

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

Дротаверин, 20 мг/мл, раствор для инъекций

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: дротаверин.

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

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

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

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Раствор для инъекций.

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

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

Дротаверин показан к применению у взрослых в возрасте от 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 применима):

- 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**

Суточная средняя доза составляет 2–4 мл (40–80 мг) (разделенная на 1–3 раза в сутки) внутримышечно, подкожно.

Курс лечения 1-2 недели.

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

При острых коликах (почечной или желчнокаменной 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 сек).

Дети

Дротаверин противопоказан у детей в возрасте от 0 до 18 лет (см. раздел 4.3).

Способ применения

Внутримышечно, подкожно, внутривенно.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к действующему веществу 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;
- период грудного вскармливания;
- детский возраст (применение дромаверина у детей в клинических исследованиях не изучалось).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

С осторожностью следует назначать при артериальной гипотензии, выраженном атеросклерозе коронарных артерий, аденоме простаты, глаукоме, беременности (см. раздел 4.6). Препарат содержит дисульфит, который может вызывать реакции аллергического типа, включая анафилактические симптомы и бронхоспазм у чувствительных лиц с астмой или аллергическими заболеваниями в анамнезе. В случае повышенной чувствительности к дисульфиту парентерального применения препарата следует избегать (см. раздел. 4.3). При внутривенном введении дромаверина у пациентов с пониженным артериальным давлением пациент должен находиться в горизонтальном положении в связи с риском развития коллапса.

Вспомогательные вещества

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

Данный лекарственный препарат содержит 95 об. % этанола (алкоголя), то есть до 134 мг на дозу (1 ампула), что равно 5,4 мл пива, 2,2 мл вина на дозу. 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

Дромаверин ослабляет противопаркинсонический эффект леводопы (усиление ригидности и тремора).

Дромаверин усиливает (особенно при внутривенном введении) спазмолитическое действие папаверина, бендазола и других спазмолитиков, включая м-холиноблокаторы.

Дромаверин усиливает гипотензию, вызываемую трициклическими антидепрессантами, хинидином и прокаинамидом.

Дромаверин снижает спазмогенную активность морфина.

Фенобарбитал усиливает спазмолитическое действие дромаверина.

4.6. Беременность и период лактации

Беременность

Как показали исследования по репродуктивной токсичности у животных и ретроспективные исследования клинических данных, применение дромаверина в период беременности не оказывало ни тератогенного, ни эмбриотоксического действия. Несмотря на это, при назначении дромаверина 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 Дромаверин 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 лактации назначать препарат не рекомендуется (см. раздел 4.3).

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

В период применения препарата не рекомендуется выполнение потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций (управление транспортными средствами, работа с движущимися механизмами, работа диспетчера, оператора).

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Нежелательные реакции (НР) сгруппированы по системно-органным классам в соответствии со словарем MedDRA и частотой развития НР ВОЗ: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1\,000$, 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.

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

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

Адрес в интернете: <https://roszdravnadzor.gov.ru/>

4.9. Передозировка

При передозировке возможно усиление дозозависимых нежелательных реакций.

Симптомы

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

Код АТХ: A03AD02

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Дротаверин – производное изохинолина, по химической структуре и фармакологическим свойствам близок к папаверину, но оказывает более выраженное и продолжительное действие. Дротаверин обладает выраженным спазмолитическим действием на гладкие мышцы за счет ингибирования фосфодиэстеразы-4 (ФДЭ-4). ФДЭ-4 гидролизует циклический аденозинмонофосфат (цАМФ) до аденозинмонофосфат АМФ. Ингибирование ФДЭ-4 приводит к повышению концентрации цАМФ, который активирует цАМФ-зависимое фосфорилирование киназы легких цепей миозина (КЛЦМ). Фосфорилирование КЛЦМ приводит к снижению ее аффинности к ионам кальция – кальмодулиновому комплексу, в результате чего инактивированная форма КЛЦМ поддерживает мышечное расслабление. цАМФ, кроме этого, влияет на цитозольную концентрацию ионов кальция, благодаря стимулированию транспорта ионов кальция в экстрацеллюлярное пространство и саркоплазматический ретикулум.

In vitro – дротаверин ингибирует изофермент ФДЭ-4 без ингибирования изоферментов ФДЭ-3 и ФДЭ-5, поэтому эффективность дротаверина зависит от активности ФДЭ-4, содержание которой в разных тканях различное. Высокое содержание ФДЭ-4 отмечается в желче- и мочевыводящих путях, матке, желудочно-кишечном тракте. Гидролиз цАМФ в миокарде и гладких мышцах кровеносных сосудов происходит, главным образом, с помощью ФДЭ-3, поэтому дротаверин меньше влияет на сердечно-сосудистую систему. Дротаверин эффективен при спазмах гладкой мускулатуры как нейрогенного, так и мышечного происхождения.

5.2. Фармакокинетические свойства

Распределение

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

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'-дезэтилдротаверин.

Элиминация

У человека для оценки показателей фармакокинетики дротаверина использовались 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. Неизмененный дротаверин в моче не обнаруживается.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Натрия дисульфит (натрия метабисульфит).

Этанол (спирт этиловый) 95 %.

Динатрия эдетат (динатриевая соль этилендиаминтетрауксусной кислоты).

Бензетония хлорид (бензэтония хлорид).

Натрия сульфит безводный.

Лимонная кислота.

Натрия цитрат.

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

В защищенном от света месте при температуре от 15 до 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 2 мл в ампулы светозащитного стекла с точками надлома или кольцами.

По 10 ампул вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в коробку из картона.

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

По 1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона.

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 «ДАЛЬХИМФАРМ»

Адрес: 680001, Хабаровский край, г. Хабаровск, ул. Ташкентская, д. 22

Тел/факс: (4212) 53-91-86.

Адрес электронной почты: info@dhph.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

АО «ДАЛЬХИМФАРМ»

Адрес: 680001, Хабаровский край, г. Хабаровск, ул. Ташкентская, д. 22

Тел/факс: (4212) 53-91-86.

Адрес электронной почты: info@dhph.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

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