

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
ДРОТАВЕРИН-ЭЛЛАРА®

Регистрационный номер: ЛС-001982

Торговое наименование: Дротаверин-Эллара®

Международное непатентованное или группировочное наименование: дротаверин

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Состав (на 1 мл)

Действующее вещество:

Дротаверина гидрохлорид — 20,0 мг
(в пересчете на безводное вещество)

Вспомогательные вещества:

Натрия дисульфит — 1,0 мг

Этанол 95 % (в пересчете на безводный) — 66,0 мг

Аммония ацетат — 0,74 мг

Уксусная кислота разведенная 30 % — 0,61 мг

Вода для инъекций — до 1,0 мл

Описание: прозрачный раствор желтого или зеленовато-желтого цвета

Фармакотерапевтическая группа: спазмолитическое средство

Код АТХ: A03AD02

Фармакологическое действие

Фармакодинамика

Дротаверин — миотропный спазмолитик, представляет собой 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 выраженным спазмолитическим действием на гладкие мышцы за счет селективного ингибирования фермента фосфодиэстеразы-4 (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 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 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 натрия 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 8 лет.

С осторожностью

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

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, внутримышечно.
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 (натрия дисульфит), 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 ч после парентерального введения, особенно внутривенного).

Форма выпуска

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 20 мг/мл.

По 2 мл или 5 мл в ампулы с точкой или кольцом излома светозащитного стекла марки СНС-1 или УСП-1, или из нейтрального светозащитного стекла первого гидролитического класса/стекла с классом сопротивления гидролизу НГА1.

5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной (ПВХ) либо из пленки полиэтилентерефталатной (ПЭТФ).

1, 2, 3, 4 или 5 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона для потребительской тары.

5 или 10 ампул вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона для потребительской тары с гофрированным вкладышем.

Упаковка для стационаров. 4, 5 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкциями по применению в количестве, равном количеству контурных ячейковых упаковок, помещают в пачку из картона для потребительской тары.

50 или 100 контурных ячейковых упаковок вместе с равным количеством инструкций по применению помещают в коробку из картона гофрированного.

Условия хранения

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

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Наименование и адрес производителя

ООО «Эллара», Россия
601122, Владимирская обл., Петушинский район,
г. Покров, ул. Франца Штольверка, д. 20, стр. 2

Владелец регистрационного удостоверения и организация, принимающая претензии потребителей

ООО «Эллара», Россия
601122, Владимирская обл., Петушинский район,
г. Покров, ул. Франца Штольверка, д. 20
тел./факс: (49243) 6-42-22, (49243) 6-42-24