

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Дротаверин, 20 мг/мл, раствор для внутривенного и внутримышечного введения.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: дротаверин.

Каждый мл раствора содержит 20 мг дротаверина (в виде гидрохлорида).

Каждая ампула объемом 2 мл содержит 40 мг дротаверина (в виде гидрохлорида).

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: натрий, в том числе натрия дисульфит, этанол (см. раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения.

Прозрачная жидкость от зеленовато-желтого цвета до интенсивно желтого с зеленоватым оттенком цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат показан к применению у взрослых с 18 лет при следующих состояниях:

- Спазмы гладкой мускулатуры при заболеваниях желчевыводящих путей: холецистолитиаз, холангиолитиаз, холецистит, перихолецистит, холангит, папиллит.
- Спазмы гладкой мускулатуры мочевыводящих путей: нефролитиаз, уретролитиаз, пиелит, цистит, спазм мочевого пузыря.

В качестве вспомогательной терапии (когда форма таблеток не может быть применена):

- При спазмах гладкой мускулатуры желудочно-кишечного происхождения (язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, гастрит, спазмы кардии и привратника, энтерит, колит).
- При гинекологических заболеваниях (дисменорея).

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Средняя суточная доза составляет 40-240 мг дротаверина гидрохлорида (2-12 мл раствора),

разделенная на 1-3 дозы в сутки, внутримышечно.

При острых коликах (почечной или желчнокаменной) - 40-80 мг (2-4 мл раствора) разводят в 10-20 мл 0,9 % раствора натрия хлорида или 5 % раствора декстрозы, внутривенно медленно (продолжительность введения приблизительно 30 секунд).

Способ применения

Внутривенно; внутримышечно.

При необходимости продолжительного лечения переходят на прием препарата внутрь в лекарственной форме - таблетки.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к дротаверину или к любому из вспомогательных веществ препарата, перечисленных в разделе 6.1;
- гиперчувствительность к натрия метабисульфиту (дисульфиту) (см. раздел 4.4);
- тяжелая печеночная и/или почечная недостаточность;
- тяжелая хроническая сердечная недостаточность;
- детский возраст (применение у детей в клинических исследованиях не изучалось);
- период грудного вскармливания.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

При выраженном атеросклерозе коронарных артерий, аденоме предстательной железы, глаукоме, артериальной гипотензии (риск коллапса, см. раздел 4.4), беременности (см. раздел 4.6).

Особые указания

При внутривенном введении дротаверина у пациентов с пониженным артериальным давлением пациент должен находиться в горизонтальном положении в связи с риском развития коллапса.

Вспомогательные вещества

Натрий

Данный препарат содержит менее 1 ммоль (23 мг) натрия в 1 ампуле (1 дозе), то есть по сути не содержит натрия.

Натрия метабисульфит

Препарат содержит натрия метабисульфит (натрия дисульфит), который может вызывать реакции аллергического типа, включая анафилактические симптомы и бронхоспазм у

чувствительных пациентов, особенно у лиц с бронхиальной астмой или отягощенным аллергологическим анамнезом. В случае гиперчувствительности к натрия метабисульфиту парентерального применения препарата следует избегать (см. раздел 4.3).

Этанол

Данный лекарственный препарат содержит 95 % этанола (алкоголь), что соответствует 8,1 % объемного содержания, то есть до 132 мг на минимальную дозу (2 мл), что равно 3,2 мл пива или 1,35 мл вина на дозу. Этанол вреден для лиц с алкоголизмом. Необходимо учитывать беременным и кормящим грудью женщинам, детям и таким группам высокого риска, как пациенты с заболеваниями печени и эпилепсией.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

С леводопа

Ингибиторы фосфодиэстеразы (ФДЭ), подобные папаверину, ослабляют противопаркинсонический эффект леводопы. При назначении дротаверина одновременно с леводопой возможно усиление ригидности и тремора.

С папаверином, бендазолом и другими спазмолитиками (в том числе и м-холинолитиками)

Дротаверин усиливает спазмолитическое действие папаверина, бендазола и других спазмолитиков, включая м-холиноблокаторы.

С трициклическими антидепрессантами, хинидином и прокаинамидом

Усиливает гипотензию, вызываемую трициклическими антидепрессантами, хинидином и прокаинамидом.

С морфином

Снижает спазмогенную активность морфина.

С фенобарбиталом

Фенобарбитал усиливает спазмолитическое действие дротаверина.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Как показали исследования по репродуктивной токсичности у животных и ретроспективные исследования клинических данных, применение дротаверина в период беременности не оказывало ни тератогенного, ни эмбриотоксического действия. Несмотря на это, при назначении дротаверина беременным женщинам следует соблюдать осторожность и применять его только в тех случаях, когда потенциальная польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Препарат не следует применять во время родов (потенциальный риск развития послеродовых атонических кровотечений).

Лактация

В связи с отсутствием необходимых клинических данных в период лактации назначать препарат не рекомендуется.

Фертильность

Отсутствуют данные по влиянию дротаверина на фертильность человека.

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

В период лечения не рекомендуется управлять транспортными средствами, механизмами или заниматься деятельностью, требующей повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

Нежелательные реакции при применении дротаверина возникают очень редко. К наиболее серьезным из них относятся аллергические реакции и изменение артериального давления.

Резюме нежелательных реакций

Частота нежелательных реакций была определена в соответствии с классификацией Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): *очень часто* ($\geq 1/10$); *часто* ($\geq 1/100$ до $< 1/10$); *нечасто* ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$); *редко* ($\geq 1/10000$ до $< 1/1000$); *очень редко* ($< 1/10000$); *частота неизвестна* (не может быть оценена на основе имеющихся данных).

Нежелательные реакции представлены в соответствии с системно-органной классификацией в порядке уменьшения значимости.

Нарушения со стороны иммунной системы

Редко: аллергические реакции (ангионевротический отек, крапивница, сыпь, зуд) (см. раздел 4.3);

Частота неизвестна: при применении дротаверина сообщалось о развитии анафилактического шока со смертельным исходом и без смертельного исхода.

Нарушения со стороны нервной системы

Редко: головная боль, вертиго, бессонница;

Частота неизвестна: головокружение.

Нарушения со стороны сердца

Редко: учащение сердцебиения.

Нарушения со стороны сосудов

Редко: снижение артериального давления.

Желудочно-кишечные нарушения

Редко: тошнота, запор.

Общие нарушения и реакции в месте введения

Редко: реакции в месте введения препарата.

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

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»:

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

4.9. Передозировка

Симптомы

При передозировке возможно усиление дозозависимых побочных эффектов.

Передозировка дротаверина ассоциировалась с нарушениями сердечного ритма и проводимости, включая полную блокаду ножек пучка Гиса и остановку сердца, которая может быть фатальной.

Лечение

В случае передозировки пациенты должны находиться под тщательным медицинским наблюдением, и им следует проводить симптоматическую терапию и лечение, направленное на поддержание основных функций организма.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: средства для лечения функциональных нарушений желудочно-кишечного тракта; папаверин и его производные.

Код АТХ: A03AD02

Механизм действия

Дротаверин представляет собой производное изохинолина, которое проявляет мощное спазмолитическое действие на гладкую мускулатуру за счет ингибирования фермента ФДЭ. Фермент ФДЭ необходим для гидролиза циклического аденозинмонофосфата (цАМФ) до аденозинмонофосфата (АМФ). Ингибирование фермента ФДЭ приводит к повышению концентрации цАМФ, которое запускает следующую каскадную реакцию: высокие концентрации цАМФ активируют цАМФ-зависимое фосфорилирование киназы легких цепей миозина (КЛЦМ). Фосфорилирование КЛЦМ приводит к снижению ее аффинности к кальций (Ca^{2+})-кальмодулиновому комплексу, в результате чего инактивированная форма КЛЦМ поддерживает мышечное расслабление. Кроме этого, цАМФ влияет на цитозольную концентрацию Ca^{2+} , благодаря стимулированию транспорта Ca^{2+} в экстрацеллюлярное пространство и саркоплазматический ретикулум. Этот понижающий концентрацию Ca^{2+} эффект дротаверина через цАМФ объясняет антагонистический эффект дротаверина по отношению к Ca^{2+} .

In vitro дротаверин ингибирует изофермент ФДЭ-4 без ингибирования изоферментов ФДЭ-3 и ФДЭ-5. Поэтому эффективность дротаверина зависит от концентраций ФДЭ-4 в тканях, содержание которой в разных тканях различается. ФДЭ-4 наиболее важна для подавления сократительной активности гладкой мускулатуры, в связи с чем селективное ингибирование ФДЭ-4 может быть полезным для лечения гиперкинетических дискинезий и различных заболеваний, сопровождающихся спастическим состоянием желудочно-кишечного тракта (ЖКТ).

Гидролиз цАМФ в миокарде и гладкой мускулатуре сосудов происходит главным образом с помощью изофермента ФДЭ-3, чем объясняется тот факт, что при высокой спазмолитической активности у дротаверина отсутствуют серьезные нежелательные реакции со стороны сердца и сосудов и выраженные эффекты в отношении сердечно-сосудистой системы.

Фармакодинамические эффекты

Дротаверин эффективен при спазмах гладкой мускулатуры как нейрогенного, так и мышечного происхождения. Независимо от типа вегетативной иннервации, дротаверин расслабляюще действует на гладкую мускулатуру ЖКТ, желчевыводящих путей,

мочеполовой системы.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Биодоступность - 100 %. В системный кровоток поступает 65 % принятой дозы (эффект «первого прохождения» через печень). Время достижения максимальной концентрации (TC_{max}) - 45-60 мин.

Распределение

Связь с белками плазмы - 95-97 %, преимущественно с альбумином, гамма- и бета-глобулином, а также липопротеинами высокой плотности. Равномерно распределяется по тканям, проникает в гладкомышечные клетки. Не проникает через гематоэнцефалический барьер. Дротаверин и/или его метаболиты могут незначительно проникать через плацентарный барьер.

Биотрансформация

Почти полностью метаболизируется в печени путем О-дезэтилирования. Метаболиты быстро конъюгируют с глюкуроновой кислотой. Главный метаболит - 4'-дезэтилдротаверин, другие метаболиты - 6-дезэтилдротаверин и 4'-дезэтилдротавералдин.

Элиминация

Период полувыведения ($T_{1/2}$) - 8-10 ч. За 72 ч практически полностью выводится из организма, более 50 % почками (преимущественно в виде метаболитов) и около 30 % кишечником.

Неизмененный дротаверин в моче не обнаруживается.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Натрия дисульфит (натрия метабисульфит)

Этанол 95 %

Вода для инъекций

6.2. Несовместимость

Не допускается смешивание препарата с другими лекарственными средствами в одном шприце.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °C в картонной упаковке (пачке). Не замораживать.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 2 мл препарата в ампулы светозащитного нейтрального стекла тип I с цветной точкой и насечкой или с цветным кольцом излома. На ампулы дополнительно может наноситься одно цветное кольцо.

По 5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной.

1, 2, 10 или 20 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по медицинскому применению (листок-вкладыш) помещают в картонную упаковку (пачку).

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

Россия

ООО «Атолл»

445351, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Россия

ООО «Озон»

445351, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел.: +79874599991, +79874599992

E-mail: ozon@ozon-pharm.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

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