

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

НОШ-БРА, 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).

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: натрия дисульфит, этанол (см. раздел 4.3 и 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения.

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

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

Препарат НОШ-БРА показан к применению у взрослых в возрасте старше 18 лет.

- спазмы гладкой мускулатуры, связанные с заболеваниями желчевыводящих путей: холецистолитиаз, холангиолитиаз, холецистит, перихолецистит, холангит, папиллит;
- спазмы гладкой мускулатуры мочевыводящих путей: нефролитиаз, уретролитиаз, пиелит, цистит, тенезмы 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 препарата НОШ-БРА у взрослых 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) внутривенно струйно медленно (продолжительность введения приблизительно 30 секунд).

Дети

Препарат НОШ-БРА противопоказан к применению у детей до 18 лет (см. раздел 4.3).

Способ применения

Внутривенно или внутримышечно.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к дротаверину или к любому из вспомогательных веществ препарата, перечисленных в разделе 6.1;
- гиперчувствительность к натрия дисульфиту (см. раздел 4.4);
- тяжелая печеночная или почечная недостаточность;
- тяжелая хроническая сердечная недостаточность;
- детский возраст до 18 лет (применение у детей в клинических исследованиях не изучалось);
- период грудного вскармливания.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

- при артериальной гипотензии (опасность коллапса);
- у беременных женщин (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

Препарат содержит дисульфит, который может вызвать реакции аллергического типа, включая анафилактические симптомы и бронхоспазм у чувствительных лиц, особенно у лиц с астмой или аллергическими заболеваниями в анамнезе. В случае повышенной чувствительности к дисульфиту парентерального применения препарата следует избегать (см. раздел 4.3).

Данный препарат содержит этанол 95 % (до 264 мг в одной ампуле). Вреден для лиц с алкоголизмом. Необходимо учитывать при назначении пациентам из группы высокого риска, например, с заболеваниями печени и эпилепсией.

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

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

При одновременном применении может ослабить противопаркинсонический эффект леводопы.

Усиливает действие папаверина, бендазола и других спазмолитиков (в т.ч. М-холиноблокаторов), снижение артериального давления, вызываемое трициклическими антидепрессантами, хинидином и прокаинамидом.

Уменьшает спазмогенную активность морфина.

Фенобарбитал повышает выраженность спазмолитического действия дротаверина гидрохлорида.

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, при этом следует избегать назначения инъекционной лекарственной формы препарата НОШ-БРА у беременных женщин.

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

Лактация

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

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

В период лечения необходимо воздерживаться от управления транспортными средствами и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

Для оценки частоты возникновения нежелательных реакций были использованы следующие степени частоты: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10\,000$, но $< 1/1\,000$), очень редко ($< 1/10\,000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Нарушения со стороны иммунной системы

Редко – аллергические реакции (ангионевротический отек, крапивница, сыпь, зуд) (см. раздел 4.3); частота неизвестна – при применении препарата 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, снижение артериального давления.

Желудочно-кишечные нарушения

Редко – тошнота, запор.

Общие нарушения и реакции в месте введения

Редко – реакции в месте введения.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации 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

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 и фармакодинамические эффекты

Дротаверин представляет собой производное изохинолина, которое проявляет мощное спазмолитическое действие на гладкую мускулатуру за счет ингибирования фермента фосфодиэстеразы (ФДЭ). Фермент фосфодиэстераза необходим для гидролиза ц-АМФ до АМФ. Ингибирование фермента фосфодиэстеразы приводит к повышению концентрации ц-АМФ, которое запускает следующую каскадную реакцию: высокие концентрации ц-АМФ активируют ц-АМФ 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. ц-АМФ кроме этого 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 ц-АМФ 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.

Гидролиз ц-АМФ в миокарде и гладкой мускулатуре сосудов происходит главным образом с помощью изоэнзима 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.

Дротаверин эффективен при спазмах гладкой мускулатуры как нейрогенного, так и мышечного происхождения. Независимо от типа вегетативной иннервации, дротаверин расслабляюще действует на гладкую мускулатуру желудочно-кишечного тракта, желчевыводящих путей, мочеполовой системы.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Дротаверин и/или его метаболиты могут незначительно проникать через плацентарный барьер.

Распределение

In vitro – дротаверин имеет высокую связь с белками плазмы (95-97%), особенно с альбумином, γ и β -глобулинами, а также α -ЛПВП (липопротеидами высокой плотности).

Биотрансформация

У человека дротаверин почти полностью метаболизируется путем О-дезэтилирования. Его метаболиты быстро конъюгируют с глюкуроновой кислотой. Главным метаболитом является 4'-дезэтилдротаверин, кроме которого были идентифицированы 6-дезэтилдротаверин и 4'-дезэтилдротавералдин.

Элиминация

У человека для оценки показателей фармакокинетики дротаверина использовалась двухкамерная математическая модель. Конечный период полувыведения плазменной радиоактивности составлял 16 часов.

Период полувыведения составляет 8–10 часов. За 72 ч. практически полностью выводится из организма, более 50 % через почки (преимущественно в виде метаболитов) и около 30 % через кишечник. Неизменный дротаверин в моче не обнаруживается.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Натрия дисульфит

Этанол (этиловый спирт) 95 %

Вода для инъекций

6.2. Несовместимость

Данный лекарственный препарат не следует смешивать с другими лекарственными препаратами.

6.3. Срок годности (срок хранения)

5 лет.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 2, 4 мл в ампулы светозащитного стекла. По 5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из поливинилхлоридной пленки. Допускается упаковку по 5 ампул в контурную ячейковую упаковку из поливинилхлоридной пленки и гибкой упаковки на основе алюминиевой фольги или материала упаковочного комбинированного на бумажной основе.

По 1, 2, 3, 4, 5 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона для потребительской тары или картона хром-эрзац макулатурного.

Не все размеры упаковок могут быть доступны для реализации.

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

Нет особых требований к утилизации.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

АО «Брынцалов-А»

117105, г. Москва, ул. Нагатинская, д. 1;

тел.: 8 (499) 611–54–91;

тел./факс: 8 (499) 611–13–55;

<http://www.ferain.ru>.

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

АО «Брынцалов-А»

117105, г. Москва, ул. Нагатинская, д. 1;

тел.: 8 (499) 611–54–91;

тел./факс: 8 (499) 611–13–55;

<http://www.ferain.ru>.

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

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