

Краткая Характеристика Лекарственного Средства

1. Название лекарственного средства.

Но-шпа®.

Международное непатентованное или группировочное название:

дротаверин.

2. Количественный и качественный состав:

В одной ампуле (2 мл) содержится

действующее вещество: дротаверина гидрохлорид – 40 мг;

вспомогательные вещества: натрия дисульфит (натрия метабисульфит) – 2,0 мг, этанол 96 % - 132,0 мг, вода для инъекций до 2,0 мл.

3. Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения.

Описание:

прозрачная жидкость зеленовато-желтого цвета.

4. Клинические данные

4.1 Показания

➤ спазмы гладкой мускулатуры, связанные с заболеваниями желчевыводящих путей: холецистолитиаз, холангиолитиаз, холецистит, перихолецистит, холангит, папиллит.

➤ спазмы гладкой мускулатуры мочевыводящих путей: нефролитиаз, уретролитиаз, пиелит, цистит, тенезмы мочевого пузыря.

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

➤ при спазмах гладкой мускулатуры желудочно-кишечного происхождения: язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, гастрит, спазмы кардии и привратника, энтерит, колит

➤ при гинекологических заболеваниях: дисменорея.

4.2 Дозировка и способ применения.

Взрослые:

Суточная средняя доза составляет 40-240 мг дротаверина гидрохлорида (разделенная на 1-3 дозы в сутки) внутримышечно.

При острых коликах (почечной или желчно-каменной) - 40-80 мг внутривенно-медленно (продолжительность введения приблизительно 30 секунд).

4.3 Противопоказания

Гиперчувствительность к действующему веществу или к любому из вспомогательных веществ препарата.

Гиперчувствительность к натрия дисульфиту (смотри раздел «Особые указания»).

- Тяжелая печеночная или почечная недостаточность.
- Тяжелая хроническая сердечная недостаточность.
- Детский возраст (применение дротаверина у детей в клинических исследованиях не изучалось).
- Период кормления грудью.

С осторожностью:

- При артериальной гипотензии (опасность коллапса, смотри раздел «Особые указания»);
- У беременных женщин (смотри раздел «Беременность и период лактации»)

4.4 Особые указания и меры предосторожности

Препарат содержит дисульфит, 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 дисульфиту парентерального применения препарата следует избегать (смотри раздел «Противопоказания»).

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

4.5 Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие формы взаимодействия

С леводопа

Ингибиторы фосфодиэстеразы, подобные папаверину, ослабляют противопаркинсонический эффект леводопы. При назначении дротаверина одновременно с леводопа 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 фенobarбиталом

Фенobarбитал усиливает спазмолитическое действие дротаверина.

4.6 Беременность и период кормления грудью

Как показали исследования по репродуктивной токсичности у животных и ретроспективные исследования клинических данных, применение дротаверина в период беременности не оказывало ни тератогенного, ни эмбриотоксического действия. Несмотря на это при назначении дротаверина беременным женщинам следует соблюдать осторожность и применять его только в тех случаях, когда потенциальная польза для матери превышает потенциальный риск для плода, при этом следует избегать назначения инъекционной лекарственной формы препарата Но-шпа® у беременных женщин.

Препарат не следует применять во время родов (потенциальный риск развития послеродовых атонических кровотечений).

В связи с отсутствием необходимых клинических данных в период лактации назначать препарат не рекомендуется.

4.7 Влияние на способность управлять транспортными средствами или другими 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.

4.8 Побочные эффекты.

Ниже представлены неблагоприятные реакции, наблюдавшиеся в клинических исследованиях, разделенные по системам органов с указанием частоты их возникновения в соответствии со следующими градациями: очень часто ($\geq 10\%$), часто ($\geq 1\%$ и $< 10\%$); нечасто ($\geq 0,1$ и $< 1\%$); редко ($\geq 0,01\%$ и $< 0,1\%$) и очень редко, включая отдельные сообщения ($< 0,01\%$), неизвестная частота (по имеющимся данным частоту определить нельзя).

Со стороны сердечно-сосудистой системы

Редко: учащение сердцебиения, снижение артериального давления.

Со стороны нервной системы

Редко: головная боль, вертиго, бессонница. Частота неизвестна: головокружение.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Редко: тошнота, запор.

Со стороны иммунной системы

Редко: аллергические реакции (ангионевротический отек, крапивница, сыпь, зуд) (смотри раздел «Противопоказания»). Частота неизвестна: при применении препарата сообщалось о развитии анафилактического шока со смертельным исходом и без смертельного исхода.

Местные реакции

Редко: реакции в месте введения.

4.9 Передозировка

Передозировка дротаверина ассоциировалась с нарушениями 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.

5. Фармакологические свойства.

Фармакотерапевтическая группа: спазмолитическое средство.

Код АТХ: А03АD02.

5.1 Фармакодинамические свойства.

Дротаверин представляет собой производное изохинолина, которое проявляет мощное спазмолитическое действие на гладкую мускулатуру за счет ингибирования фермента фосфодиэстеразы (ФДЭ). Фермент фосфодиэстераза необходим для гидролиза ц-АМФ до АМФ. Ингибирование фермента фосфодиэстеразы приводит к повышению концентрации ц-АМФ, которое запускает следующую каскадную реакцию: высокие концентрации ц-АМФ активируют ц-АМФ зависимое фосфорилирование киназы легких цепей миозина (КЛЦМ). Фосфорилирование КЛЦМ приводит к снижению ее аффинности к кальций (Ca^{2+})-кальмодулиновому комплексу, в результате чего инактивированная форма КЛЦМ поддерживает мышечное расслабление. ц-АМФ кроме этого влияет на цитозольную концентрацию Ca^{2+} , благодаря стимулированию транспорта Ca^{2+} в экстрацеллюлярное пространство и саркоплазматический ретикулум. Этот понижающий концентрацию Ca^{2+} эффект дротаверина через ц-АМФ 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. 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.

Гидролиз ц-АМФ в миокарде и гладкой мускулатуре сосудов происходит главным образом с помощью изоэнзима 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 расслабляюще действует на гладкую мускулатуру желудочно-кишечного тракта, желчевыводящих путей, мочеполовой системы.

5.2 Фармакокинетика.

Дротаверин и/или его метаболиты могут незначительно проникать через плацентарный барьер.

In vitro – дротаверин имеет высокую связь с белками плазмы (95-97%), особенно с альбумином, γ и β -глобулинами, а также α -ЛПВП (липопротеидами высокой плотности).

У человека 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.

У человека для оценки показателей фармакокинетики дротаверина использовалась двухкамерная математическая модель. Конечный период полувыведения плазменной радиоактивности составлял 16 часов.

Период полувыведения составляет 8-10 часов. За 72 ч. практически полностью выводится из организма, более 50% через почки (преимущественно в виде метаболитов) и около 30% через кишечник. Неизменный дротаверин в моче не обнаруживается.

6. Фармацевтические данные.

6.1 Вспомогательные вещества.

В одной ампуле 2 мл содержится:

вспомогательные вещества: натрия дисульфит (натрия метабисульфит) – 2,0 мг, этанол 96 % - 132,0 мг, вода для инъекций до 2,0 мл.

6.2 Условия хранения и срок годности:

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С в оригинальной упаковке (в пачке).

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

6.3 Форма выпуска

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 20 мг/мл.

По 2 мл в ампулы из темного стекла (гидролитического класса, тип I) с нанесенной точкой разлома.

По 5 ампул в пластиковую контурную ячейковую упаковку без покрытия (поддон).

По 1 или 5 поддонов с инструкцией по применению в картонную пачку.

7. Держатель регистрационного удостоверения

Опелла Хелскеа Коммершиал Лтд.,

1045 Пудапешт, То у. 1-5, Венгрия

8. Производитель

ХИНОИН Завод Фармацевтических и Химических Продуктов ЗАО

3510 Мишкольц, Чаниквельд, Венгрия.

9. Дата утверждения текста

02/2019