ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ДРОТАВЕРИН-ДАРНИЦЯ

(DROTAVERINE-DARNITSA)

Склад:

діюча речовина: drotaverine;

1 мл розчину містить дротаверину гідрохлориду 20 мг;

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

Лікарська форма. Розчин для ін’єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: прозора зеленувато-жовта або жовта рідина.

Фармакотерапевтична група. Засоби, які застосовуються при функціональних шлунково-кишкових розладах. Код АТХ A03A D02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Дротаверин – похідне ізохіноліну, чинить спазмолітичну дію на гладку мускулатуру шляхом пригнічення дії ферменту фосфодіестерази IV (ФДЕ IV), що спричиняє збільшення концентрації цАМФ і завдяки інактивації легкого ланцюжка кінази міозину (MLCK) призводить до розслаблення гладких м'язів.

In vitro дротаверин пригнічує дію ферменту ФДЕ IV та інгібує ізоферменти фосфодіестеразу III (ФДЕ III) та фосфодіестеразу 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. Лікарський засіб посилює кровообіг у тканинах завдяки своїй здатності розширювати судини.

Дія дротаверину є сильнішою за дію папаверину, абсорбція швидша та повніша, він менше зв'язується з білками плазми 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, більшою мірою (95-98 %) зв’язується з білками плазми крові, особливо з альбуміном, гамма- та бета-глобулінами. Після первинного метаболізму 65 % прийнятої дози надходить до кровообігу у незміненому вигляді. Метаболізується у печінці. Період напіввиведення становить 8-10 годин. За 72 години дротаверин практично повністю виводиться з організму, більш ніж 50 % виводиться із сечею та приблизно 30 % – з калом. В основному дротаверин виводиться у формі метаболітів, у незміненій формі в сечі не виявляється.

Клінічні характеристики.

Показання.

Спазми гладкої мускулатури, пов’язані із захворюваннями біліарного тракту, такими як 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 лікарського засобу у вигляді таблеток неможливе) при:

– 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 чутливість до дротаверину або до інших компонентів лікарського засобу (особливо до метабісульфіту натрію). Підвищена чутливість до натрію дисульфіту. Тяжка печінкова, ниркова або серцева недостатність (синдром малого серцевого викиду).

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

При одночасному застосуванні лікарського засобу з леводопою можливе зниження антипаркінсонічного ефекту останньої. Дану комбінацію слід застосовувати з обережністю, оскільки антипаркінсонічний ефект леводопи зменшується, а ригідність та тремор посилюються.

Особливості застосування.

При внутрішньовенному введенні лікарського засобу пацієнт повинен знаходитися у горизонтальному положенні через ризик виникнення колапсу.

ДРОТАВЕРИН-ДАРНИЦЯ застосовувати з обережністю при артеріальній гіпотензії.

Слід дотримуватись обережності при парентеральному введенні лікарського засобу вагітним жінкам (див. розділ «Застосування у період вагітності або годування груддю»).

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

У випадку підвищеної чутливості до метабісульфіту натрію слід уникати парентерального введення лікарського засобу.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Як показали результати досліджень на тваринах, пероральне застосування лікарського засобу не спричиняло жодного випадку тератогенності та ембріотоксичності. Лікарський засіб застосовувати у період вагітності з обережністю. Не застосовувати дротаверин під час пологів.

Через відсутність даних відповідних досліджень у період годування груддю застосування лікарського засобу не рекомендується.

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

Слід утриматися від керування автотранспортом або роботи з іншими механізмами, що потребують підвищеної уваги, під час застосування (особливо внутрішньовенного) лікарського засобу.

Спосіб застосування та дози.

ДРОТАВЕРИН-ДАРНИЦЯ застосовувати дорослим внутрішньом’язово у добовій дозі 40-240 мг за 1-3 введення.

При гострих коліках лікарський засіб застосовувати дорослим внутрішньовенно повільно у дозі 40-80 мг.

Діти.

ДРОТАВЕРИН-ДАРНИЦЯ не застосовувати дітям.

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 мати летальні наслідки.

Лікування: симптоматична та підтримуюча терапія. При передозуванні пацієнт повинен знаходитися під ретельним наглядом лікаря.

Побічні реакції.

З боку серцево-судинної системи: артеріальна гіпотензія, прискорене серцебиття, аритмія, атріовентрикулярна блокада.

З боку нервової системи: головний біль, запаморочення, безсоння.

З боку травного тракту: нудота, блювання, запор.

З боку імунної системи: реакції гірперчутливості, у тому числі кропив'янка, шкірні висипання, дерматоз, свербіж, гіперемія, пропасниця, озноб, підвищення температури тіла, слабкість, ангіоневротичний набряк, бронхоспазм, особливо у пацієнтів з підвищеною чутливістю до метабісульфіту. Були повідомлення про випадки анафілактичного шоку з летальними та нелетальними наслідками при застосуванні ін'єкційної форми.

ДРОТАВЕРИН-ДАРНИЦЯ 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.

Загальні порушення: реакції гіперчутливості у місці введення.

Термін придатності.

3 роки.

Умови зберігання.

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

Упаковка.

По 2 мл в ампулі; по 5 або по 10 ампул у контурній чарунковій упаковці; по 1 контурній чарунковій упаковці в пачці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

ПрАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 02093, м. Київ, вул. Бориспільська, 13.

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного средства

ДРОТАВЕРИН-ДАРНИЦА

(DROTAVERINE-DARNITSA)

Состав:

действующее вещество: drotaverine;

1 мл раствора содержит дротаверина гидрохлорида 20 мг;

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

Лекарственная форма. Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная зеленовато-желтая или желтая жидкость.

Фармакотерапевтическая группа. Средства, которые применяются при функциональных желудочно-кишечных расстройствах. Код АТХ A03A D02.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

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

In vitro дротаверин угнетает действие фермента ФДЭ IV и ингибирует изоферменты фосфодиэстеразу III (ФДЭ III) и фосфодиэстеразу V (ФДЭ V). ФДЭ IV имеет большое функциональное значение для снижения сократительной активности гладких мышц, поэтому избирательные ингибиторы этого фермента могут быть полезными для лечения заболеваний, которые сопровождаются гиперподвижностью, а также различных заболеваний, во время которых возникают спазмы желудочно-кишечного тракта.

В клетках гладких мышц миокарда и сосудов цАМФ гидролизуется в большей степени изоферментом ФДЭ III, поэтому дротаверин является эффективным спазмолитическим средством, которое не обладает значительными побочными эффектами со стороны сердечно-сосудистой системы и сильным терапевтическим действием на эту систему.

Дротаверин эффективен при спазмах гладких мышц как нервного, так и мышечного происхождения. Дротаверин действует на гладкие мышцы желудочно-кишечной, билиарной, мочеполовой и сосудистой систем независимо от типа их автономной иннервации. Лекарственное средство усиливает кровообращение в тканях благодаря своей способности расширять сосуды.

Действие дротаверина более эффективно, чем действие папаверина, абсорбция более быстрая и полная, он меньше связывается с белками плазмы крови. Преимущество дротаверина в

отличие от папаверина в том, что после его парентерального введения не отмечено такого побочного эффекта как стимуляция дыхания.

Фармакокинетика.

Дротаверин быстро и полностью абсорбируется, в большей степени (95-98 %) связывается с белками плазмы крови, особенно с альбумином, гамма- и бета-глобулинами. После первичного метаболизма 65 % введенной дозы поступает в кровообращение в неизмененном виде.

Метаболизируется в печени. Период полувыведения составляет 8-10 часов. За 72 часа дротаверин практически полностью выводится из организма, более чем 50 % выводится с мочой и приблизительно 30 % − с калом. В основном дротаверин выводится в форме метаболитов, в неизмененной форме в моче не выявляется.

Клинические характеристики.

Показания.

Спазмы гладкой мускулатуры, связанные с заболеваниями билиарного тракта, такими как холецистолитиаз, холангиолитиаз, холецистит, перихолецистит, холангит, папиллит;

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

Как вспомогательное лечение (когда применение лекарственного средства в виде таблеток невозможно) при:

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

– при гинекологических заболеваниях (дисменорее).

Противопоказания.

Повышенная чувствительность к дротаверину или к другим компонентам лекарственного средства (особенно к метабисульфиту натрия). Повышенная чувствительность к натрию дисульфиту тяжелая печеночная, почечная или сердечная недостаточность (синдром малого сердечного выброса).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

При одновременном применении лекарственного средства с леводопой возможно снижение антипаркинсонического эффекта последней. Данную комбинацию следует применять с осторожностью, поскольку антипаркинсонический эффект леводопы уменьшается, а

ригидность и тремор усиливаются.

Особенности применения.

При внутривенном введении лекарственного средства пациент должен находиться в горизонтальном положении из-за риска возникновения коллапса.

ДРОТАВЕРИН-ДАРНИЦА применять с осторожностью при артериальной гипотензии.

Следует соблюдать осторожность при парентеральном введении лекарственного средства беременным женщинам (см. раздел «Применение в период беременности или кормления грудью»).

ДРОТАВЕРИН-ДАРНИЦА 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.

В случае повышенной чувствительности к метабисульфиту натрия следует избегать парентерального введения лекарственного средства.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Как показали результаты исследований на животных, пероральное применение лекарственного средства не вызывало ни одного случая тератогенности и эмбриотоксичности. Лекарственное средство применять в период беременности с осторожностью. Не применять дротаверин во время родов.

Из-за отсутствия данных соответствующих исследований в период кормления грудью применение лекарственного средства не рекомендуется.

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

Следует воздержаться от управления автотранспортом или работы с другими механизмами, что требуют повышенного внимания, во время применения (особенно внутривенного) лекарственного средства.

Способ применения и дозы.

ДРОТАВЕРИН-ДАРНИЦА применять взрослым внутримышечно в суточной дозе 40-240 мг за 1-3 введения.

При острых коликах лекарственное средство применять взрослым внутривенно медленно в дозе 40-80 мг.

Дети.

ДРОТАВЕРИН-ДАРНИЦА не применять детям.

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 иметь летальный исход.

Лечение: симптоматическая и поддерживающая терапия. При передозировке пациент должен находиться под тщательным наблюдением врача.

Побочные реакции.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: артериальная гипотензия, учащенное сердцебиение, аритмия, атриовентрикулярная блокада.

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

Со стороны пищеварительного тракта: тошнота, рвота, запор.

Со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности, в том числе крапивница, кожные высыпания, дерматоз, зуд, гиперемия, лихорадка, озноб, повышение температуры тела, слабость, ангионевротический отек, бронхоспазм, особенно у пациентов с повышенной чувствительностью к метабисульфиту. Сообщалось также о случаях анафилактического шока с летальными и нелетальными последствиями при применении инъекционной формы.

ДРОТАВЕРИН-ДАРНИЦА 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.

Общие нарушения: реакции гиперчувствительности в месте введения.

Срок годности.

3 года.

Условия хранения.

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

Упаковка.

По 2 мл в ампуле; по 5 или по 10 ампул в контурной ячейковой упаковке; по 1 контурной ячейковой упаковке в пачке.

Категория отпуска.

По рецепту.

Производитель.

ЧАО «Фармацевтическая фирма «Дарница».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.

Украина, 02093, г. Киев, ул. Бориспольская, 13.