

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).

Вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: натрия метабисульфит, этанол (см. раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Раствор для инъекций.

Прозрачная жидкость зеленовато-желтого цвета.

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

Препарат Дротаверин показан к применению у взрослых при:

- Спазмах гладкой мускулатуры, связанные с заболеваниями желчевыводящих путей: холецистолитиаз, холангиолитиаз, холецистит, перихолецистит, холангит, папиллит.
- Спазмах 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;
- 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) внутривенно струйно медленно (продолжительность введения приблизительно 30 секунд).

Дети

Препарат Дротаверин противопоказан к применению у детей от 0 до 18 лет (см. раздел 4.3).

Способ применения

Внутривенно и внутримышечно.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к действующему веществу или к любому из вспомогательных веществ препарата.
- Гиперчувствительность к натрию метабисульфиту (см. раздел 4.4.).
- Тяжелая печеночная или почечная недостаточность.
- Тяжелая хроническая сердечная недостаточность.
- Дети от 0 до 18 лет.
- 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), беременность.

Особые указания

При внутривенном введении препарата пациент должен находиться в горизонтальном положении в связи с риском развития коллапса.

Вспомогательные вещества

Препарат содержит натрия метабисульфит, который может вызывать реакции аллергического типа, включая анафилактические симптомы и бронхоспазм у предрасположенных пациентов, особенно у пациентов с бронхиальной астмой или отягощенным аллергологическим анамнезом.

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

С леводопы

Ингибиторы фосфодиэстеразы, 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 фенobarбиталом

Фенobarбитал усиливает спазмолитическое действие дроперамина.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Применение препарата при беременности возможно 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

При необходимости применения препарата в период лактации необходимо отказаться от грудного вскармливания.

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 (в течение 1 часа после парентерального введения, особенно внутривенного).

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Ниже представлены нежелательные реакции, наблюдавшиеся в клинических исследованиях, разделенные по системно-органным классам с указанием частоты их возникновения в соответствии со следующим правилом:

очень часто ($\geq 1/10$);

часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$);

нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$);

редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$);

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.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

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

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

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Телефон: +7 800-550-99-03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru или npr@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

<https://roszdravnadzor.gov.ru>

4.9. Передозировка

Симптомы

При передозировке возможно усиление дозозависимых побочных эффектов.

Передозировка дротаверина может приводить к нарушениям 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 – миотропный спазмолитик. Производное изохинолина, по химической структуре и фармакологическим свойствам близок к папаверину, но оказывает более выраженное и продолжительное действие. Дротаверин уменьшает поступление ионов кальция в гладкомышечные клетки и обладает мощным спазмолитическим действием на гладкие мышцы за счет селективного ингибирования фермента фосфодиэстеразы 4 типа (ФДЭ-4) и внутриклеточного накопления цАМФ.

Фермент ФДЭ-4 гидролизует циклический аденозинмонофосфат (цАМФ) до аденозинмонофосфата (АМФ). Ингибирование ФДЭ-4 приводит к повышению концентрации цАМФ, которая активирует цАМФ-зависимое фосфорилирование киназы легких цепей миозина (КЛЦМ). Фосфорилирование КЛЦМ приводит к понижению ее аффинности к 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 экстраклеточное пространство и саркоплазматический ретикулум. Этот эффект дротаверина по понижению цитозольной концентрации Ca^{2+} через цАМФ объясняет антагонистический эффект дротаверина по отношению к Ca^{2+} .

In vitro дротаверин ингибирует изофермент ФДЭ-4 без ингибирования изоферментов ФДЭ3 и ФДЭ-5. Поэтому эффективность дротаверина зависит от концентраций ФДЭ-4 в тканях, содержание которой в разных тканях различается. Высокое содержание ФДЭ-4 отмечается в желчевыводящих и мочевыводящих путях, желудочно-кишечном тракте (ЖКТ), матке. ФДЭ-4 наиболее важна для подавления сократительной активности гладкой мускулатуры, в связи с чем селективное ингибирование ФДЭ-4 полезно для лечения гиперкинетических дискинезий и различных заболеваний, сопровождающихся спастическим состоянием 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 выраженные терапевтические эффекты и побочные реакции в отношении сердечно-сосудистой системы. Дротаверин эффективно устраняет спазмы гладкой мускулатуры нейрогенной и мышечной этиологии. Независимо от типа вегетативной иннервации, дротаверин расслабляет гладкую мускулатуру ЖКТ, желчевыводящих путей, мочеполовой системы.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

При парентеральном введении быстро всасывается. Биодоступность – 100 %. Начало действия дротаверина – через 2–4 мин. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 30–40 мин.

Дротаверин и/или его метаболиты могут проникать через плацентарный барьер. Не проникает через гематоэнцефалический барьер.

Распределение

Связь с белками плазмы крови – 95–97 %, преимущественно с альбумином, гамма- и бетаглобулинами, а также липопротеинами высокой плотности.

Биотрансформация

Почти полностью метаболизируется в печени путем О-деэтилирования. Метаболиты быстро конъюгируют с глюкуроновой кислотой. Главный метаболит – 4'-деэтилдротаверин, другие метаболиты – 6-деэтилдротаверин и 4'-деэтилдротавералдин.

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 % через кишечник. Неизмененный дротаверин в моче не обнаруживается.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Натрия метабисульфит

Спирт этиловый 95%

Вода для инъекций

6.2. Несовместимость

Данный лекарственный препарат не следует смешивать с другими лекарственными препаратами.

6.3. Срок годности (срок хранения)

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

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

6.5. Характер и содержание упаковки

По 2 мл препарата в ампулы нейтрального стекла марки НС-3 с кольцом или точкой излома. На каждую ампулу наносится этикетка.

По 5 или 10 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной без покрытия. По 1 или 2 контурных ячейковых упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в картонную пачку.

6.6. Особые меры предосторожности при утилизации 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

Общество с ограниченной ответственностью «МОСФАРМ» (ООО «МОСФАРМ»)

141342, Московская обл., Сергиево-Посадский р-н, рп. Богородское, д. 63, литер Б, помещение 32, этаж 2.

Тел./Факс. 8 (496) 5453000

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

Общество с ограниченной ответственностью «МОСФАРМ» (ООО «МОСФАРМ»)

141342, Московская обл., Сергиево-Посадский р-н, рп. Богородское, д. 63, литер Б, помещение 32, этаж 2.

Тел./Факс. 8 (496) 5453000.

8. НОМЕР (НОМЕРА) РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лекарственный препарат относится к категории отпуска по рецепту.

Общая характеристика лекарственного препарата Дротаверин доступна в едином реестре зарегистрированных лекарственных средств Евразийского экономического союза и на официальном сайте уполномоченного органа (экспертной организации)
https://lk.regmed.ru/EAEU_SmPC