

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ДРОТАВЕРИН

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Дротаверин

Международное непатентованное наименование: дротаверин

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Состав:

Действующее вещество:

Дротаверина гидрохлорид	-	20,0 мг
-------------------------	---	---------

Вспомогательные вещества:

Натрия дисульфит (натрия метабисульфит)	-	1,0 мг
---	---	--------

Этанол 95 %	-	66,7 мг
-------------	---	---------

Вода для инъекций	до	1,0 мл
-------------------	----	--------

Описание: прозрачный раствор зеленовато-желтого цвета.

Фармакологическая группа: спазмолитическое средство.

Код АТХ A03AD02

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Дротаверин представляет собой производное изохинолина, по химической структуре и фармакологическим свойствам близок к папаверину, но более выраженное и продолжительное действие. Дротаверин обладает выраженным спазмолитическим действием на гладкие мышцы за счет ингибирования фермента фосфодиэстеразы-4 (ФДЭ-4). Фермент ФДЭ-4 необходим для гидролиза циклического аденозинмонофосфата (цАМФ) до аденозинмонофосфата (АМФ). Ингибирование фермента ФДЭ-4 приводит к повышению концентрации цАМФ, которое запускает следующую каскадную реакцию: высокие концентрации цАМФ активируют цАМФ зависимое фосфорилирование киназы легких цепей миозина (КЛЦМ). Фосфорилирование КЛЦМ приводит к понижению ее аффинности к ионам кальция – кальмодулиновому комплексу, в результате чего инактивированная форма КЛЦМ поддерживает мышечное расслабление. Кроме этого, цАМФ влияет на цитозольную концентрацию ионов кальция, благодаря стимулированию транспорта ионов кальция в экстрацеллюлярное пространство и саркоплазматический ретикулум. Этот понижающий концентрацию ионов кальция эффект дротаверина через цАМФ объясняет антагонистический эффект дротаверина по отношению к ионам кальция.

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 различное. Высокое содержание отмечается в желче- и мочевыводящих путях, матке, желудочно-кишечном тракте. 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 (ЖКТ).

Гидролиз цАМФ в миокарде и гладких мышцах кровеносных сосудов происходит, главным образом, с помощью 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 расслабляет гладкую мускулатуру ЖКТ, желчевыводящих путей, мочеполовой системы.

Фармакокинетика

Биодоступность 100 %. Дротаверин и его метаболиты могут проникать через плацентарный барьер. Не проникает через гематоэнцефалический барьер. Связь с белками плазмы – 95-97 %. За 72 часа практически полностью выводится из организма.

При парентеральном введении действие препарата проявляется через 2-4 минуты. Максимальный эффект наступает через 30 минут. Высвобождается из связи с белками плазмы крови постепенно, обеспечивая продолжительное действие. Период полувыведения 2-4 часа.

Метаболизм осуществляется в печени, основная часть метаболитов выделяется почками. 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.

Показания к применению

- спазмы гладкой мускулатуры при заболеваниях желчевыводящих путей: холецистит, холангиолитиаз, холецистит, перихолецистит, холангит, папиллит;
- спазмы гладкой мускулатуры мочевыводящих путей: уrolитиаз (в т.ч. нефролитиаз, уретеролитиаз), пиелит, цистит, тенезмы мочевого пузыря;

В качестве вспомогательной терапии (когда лекарственная форма таблеток не может быть применена):

- при спазмах гладкой мускулатуры желудочно-кишечного тракта: язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, гастрит, спазм кардии и привратника, энтерит, колит, синдром раздраженного кишечника;
- при гинекологических заболеваниях: дисменорея;
- при проведении некоторых инструментальных исследований, в том числе при холецистографии.

Противопоказания

- гиперчувствительность к действующему веществу или любому из вспомогательных веществ препарата;
- гиперчувствительность к натрия дисульфиту (см. «Особые указания»);
- тяжелая печеночная или почечная недостаточность;
- тяжелая хроническая сердечная недостаточность;
- АВ-блокада II-III степени;
- детский возраст (применение дротаверина у детей в клинических исследованиях не изучалось);
- период родов;
- период кормления грудью.

С осторожностью

- при артериальной гипотензии (опасность коллапса, см. «Особые указания»);
- при выраженном атеросклерозе коронарных артерий;
- при аденоме простаты;
- при глаукоме;
- при беременности (см. «Применение при беременности и в период грудного вскармливания»).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение дротаверина в период беременности не оказывает тератогенного и эмбриотоксического действия. У беременных женщин препарат назначается только в тех случаях, когда потенциальная польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

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

Способ применения и дозы

Внутримышечно по 2-4 мл (40-80 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 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 около 30 с).

Не смешивают в одном шприце с раствором аминафиллина.

Побочное действие

Со стороны иммунной системы: аллергические реакции (ангионевротический отек, крапивница, сыпь, зуд, анафилактический шок) (см. «Противопоказания»).

Со стороны нервной системы: головная боль, головокружение, бессонница.

Со стороны сердца и сосудов: тахикардия, снижение артериального давления, аритмия, коллапс (при внутривенном введении).

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, рвота, запор.

Общие расстройства и нарушения в месте введения: реакции в месте введения, чувство жара, потливость.

Передозировка

При передозировке возможно усиление дозозависимых побочных эффектов.

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.

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 прокаинамидом

Усиливает гипотензию, вызываемую трициклическими антидепрессантами, хинидином и прокаинамидом.

С морфином

Снижает спазмогенную активность морфина.

С фенобарбиталом

Фенобарбитал усиливает спазмолитическое действие дротаверина.

Особые указания

Препарат содержит натрия дисульфит (натрия метабисульфит), 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 натрия дисульфиту парентерального применения препарата следует избегать (см. «Противопоказания»).

При внутривенном введении дротаверина пациентам с пониженным артериальным давлением больной должен находиться в горизонтальном положении в связи с риском развития коллапса.

Влияние лекарственного препарата на способность управлять транспортными средствами и механизмами

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

Форма выпуска

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 20 мг/мл.

По 2 мл в ампулах.

По 5 ампул в контурной ячейковой упаковке.

По 1, 2, 5 контурных ячейковых упаковок помещают в пачку из картона.

В каждую пачку вкладывают инструкцию по медицинскому применению препарата, скарификатор ампульный (при упаковке ампул с кольцом излома, точками и надсечками скарификатор ампульный не вкладывают).

Условия хранения

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

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

ПАО «Бiosинтез», 440033, г. Пенза, ул. Дружбы, 4.

Юридический адрес и адрес для принятия претензий

ПАО «Бiosинтез», Россия, 440033, г. Пенза, ул. Дружбы, 4, телефон/факс (8412) 57-72-49.