

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

НО-Х-ША^а

(NO-H-SHA^а)

Склад:

діюча речовина: drotaverine;

1 мл розчину містить 20 мг дротаверину гідрохлориду у перерахуванні на суху речовину;

допоміжні речовини: етанол 96 %, натрію метабісульфіт (Е 223), вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: прозора рідина зеленувато-жовтого кольору.

Фармакотерапевтична група. Засоби, які застосовуються при функціональних шлунково-кишкових розладах. Дротаверин. Код АТХ А03А D02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Дротаверин – похідне ізохіноліну, який проявляє спазмолітичну дію на гладку мускулатуру шляхом пригнічення дії ферменту фосфодіестерази IV (ФДЕ IV), що спричиняє збільшення концентрації цАМФ і, завдяки інактивації легкого ланцюжка кінлази міозину (MLCK), до розслаблення гладкого м'яза.

In vitro дротаверин пригнічує дію ферменту ФДЕ IV і не впливає на дію ізоферментів фосфодіестерази III (ФДЕ III) і фосфодіестерази V (ФДЕ V). ФДЕ IV має велике функціональне значення для зниження скорочувальної активності гладких м'язів, тому вибіркові інгібітори цього ферменту можуть бути корисними для лікування хвороб, які супроводжуються гіперрухливістю, а також різних захворювань, під час яких виникають спазми шлунково-кишкового тракту.

У клітинах гладких м'язів міокарда та судин цАМФ гідролізується здебільшого ізоферментом ФДЕ III, тому дротаверин є ефективним спазмолітичним засобом, який не має значних побічних ефектів з боку серцево-судинної системи та сильної терапевтичної дії на цю систему.

Дротаверин ефективний при спазмах гладкої мускулатури як нервового, так і м'язового

походження. Дротаверин діє на гладку мускулатуру шлунково-кишкової, біліарної, сечостатевої та судинної систем незалежно від типу їхньої автономної іннервації. Він посилює кровообіг у тканинах завдяки своїй здатності розширювати судини.

Дія дротаверину є сильнішою за дію папаверину, абсорбція більш швидка та повна, він менше зв'язується з білками сироватки крові. Перевагою дротаверину є також те, що, на відміну від папаверину, після його парентерального введення не спостерігається такого побічного ефекту як стимуляція дихання.

Фармакокінетика.

Дротаверин швидко та повністю абсорбується після парентерального введення. Він значною мірою (95-98 %) зв'язується з білками плазми крові людини, особливо з альбуміном, гамма- та бета-глобулінами. Після первинного метаболізму 65 % введеної дози надходить у кровообіг у незміненому вигляді.

Метаболізується у печінці. Напівперіод біологічного існування становить 8-10 годин.

За 72 години дротаверин практично повністю виводиться з організму, понад 50 % виводиться із сечею та приблизно 30 % – з калом. В основному дротаверин виводиться у формі метаболітів, у незмінній формі в сечі не виявляється.

Клінічні характеристики.

Показання.

Спазми гладкої мускулатури, пов'язані з захворюваннями біліарного тракту: холецистолітіаз, холангіолітіаз, холецистит, перихолецистит, холангіт, папіліт.

Спазми гладкої мускулатури при захворюваннях сечового тракту: нефролітіаз, уретролітіаз, пієліт, цистит, тенезми сечового міхура.

Як допоміжне лікування (коли застосування препарату у вигляді таблеток неможливе):

- при спазмах гладкої мускулатури шлунково-кишкового тракту: виразковій хворобі шлунка та дванадцятипалої кишки, гастриті, кардіо- та/або пілороспазмі, ентериті, коліті;
- при гінекологічних захворюваннях: дисменореї.

Протипоказання.

- Підвищена індивідуальна чутливість до діючої речовини або до будь-якого компонента препарату (особливо до натрію метабісульфіту);
- підвищена чутливість до натрію дисульфіту;
- тяжка печінкова, ниркова або серцева недостатність (синдром малого серцевого викиду).

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Інгібітори фосфодіестерази (дротаверин, папаверин) знижують антипаркінсонічний ефект леводопи. Слід з обережністю застосовувати препарат одночасно з леводопою, оскільки антипаркінсонічний ефект останньої зменшується, а ригідність та тремор посилюються.

Особливості застосування.

Через ризик виникнення колапсу при внутрішньовенному введенні препарату хворий повинен знаходитися у лежачому положенні!

Застосовувати з обережністю при артеріальній гіпотензії.

Препарат містить метабісульфіт, який може спричиняти реакції алергічного типу, включаючи симптоми анафілактичного шоку та бронхоспазм у чутливих пацієнтів, особливо у тих, хто має в анамнезі астму або алергію. У випадку підвищеної чутливості до метабісульфіту натрію слід уникати парентерального введення препарату.

Слід бути обережним при парентеральному введенні препарату вагітним жінкам (див. розділ «Застосування у період вагітності або годування груддю»).

Діти. Клінічних досліджень застосування препарату дітям не проводили.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність. Як показали результати ретроспективних клінічних досліджень, пероральне застосування препарату не спричинило жодного випадку тератогенності та ембріотоксичності. Однак необхідно з обережністю призначати препарат вагітним жінкам. Не застосовувати дротаверин під час пологів.

Годування груддю. Через відсутність даних відповідних досліджень на тваринах у період годування груддю введення препарату не рекомендується.

Фертильність. Даних стосовно впливу на фертильність людини немає.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Необхідно попередити пацієнтів, що після парентерального, особливо внутрішньовенного введення препарату рекомендується утриматися від керування автомобілем і виконання робіт, що потребують підвищеної уваги.

Спосіб застосування та дози.

Звичайна середня добова доза для дорослих становить 40-240 мг (за 1-3 окремих введення) внутрішньом'язово.

При *гострих* коліках у дорослих хворих із конкрементами у сечових або жовчних шляхах – 40-80 мг внутрішньовенно.

Діти. Клінічних досліджень застосування препарату дітям не проводили.

Передозування.

Симптоми: передозування дротаверином асоціювалося з порушеннями серцевого ритму та провідності, в тому числі з повною блокадою ніжок пучка Гіса та зупинкою серця, яка може бути летальною.

При передозуванні пацієнт повинен знаходитися під ретельним спостереженням лікаря та отримувати симптоматичне лікування, що включає індукцію блювання та/або промивання шлунка.

Побічні реакції.

Побічна дія, що спостерігалася під час клінічних досліджень і, можливо, була спричинена дротаверином, розподілена за системою органів.

З боку імунної системи.

Алергічні реакції, включаючи ангіоневротичний набряк, кропив'янку, висипання, свербіж, пропасницю, озноб, підвищення температури тіла, слабкість, особливо у пацієнтів з підвищеною чутливістю до метабісульфіту.

Були повідомлення про випадки анафілактичного шоку з летальними та нелетальними наслідками при застосуванні ін'єкційної форми.

Препарат містить метабісульфіт, який може спричиняти реакції алергічного типу, включаючи симптоми анафілактичного шоку та бронхоспазм у чутливих пацієнтів, особливо тих, хто має в анамнезі астму чи алергію.

З боку серцево-судинної системи.

Прискорене серцебиття, артеріальна гіпотензія.

З боку нервової системи.

Головний біль, запаморочення, безсоння.

З боку шлунково-кишкового тракту.

Нудота, запор, блювання.

Загальні порушення та реакції у місці введення.

Місцеві реакції у місці введення ін'єкції.

Термін придатності.

3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати у недоступному для дітей місці в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Упаковка. По 2 мл в ампулах. По 5 або 100 ампул у пачці; або по 5 ампул у блістері, по 1 блістеру у пачці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

Приватне акціонерне товариство «Лекхім-Харків».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 61115, Харківська обл., місто Харків, вулиця Северина Потоцького, будинок 36.

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного средства

НО-Х-ША^а

(NO-H-SHA^а)

Состав:

действующее вещество: drotaverine;

1 мл раствора содержит 20 мг дротаверина гидрохлорида в пересчете на сухое вещество;

вспомогательные вещества: этанол 96 %, натрия метабисульфит (Е 223), вода для инъекций.

Лекарственная форма. Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная жидкость зеленовато-желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа. Средства, применяемые при функциональных желудочно-кишечных расстройствах. Дротаверин. Код АТХ А03А D02.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Дротаверин – производная изохинолина, которая оказывает спазмолитическое действие на гладкую мускулатуру путем угнетения действия фермента фосфодиэстеразы IV (ФДЭ IV), что приводит к увеличению концентрации цАМФ и, благодаря инактивации легкой цепочки киназы миозина (MLCK), к расслаблению гладких мышц.

In vitro дротаверин подавляет действие фермента ФДЭ IV и не влияет на действие изоферментов фосфодиэстеразы III (ФДЭ III) и фосфодиэстеразы V (ФДЭ V). ФДЭ IV имеет

большое функциональное значение для снижения сократительной активности гладких мышц, поэтому выборочные ингибиторы этого фермента могут быть полезными для лечения болезней, сопровождающихся гиперподвижностью, а также различных заболеваний, при которых возникают спазмы желудочно-кишечного тракта.

В клетках гладких мышц миокарда и сосудов цАМФ гидролизуется преимущественно изоферментом ФДЭ III, поэтому дротаверин является эффективным спазмолитическим средством, которое не имеет значительных побочных эффектов со стороны сердечно-сосудистой системы и сильного терапевтического действия на эту систему.

Дротаверин эффективен при спазмах гладкой мускулатуры как нервного, так и мышечного происхождения. Дротаверин действует на гладкую мускулатуру желудочно-кишечной, билиарной, мочеполовой и сосудистой систем независимо от типа их автономной иннервации.

Он усиливает кровообращение в тканях благодаря своей способности расширять сосуды.

Действие дротаверина сильнее действия папаверина, абсорбция более быстрая и полная, он меньше связывается с белками сыворотки крови. Преимуществом дротаверина является также то, что, в отличие от папаверина, после его парентерального введения не наблюдается такого побочного эффекта как стимуляция дыхания.

Фармакокинетика.

Дротаверин быстро и полностью абсорбируется после парентерального введения. Он в значительной степени (95-98 %) связывается с белками плазмы крови человека, особенно с альбумином, гамма- и бета-глобулинами. После первичного метаболизма 65 % введенной дозы поступает в кровоток в неизмененном виде.

Метаболизируется в печени. Полупериод биологического существования составляет 8-10 часов.

За 72 часа дротаверин практически полностью выводится из организма, около 50 % выводится с мочой и приблизительно 30 % – с калом. В основном дротаверин выводится в форме метаболитов, в неизменной форме в моче не обнаруживается.

Клинические характеристики.

Показания.

Спазмы гладкой мускулатуры, связанные с заболеваниями билиарного тракта: холецистолитиаз, холангиолитиаз, холецистит, перихолецистит, холангит, папиллит.

Спазмы гладкой мускулатуры при заболеваниях мочевого тракта: нефролитиаз, уретролитиаз, пиелит, цистит, тенезмы мочевого пузыря.

Как вспомогательное лечение (если применение препарата в виде таблеток невозможно):

- при спазмах гладкой мускулатуры желудочно-кишечного тракта: язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, гастрите, кардио- и/или пилороспазме, энтерите, колите;
- при гинекологических заболеваниях: дисменореи.

Противопоказания.

- Повышенная индивидуальная чувствительность к действующему веществу или к какому-либо компоненту препарата (особенно к натрия метабисульфиту);
- повышенная чувствительность к натрия дисульфиту;
- тяжелая печеночная, почечная или сердечная недостаточность (синдром малого сердечного выброса).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Ингибиторы фосфодиэстеразы (дротаверин, папаверин) снижают антипаркинсонический эффект леводопы. Следует с осторожностью применять препарат одновременно с леводопой, поскольку антипаркинсонический эффект последней снижается, а ригидность и тремор усиливаются.

Особенности применения.

В связи с риском возникновения коллапса при внутривенном введении препарата больной должен находиться в лежачем положении!

Применять с осторожностью при артериальной гипотензии.

Препарат содержит метабисульфит, который может вызывать реакции аллергического типа, включая симптомы анафилактического шока и бронхоспазм у чувствительных пациентов, особенно у тех, кто имеет в анамнезе астму или аллергию. В случае повышенной чувствительности к метабисульфиту натрия следует избегать парентерального введения препарата.

Следует быть осторожным при парентеральном введении препарата беременным женщинам (см. раздел «Применение в период беременности или кормления грудью»).

Дети. Клинические исследования применения препарата детям не проводили.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Беременность. Как показали результаты ретроспективных клинических исследований,

пероральное применение препарата не повлекло ни в одном случае тератогенности и эмбриотоксичности. Однако необходимо с осторожностью назначать препарат беременным женщинам. Не применять дротаверин во время родов.

Кормление грудью. Из-за отсутствия данных соответствующих исследований на животных в период кормления грудью введение препарата не рекомендуется.

Фертильность. Данных относительно влияния на фертильность человека нет.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Необходимо предупредить пациентов, что после парентерального, особенно внутривенного введения препарата рекомендуется воздержаться от управления автомобилем и выполнения работ, требующих повышенного внимания.

Способ применения и дозы.

Обычная средняя суточная доза для взрослых составляет 40-240 мг (за 1-3 отдельных введения) внутримышечно.

При *острых коликах* у взрослых больных с конкрементами в мочевых или желчных путях – 40-80 мг внутривенно.

Дети. Клинические исследования применения препарата детям не проводили.

Передозировка.

Симптомы: передозировка дротаверином ассоциировалась с нарушениями сердечного ритма и проводимости, в том числе с полной блокадой ножек пучка Гиса и остановкой сердца, которая может быть летальной.

При передозировке пациент должен находиться под тщательным наблюдением врача и получать симптоматическое лечение, которое включает индукцию рвоты и/или промывание желудка.

Побочные реакции.

Побочное действие, которое наблюдалось во время клинических исследований и, возможно, было вызвано дротаверином, распределено по системам органов.

Со стороны иммунной системы.

Аллергические реакции, включая ангионевротический отек, крапивницу, сыпь, зуд, лихорадку, озноб, повышение температуры тела, слабость, особенно у пациентов с повышенной чувствительностью к метабисульфиту.

Сообщалось также о случаях анафилактического шока с летальными и нелетальными последствиями при применении инъекционной формы.

Препарат содержит метабисульфит, который может вызывать реакции аллергического типа, включая симптомы анафилактического шока и бронхоспазм у чувствительных пациентов, особенно тех, кто имеет в анамнезе астму или аллергию.

Со стороны сердечно-сосудистой системы.

Учащенное сердцебиение, артериальная гипотензия.

Со стороны нервной системы.

Головная боль, головокружение, бессонница.

Со стороны желудочно-кишечного тракта.

Тошнота, запор, рвота.

Общие нарушения и реакции в месте введения.

Местные реакции в месте введения инъекции.

Срок годности.

3 года.

Условия хранения.

Хранить в недоступном для детей месте в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Упаковка. По 2 мл в ампулах. По 5 или 100 ампул в пачке; или по 5 ампул в блистере, по 1 блистеру в пачке.

Категория отпуска.

По рецепту.

Производитель.

Частное акционерное общество «Лекхим-Харьков».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.

Украина, 61115, Харьковская обл., город Харьков, улица Северина Потоцкого, дом 36.