

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ДРОТАВЕРИН ВЕЛФАРМ

Регистрационный номер: ЛП-004788

Торговое наименование: Дротаверин Велфарм

Международное непатентованное наименование: дротаверин

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Состав на 1 мл:

Действующее вещество: дротаверина гидрохлорид – 20,0 мг.

Вспомогательные вещества: натрия дисульфит, этанол (спирт этиловый) 95 %, вода для инъекций.

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 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 ФДЭ-3 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 бета-глобулинами, а также липопротеинами высокой плотности.

Почти полностью метаболизируется в печени путем O-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 при заболеваниях желчевыводящих путей: холецистит, холецистолитиаз, холангиолитиаз, перихолецистит, холангит, воспаление сосочка двенадцатиперстной кишки (папиллит).
- Спазмы гладкой мускулатуры при заболеваниях мочевыводящих путей: нефроуролитиаз, уретролитиаз, пиелит, цистит, спазм мочевого пузыря.
- В качестве вспомогательного средства (когда лекарственная форма таблетки не может быть применена): при спазмах гладкой мускулатуры желудочно-кишечного тракта

(язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, гастрит, спазмы кардии и привратника, энтерит, колит, спастический колит с запором и синдром раздраженного кишечника с метеоризмом); при гинекологических заболеваниях (дисменорея).

– При проведении некоторых инструментальных исследований, в том числе при холецистографии.

Противопоказания

– Гиперчувствительность к действующему веществу или к любому из компонентов препарата; гиперчувствительность к натрию метабисульфиту (см. раздел «Особые указания»).

– Тяжелая печеночная и/или почечная недостаточность.

– Тяжелая хроническая сердечная недостаточность.

– AV-блокада II-III степени.

– Период родов.

– Период грудного вскармливания.

– Детский возраст до 18 лет.

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

Частота проявления неблагоприятных побочных реакций приведена в соответствии с классификацией ВОЗ: очень часто – более 1/10, часто – более 1/100 и менее 1/10, нечасто – более 1/1000 и менее 1/100, редко – более 1/10000 и менее 1/1000, очень редко – менее 1/10000, включая отдельные сообщения.

Со стороны центральной нервной системы: редко – головная боль, головокружение, бессонница.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко – аритмия, тахикардия, снижение артериального давления, коллапс (при внутривенном введении).

Со стороны пищеварительной системы: редко – тошнота, рвота, запор.

Аллергические реакции: редко – ангионевротический отек, крапивница, сыпь, зуд; отдельные сообщения – анафилактический шок.

Местные реакции: редко – реакции в месте введения препарата.

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

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

Усиливает спазмолитическое действие папаверина, бендазола и других спазмолитиков, включая м-холиноблокаторы (атропин, платифиллин, скополамин, пирензепин, тригексифенидил).

Усиливает риск артериальной гипотензии, вызываемой трициклическими антидепрессантами, хинидином и прокаинамидом (новокаиномидом).

Снижает спазмогенную активность морфина.

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 внутривенного и внутримышечного введения 20 мг/мл.

По 2 мл, 4 мл препарата в ампулы нейтрального бесцветного или светозащитного стекла с кольцом излома или с надрезом и точкой. На ампулы дополнительно может быть нанесено одно, два или три цветных кольца.

5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и пленки полимерной, или без пленки полимерной.

1, 2 контурные ячейковые упаковки помещают в пачку из картона.

В каждую пачку вкладывают инструкцию по применению и скарификатор ампульный.

20, 48, 50, 96, 100, 200 контурных ячейковых упаковок помещают в тару из гофрированного картона с равным количеством инструкций по применению и скарификаторов ампульных (для стационаров).

Скарификатор ампульный не вкладывают при использовании ампул с кольцом излома или с надрезом и точкой.

Условия хранения

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

Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности

5 лет.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель/Организация, принимающая претензии

Общество с ограниченной ответственностью «Велфарм» (ООО «Велфарм»), Россия

Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 11

Тел.: (3522) 48-60-00

e-mail: fsk@velpharm.ru

Сообщить о нежелательных реакциях можно по телефону (3522) 55-51-80 или на сайте:

www.brightway.ru, в разделе «VELPHARM» - «Фармаконадзор».

	Должность	Ф.И.О.	Дата	Подпись
Согласовал	Директор по качеству	Пахомова Е.В.		
Согласовал	Директор по производству	Уфимцева Л.И.		
Согласовал	Директор по развитию	Мездрин М.А.		
Проверил	Старший контр. мастер ОКК	Финогенова О.А.		
Проверил	Начальник ПТО	Кибитко Г.А.		
Проверил	Начальник ОР	Ильященко О.В.		
Разработал	Специалист по упак. и марк. ЛС	Шевелева В.С.		