

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

ДРО СПАЗ 20 mg/ ml инжекционен разтвор
DRO SPAZ 20 mg/ ml solution for injection

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

1 ml от разтвора съдържа 20 mg Дротаверин хидрохлорид (*Drotaverine hydrochloride*).
За пълния списък на помощните вещества, вж. точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Инжекционен разтвор

Описание на разтвора: жълт, бистър разтвор, без видими частици.
pH: от 3.0 до 5.5.

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 при раждане без усложнения, за намаляване на продължителността на цервикалната дилатация и общото времетраене на раждането.

4.2. Дозировка и начин на приложение

Прилага се интрамускулно и интравенозно. 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.

DRO SPAZ е противопоказан при деца (вж. т. 4.3).

4.3. Противопоказания

Свръхчувствителност 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

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1
Към Рег. № 20090061
Разрешение № 11-25458 / 02-04-2014
Одобрение №



В случай на ниско кръвно налягане, назначаването на този продукт изисква повишено внимание. DRO SPAZ съдържа натриев метабисулфит, който може да предизвика алергичен тип реакции, включително анафилактични симптоми и бронхоспазъм при чувствителни хора, особено с анамнеза за астма или алергия. В случай на свръхчувствителност към натриев метабисулфит, парентералното приложение на 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 тератогенност и ембриотоксичност от проведените клинични проучвания върху хора и животни. Въпреки това, трябва да се внимава, когато се предписва по време на бременност.

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, установени при клиничните изпитвания и за които се съобщава, като евентуално свързани с приема на дротаверин, са класифицирани според честотата на тяхната поява. Според честота те са разделени на: (засегнати повече от 1 на 10 пациенти), чести (засегнати до 1 на 10 пациенти), нечести (засегнати до 1 на 100 пациенти), редки (засегнати до 1 на 1 000 пациенти) и много редки (засегнати до 1 на 10 000 пациенти).

Отбелязани са следните нежелани лекарствени реакции:

Стомашно-чревен тракт

Рядко: гадене, констипация.

Централна нервна система

Рядко: главоболие, замаяност, световъртеж, безсъние.

Сърдечно-съдова система

Рядко: сърцебиене, хипотония.

Нарушения на имунната система

Рядко: алергични реакции, особено при пациенти, свръхчувствителни към бисулфити.

Съобщаване на подозирани нежелани реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез:



Изпълнителна агенция по лекарствата
ул. „Дамян Груев“ № 8
1303 София
Тел.: +35928903417
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: A03A D02

- 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 *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 гастроинтестиналния 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 случай на спазми на гладката мускулатура, както с неврален, така и с мускулен произход. Независимо от типа на автономната инервация, дротаверинът действа върху гладката мускулатура на гастро-интестиналната, билиарната, урогениталната и васкуларната система.

- Клинични ефекти и безопасност

Поради съдоразширяващия си ефект, той подобрява тъканното оросяване.

Ефектът му е по-силен от този на папаверина. Абсорбцията 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 приложение на дротаверин

- Педиатрична популация

Лекарствения 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

- Абсорбция

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

- Разпределение

Дротаверин 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 елиминира 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 токсичност:

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 инъекции

6.2. Несъвместимости

Неприложимо.

6.3. Срок на годност

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 разтвор в ампула. 10 ампули в една блистерна опаковка.

6.6. Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

АДИФАРМ ЕАД
бул. Симеоновско шосе № 130
София 1700, България

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

20090061

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

26.02.2009

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Април, 2013 г.

