КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1
Към Рег. № 20180023
Разрешение № BG/MA/MP-61277
Одобрение № ...../ 22-12-2022

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

ДРОТАВЕРИН ДС 20 mg/ml инжекционен разтвор
DROTAVERIN DS 20 mg/ml solution for injection

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

1 ml от разтвора съдържа 20 mg дротаверинов хидрохлорид (Drotaverine hydrochloride).
Помощни вещества: етанол 96% и други.
За пълния списък на помощните вещества, вж. точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Инжекционен разтвор
Описание на разтвора: жълт, бистър разтвор, без видими частици.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

• Спазми на гладката мускулатура, свързани със заболявания на жлъчните пътища: холецистолитиаза, холангиолитиаза, холецистит, перихолецистит, холангит и папилит.
• Спазми на гладката мускулатура при заболявания на пикочните пътища: нефролитиаза, уретеролитиаза, пиелит, цистит и спазми на пикочния мехур.
• Във фазата на дилатация на маточната шийка при раждане без усложнения, за намаляване на продължителността на цервикалната дилатация и общото времетраене на раждането.

При невъзможност за прием на пероралната форма, инжекционният разтвор на Дротаверин ДС може да бъде приложен в следните случаи:
- Спазъм на гладката мускулатура на стомашно-чревния тракт: стомашна и дуоденална язва, гастрит (възпаление на стомаха), спазъм на мускулатурата в горната и долната част на стомаха, възпаления на червата.
- при гинекологични нарушения: дисменорея (болезнена менструация) и за облекчаване на силната спастична болка при раждане.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Начин на приложение

Прилага се интрамускулно и интравенозно.

Дозировка

Обичайната дневна доза за възрастни е 40 - 240 mg, разделени на 1-3 интрамускулни приложения.
При жлъчни или бъбречни колики: 40-80 mg бавно интравенозно (за около 30 сек.) самостоятелно или в комбинация с ненаркотични аналгетици.

За намаляване продължителността на цервикалната дилатация в началото на дилатационната фаза на раждане без усложнения - 40 mg интрамускулно, което може да се повтори през 2 часа, в случай на незадоволителен ефект.

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА * РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ *

Педиатрична популация

Дротаверин ДС е противопоказан при деца (вж. т. 4.3).

4.3 Противопоказания

- Свръхчувтвителност към активното вещество или към някое от помощните вещества (особено към натриев метабисулфит).
- При тежка чернодробна, бъбречна и сърдечна недостатъчност, смущения в сърдечната проводимост (атрио-вентрикуларен блок).
- Не се прилага при деца.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

В случай на ниско кръвно налягане, назначаването на този продукт изисква повишено внимание.
Дротаверин ДС съдържа натриев метабисулфит, който може да предизвика алергичен тип реакции, включително анафилактични симптоми и бронкоспазъм при чувствителни хора, особено с анамнеза за астма или алергия. В случай на свръхчувствителност към натриев метабисулфит, парентералното приложение иа лекарствения продукт трябва да се избягва.
Трябва да се внимава, когато се назначава инжектиране на дротаверин при бременни жени.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Ефектът на антипаркинсоновите лекарствени продукти (леводопа) се намалява при едновременно приемане с дротаверин, т.е. ригидността и треморът се задълбочават.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност
Няма данни за терагогенност и ембриотоксичност от проведените клинични проучвания върху хора и животни. Въпреки това, трябва да се внимава, когато се предписва по време иа бременност, поради ограниченото количество на данни при бременни пациентки.

Кърмене
Поради липса на достатъчно данни, употребата му по време на кърмене не се препоръчва.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

След парентерално приложение, особено i. v., пациентите трябва да бъдат инструктирани да избягват потенциално опасни дейности, като шофиране или работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите лекарствени реакции са класифицирани по честота, както следва: много чести (≥1/10), чести (≥1/100 до <1/10), нечести (≥1/1 000 до <1/100), редки (≥1/10 000 до <1/1 000), много редки (<1/10 000), с неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка).

Отбелязани са следните нежелани лекарствени реакции:

Стомашно чревен тракт
Редки: гадене, констипация.

Централна нервна система

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА * РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ *

Редки: главоболие, замаяност, световъртеж, безсъние.

Сърдечно-съдова система
Редки: сърцебиене, хипотония.

Нарушения на имунната система
Редки: алергични реакции, особено при пациенти, свръхчувствителни към бисулфати.

Съобщаване на подозирани нежелани реакции
Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарственото продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарственото продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез:
Изпълнителна агенция по лекарствата
ул. „Дамян Груев“ № 8
1303 София
тел.: +35 928903417
уебсайт: www.bda.bg.

4.9 Предозиране

Не са описани случаи на остро предозиране с тежки последствия. В случай на предозиране, пациентът трябва да се наблюдава непрекъснато и да се приложи симптоматично и спомагателно лечение.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: папаверин и производни, АТС код: А 03AD02.

Механизъм на действие
Дротаверинът е изохинолиново производно, което проявява спазмолитичния си ефект върху гладката мускулатура чрез инхибиране на ензима фосфодиестераза IV (ФДЕ IV). В следствие на това концентрацията на цАМФ се повишава, което води до инхибиране на ензима MLCK (киназа, фосфорилираща миозиновите леки вериги) и отпускане на гладката мускулатура.
Дротаверинът инхибира ензима ФДЕ IV с *in vitro*, без да инхибира изоензимите ФДЕ III и ФДЕ IV. Във функционално отношение, ФДЕ IV се оказва много важен ензим за понижаване на контрактилната активност на гладките мускули, като се предполага, че селективните инхибитори на ФДЕ IV може да са от полза за лечение на заболявания с хипермотилитет и различни заболявания, свързани със спастични състояния на гастро-интестиналния тракт.
Ензимът, който хидролизира цАМФ в клетките на гладката мускулатура на миокарда и съдовете е основно изоензим ФДЕ III. Това обяснява защо дротаверинът е ефективно спазмолитично средство, без сериозни сърдечно съдови нежелани реакции и силна сърдечно съдова терапевтична активност.

Фармакодинамични ефекти.
Той е ефективен в случаи на спазми на гладката мускулатура, както с невроген, така и с мускулен произход. Независимо от типа на автономната интервенция, дротаверинът действа върху гладката мускулатура на гастро-интестиналната, билиарната, урогениталната и васкуларната система.

Клинични ефекти и безопастност

Поради съдоразширяващия си ефект, той подобрява тъканното оросяване.
Ефектът му е по-силен от този на папаверина. Абсорбацията му е по-бърза и по-пълна и се свързва в по-малка степен със серумните протеини. Предимството му е, че страничният ефект на респираторна възбуда, наблюдаван след парентерално приложение на папаверин не се наблюдава при положение на дротаверин.

Педиатрична популация
Лекарственият продукт не бива да се приема от деца и юноши. Поради липса на достатъчно данни, не се препоръчва приложение на продукта по време на кърмене.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбация
Дротаверинът се абсорбира бързо и напълно, както след орално, така и след интрамускулно приложение.

Разпределение
Дратеверинът се свързва в голяма степен с плазмените протеини (95-98%), особено с албумин, гама и бета-глобулини. C_{max} се достига за 45-60 минути след орално приложение. След метаболизма при първото преминаване (first pass) през черния дроб 65% от приетата доза достига до кръвообращението в непроменен вид.

Метаболизъм:
Метаболизира се в черния дроб. Биологичното му време на полуживот е 8-10 часа.

Екскреция
Практически, за 72 часа дротаверин се елеминира от организма. Повече от 50% се екскретират с урината, а около 30% - с фекалиите. Екскретира се главно под формата на метаболити; непроменената му форма не се открива в урината.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Остра токсичност:
При перорално приложение на плъхове LD_{50} е 1000 mg/kg .
При интравенозно приложение върху бели мишки LD_{50} е 19 mg/kg .

Подостра:
При прилагането на дротаверин в продължение на 4 месеца в доза 80 – 160 mg/kg на кучета и плъхове, не са наблюдавани нежелани токсични лабораторни и хистологични промени, нито тератогенни ефекти.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Натриев метабисулфит
Етанол (96%)
Вода за инжекции

6.2 Несъвместимости

Неприложимо.

6.3 Срок на годност

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА • РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ •

3 години.

6.4 Специални условия на съхранение

На защитено от светлина място при температура под 25°C.

6.5 Вид и съдържание на опаковката

2 ml самочупещи се ампули от тъмно неутрално стъкло тип I.
10 броя ампули се поставят в блистери от PVC фолио.
Единични блистери, заедно с листовка за пациента се поставят в клишираните, сгъваеми картонени кутии.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

ДАНСОН-БГ ООД,
ул. Отец Паисий № 26,
2400 гр. Радомир,
България

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Регистрационен № 20180023.

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Дата на първо разрешаване: 01.02.2018.
Дата на последно подновяване:

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

11/2022

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА * РЕПУБЛИКА БЪЛГАРИЯ *