

Además, se aplicarán las medidas de soporte adecuadas, que sean necesarias.

5. PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

5.1. Propiedades farmacodinámicas

Grupo farmacoterapéutico: Alcaloides semisintéticos de la Belladona, compuestos de amonio cuaternario, código ATC: AO3BB01.

Buscapina ejerce una acción espasmolítica sobre el músculo liso de los tractos gastrointestinal, biliar y genito-urinario. Debido a su estructura de derivado de amonio cuaternario, el butilbromuro de escopolamina no pasa al sistema nervioso central y en consecuencia no se presentan efectos secundarios anticolinérgicos a nivel del sistema nervioso central. Puede aparecer una acción anticolinérgica periférica como resultado de una acción bloqueadora ganglionar a nivel de la pared visceral así como de una actividad anti-muscarínica.

5.2. Propiedades farmacocinéticas

Metabolismo y eliminación

La principal vía metabólica es la rotura hidrolítica de las uniones tipo ester. El tiempo de vida media de la fase de eliminación terminal ($t_{1/2}$) es de aproximadamente 5 horas. El aclaramiento total es de 1,2 l/min. Los estudios clínicos con butilbromuro de escopolamina radiomarcado muestran que tras la administración intravenosa entre el 42% y el 61 % de la dosis radioactiva se elimina vía renal y entre el 28,3% y el 37% vía fecal.

La porción de principio activo inalterada eliminada por orina es de aproximadamente un 50%. Los metabolitos eliminados por vía renal se unen deficientemente a los receptores muscarínicos y por tanto no se considera que contribuyan al efecto de butilbromuro de escopolamina.

5.3. Datos preclínicos sobre seguridad

Butilbromuro de escopolamina tiene un bajo índice de toxicidad aguda: los valores de la DL50 oral fueron en ratones de 1000 a 3000 mg/kg, en ratas 1040-3300 mg/kg y 600 mg/kg en perros. Los signos de toxicidad fueron ataxia y disminución del tono muscular, adicionalmente en el ratón temblor y convulsiones, en el perro midriasis, taquicardia y sequedad de las membranas mucosas. En 24 horas se produjeron muertes por parada respiratoria. Los valores de la DL50 por vía intravenosa fueron 10-23 mg/kg en ratones y 18 mg/kg en ratas.

Con dosis orales repetidas, en estudios de más de 4 semanas, las ratas toleraron 500 mg/kg sin observarse efectos adversos. A 2000 mg/kg, butilbromuro de escopolamina paralizó la función gastrointestinal dando lugar a estreñimiento, por acción sobre el ganglio parasimpático del área visceral. Fallecieron 11 de 50 ratas. La hematología y los resultados bioquímicos no sufrieron variaciones relacionadas con la dosis.

Las ratas toleraron 200 mg/kg a lo largo de 26 semanas, mientras que a 250 y 1000 mg/kg se produjeron muertes por depresión de la función gastrointestinal. El NOAEL de un estudio de administración oral (cápsulas) en perros, de 39 semanas de duración, fue de 30 mg/kg. La mayoría de los hallazgos clínicos fueron atribuibles a los efectos agudos de butilbromuro de escopolamina a dosis altas (200 mg/kg). No se observaron cambios en los hallazgos histopatológicos relacionados con la sustancia.

Una dosis intravenosa repetida de 1 mg/kg fue bien tolerada por las ratas en un estudio de 4 semanas. A dosis de 3 mg/kg, inmediatamente aparecieron convulsiones después de la inyección. Las ratas que recibieron dosis de 9 mg/kg murieron por parálisis respiratoria.

Perros tratados a lo largo de 5 semanas, con dosis intravenosas de 2 x 1; 2 x 3 y 2 x 9 mg/kg, presentaron midriasis dosis dependiente en todos los animales tratados y con la dosis de 2 x 9 mg/kg presentaron además ataxia, salivación y pérdida de peso y de apetito. La tolerancia local fue buena.

En comparación con ratas control, las dosis repetidas de 10 mg/kg, administradas intramuscularmente, fueron bien toleradas sistémicamente, aunque las lesiones musculares en el punto de inyección se incrementaron de manera manifiesta. A dosis de 60 y 120 mg/kg, la mortalidad fue elevada y las lesiones locales incrementaron en relación con la dosis.

Butilbromuro de escopolamina no fue ni teratogénica ni embriotóxica en segmento II a dosis orales de hasta 200 mg/kg, administradas a las ratas con la dieta, ni dosis de 200 mg/kg administrados mediante sonda o 50 mg/kg s.c. administrados a conejos. La fertilidad no se vio afectada a dosis orales de hasta 200 mg/kg.

Al igual que otros fármacos catiónicos, butilbromuro de escopolamina interacciona in vitro con el sistema de transporte de colina de las células epiteliales de placenta humana. La transferencia de butilbromuro de escopolamina al compartimento fetal no se ha demostrado.

Los supositorios de butilbromuro de escopolamina fueron localmente bien tolerados.

Se llevaron a cabo estudios específicos de tolerancia local en perros y monos, a dosis intramusculares repetidas de 15 mg/kg a lo largo de 28 días. Únicamente en los perros se observaron pequeños focos de necrosis en los puntos de inyección. Butilbromuro de escopolamina fue bien tolerada en las arterias y venas de la oreja del conejo. In vitro, una solución al 2% de butilbromuro de escopolamina inyectable, no dio lugar a acción hemolítica cuando fue mezclada con 0,1 ml de sangre humana.

Butilbromuro de escopolamina no reveló potencial mutagénico ni clastogénico en una batería de ensayos que incluyeron: el test de Ames, el ensayo in vitro de mutación genética con células V79 de mamífero (test

HPRT) y la prueba in vitro de aberración cromosómica con linfocitos periféricos humanos. In vivo, butilbromuro de escopolamina fue negativo en el ensayo de micronúcleos en médula ósea de ratas.

No se llevaron a cabo estudios carcinogénicos in vivo. Sin embargo, butilbromuro de escopolamina no demostró potencial tumorigénico en dos estudios de 26 semanas en los que se administraron dosis de hasta 1000 mg/kg a las ratas.

6. DATOS FARMACÉUTICOS

6.1. Lista de excipientes

Cloruro de sodio
Agua para preparaciones inyectables

6.2. Incompatibilidades

Este medicamento no debe administrarse simultáneamente con fármacos colinérgicos.

6.3. Periodo de validez

3 años

6.4. Precauciones especiales de conservación

No requiere condiciones especiales de conservación

6.5. Naturaleza y contenido del envase

Ampollas de vidrio incoloro de 1 ml en envases de 6 ampollas y envase clínico de 50 ampollas.

6.6. Precauciones especiales de eliminación y otras manipulaciones

La eliminación del medicamento no utilizado y de todos los materiales que hayan estado en contacto con él, se realizará de acuerdo con la normativa local.

7. TITULAR DE LA AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN

Sanofi - aventis, S.A.
C/ Josep Pla, 2
08019 – Barcelona
España

8. NÚMERO(S) DE AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN

18.220

9. FECHA DE LA PRIMERA AUTORIZACIÓN/ RENOVACIÓN DE LA AUTORIZACIÓN

Fecha de la primera autorización: 01 de noviembre de 1952

Fecha de la última renovación: 30 de septiembre de 2005

10. FECHA DE LA REVISIÓN DEL TEXTO

Mayo 2020