

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО

ПРЕПАРАТА

ДРОТАВЕРИН



Регистрационный номер:

Торговое наименование: Дротаверин

Международное непатентованное наименование: дротаверин

Лекарственная форма: раствор для инъекций

Состав на 1 мл:

Действующее вещество: Дротаверина гидрохлорид – 20,0 мг;

Вспомогательные вещества: Натрия метабисульфит – 1,0 мг; спирт этиловый 95% - 67,0 мг;
вода для инъекций до 1,0 мл.

Описание:

Прозрачная жидкость зеленовато-желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа:

спазмолитическое средство

Код АТХ:

[A03AD02

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

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 экстрацеллюлярное

139225

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.

Фармакокинетика

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.

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

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. 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.

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, 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.

Противопоказания

Гиперчувствительность к действующему веществу или к любому из вспомогательных веществ препарата.

Гиперчувствительность к натрию дисульфиту (см. раздел «Особые указания»).

– Тяжелая печеночная или почечная недостаточность.

– Тяжелая хроническая сердечная недостаточность.

– Детский возраст (применение дротаверина у детей в клинических исследованиях не изучалось).

– Период кормления грудью.

С осторожностью

При выраженном атеросклерозе коронарных артерий, аденоме предстательной железы, глаукоме, артериальной гипотензии (риск коллапса), беременность.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

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).

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

Способ применения и дозы

Внутривенно и внутримышечно.

Взрослые: 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).

Побочное действие

Ниже представлены неблагоприятные реакции, наблюдавшиеся в клинических исследованиях, разделенные по системам органов с указанием частоты их возникновения в соответствии со следующими градациями: очень часто ($\geq 10\%$), часто ($\geq 1\%$ и $< 10\%$), нечасто ($\geq 0,1\%$ и $< 1\%$), редко ($\geq 0,01\%$ и $< 0,1\%$), и очень редко, включая отдельные

сообщения (< 0,01%), неизвестная частота (по имеющимся данным частоту определить нельзя).

Со стороны сердечно-сосудистой системы

Редко – учащение сердцебиения, снижение артериального давления.

Со стороны центральной нервной системы

Редко: головная боль, вертиго, бессонница.

Частота неизвестна: головокружение.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Редко: тошнота, запор.

Со стороны иммунной системы

Редко: аллергические реакции (ангионевротический отек, крапивница, сыпь, зуд) (смотри раздел «Противопоказания»). Частота неизвестна: при применении препарата сообщалось о развитии анафилактического шока со смертельным исходом и без смертельного исхода.

Местные реакции

Редко: реакции в месте введения.

Передозировка

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.

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

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

С леводопой

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 прокаиномидом

Усиливает гипотензию, вызываемую трициклическими антидепрессантами, хинидином и прокаиномидом.

С морфином

Снижает спазмогенную активность морфина.

С фенобарбиталом

Фенобарбитал усиливает спазмолитическое действие дротаверина.

Особые указания

При внутривенном введении препарата пациент должен находиться в горизонтальном положении в связи с риском развития коллапса. 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. В случае гиперчувствительности к натрия метабисульфиту парентерального применения препарата следует избегать (см. раздел «Противопоказания»).

Влияние на способность управлять транспортными средствами, 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).

Форма выпуска

Раствор для инъекций.

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.

Условия хранения

В защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С. Не замораживать. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

ООО «МОСФАРМ», Россия

Московская обл., Сергиево-Посадский муниципальный р-н, г.п. Богородское, рп. Богородское, д. 63

Владелец регистрационного удостоверения/организация, принимающая претензии от потребителя

ООО «МОСФАРМ», Россия, 141342, Московская обл., Сергиево-Посадский р-н, рп.
Богородское, д. 63, литер Б, помещение 32, этаж 2.
Тел./Факс. 8 (496) 5453000.

Первый заместитель
Генерального директора
ООО «МОСФАРМ»



Поминов Е.В.

139225

