

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

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

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: дротаверина гидрохлорид.

1 мл препарата содержит: 20 мг дротаверина гидрохлорида.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: натрия дисульфит E222 – 1 мг, этанол – 67 мг (см. разделы 4.3 и 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения.

Прозрачная или слабо опалесцирующая жидкость от светло-желтого или зеленовато-желтоватого до желтого или зеленовато-желтого цвета.

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

Спазмы гладкой мускулатуры, связанные с заболеваниями 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 примененияРежим дозирования

Внутримышечно по 2-12 мл (40-240 мг) 1-3 раза в сутки. Курс лечения 1-2 недели. При необходимости продолжительного лечения переходят на прием препарата внутрь в лекарственной форме таблетки. При острых коликах (почечной или желчекаменной болезни) – по 2-4 мл (40-80 мг) в 10-20 мл 0,9 % раствора натрия хлорида или 5 % раствора декстрозы внутривенно медленно (продолжительность введения приблизительно 30 секунд).

Способ применения

Внутримышечно, внутривенно.

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 (применение дротаверина у детей в клинических исследованиях не изучалось);
- период кормления грудью.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

- При артериальной гипотензии (опасность коллапса);
- у беременных женщин (см. раздел 4.6).

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

Препарат содержит дисульфит, который может вызывать 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. Данный лекарственный препарат содержит этанол 95 % (до 200 мг в одной ампуле). Вреден для лиц с алкоголизмом. Необходимо учитывать при назначении пациентам из группы высокого риска, например с заболеваниями печени и эпилепсией.

Препарат содержит менее 1 ммоль натрия (23 мг) в одной ампуле, то есть практически не содержит натрия.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Ослабляет противопаркинсонический эффект леводопы (усиление ригидности и тремора). Усиливает (особенно при внутривенном введении) спазмолитическое действие папаверина, бендазола и других спазмолитиков, включая м-холиноблокаторы. Усиливает гипотензию, вызываемую трициклическими антидепрессантами, хинидином, прокаинамидом.

Снижает спазмогенную активность морфина.

Фенобарбитал усиливает спазмолитическое действие дротаверина.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Применение препарата в период беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Лактация

При необходимости применения препарата в период грудного вскармливания необходимо решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

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 нежелательных реакций

Нежелательные реакции распределены в зависимости от частоты их возникновения: очень часто ($\geq 1/10$); часто (от $\geq 1/100$ до $< 1/10$); нечасто (от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$); редко (от $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$); 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.

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.

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

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

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Тел.: +7 499 578 06 70

Факс: +7 495 698 15 73

pharm@roszdravnadzor.gov.ru

www.roszdravnadzor.gov.ru

4.9. Передозировка

Симптомы

При передозировке возможно усиление дозозависимых побочных эффектов.

Атриовентрикулярная блокада, остановка сердца, паралич дыхательного центра.

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: спазмолитическое средство.

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. Кроме этого, ц-АМФ 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 побочные эффекты 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

Биодоступность – 100 %. Однако 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 дроптаверин в моче не обнаруживается.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Этанол 95 %

Натрия дисульфит

Вода для инъекций

6.2. Несовместимость

Не смешивают в одном шприце с раствором аминафиллина.

Данный лекарственный препарат не следует смешивать с другими лекарственными препаратами, за исключением упомянутых в разделе 4.2.

6.3. Срок годности (срок хранения)

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 2 мл в ампулы из окрашенного стекла.

По 5 или 10 ампул в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной или полиэтилентерефталатной с пленкой полимерной или фольгой алюминиевой лакированной или без пленки полимерной и фольги алюминиевой лакированной или в форме из картона с ячейками для укладки ампул.

По 1, 2, 5 или 10 контурных ячейковых упаковок или форм из картона с 10 ампулами или по 1, 2, 3, 4, 5, 10 или 20 контурных ячейковых упаковок или форм из картона с 5 ампулами вместе с инструкцией по применению и скарификатором ампульным или без него в пачке из картона.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата или работы с ним

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Россия

ООО «Гротекс»

195279, г. Санкт-Петербург, Индустриальный проспект, д. 71, корп. 2, лит. А

Тел.: +7 812 385 47 87

Факс: +7 812 385 47 88

grtx@grotexmed.com

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Россия

ООО «Гротекс»

195279, г. Санкт-Петербург, Индустриальный проспект, д. 71, корп. 2, лит. А

Тел.: +7 812 385 47 87

Факс: +7 812 385 47 88

safety@grotexmed.com

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

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