

## 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 (инж. 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

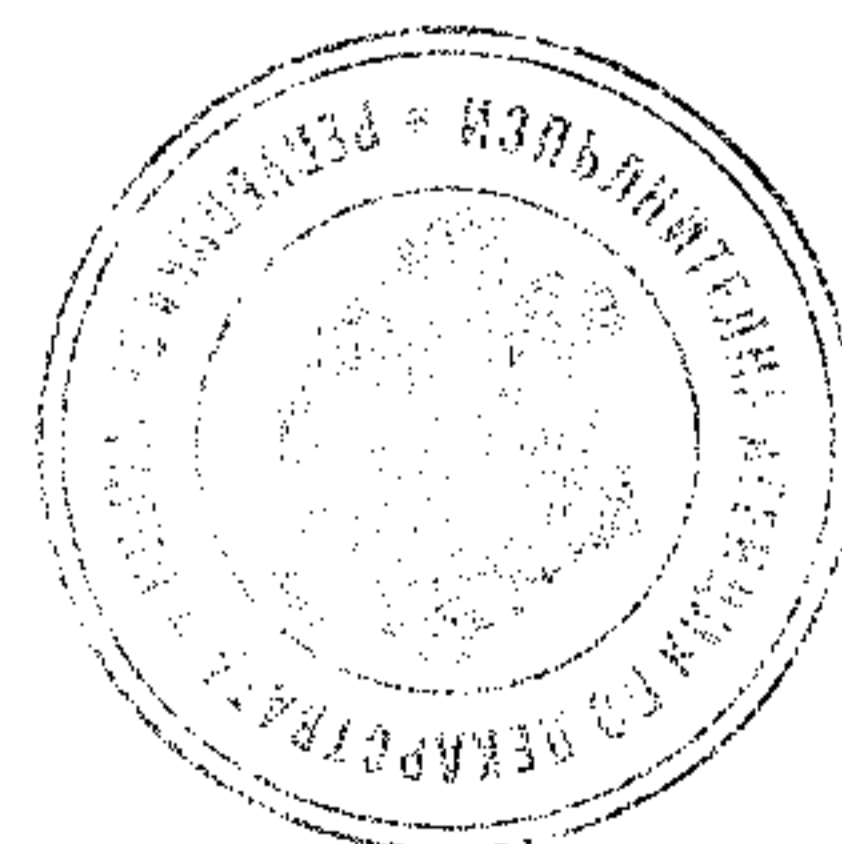
Прилага се интрамускулно и интравенозно. Обичайната дневна доза за възрастни е 40 - 240 mg, разделени на 1-3 интрамускулни приложения.

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).

<b>ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА</b>
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1
Към РУ 11-4312, 26.02.09
Одобрено: 31 / 10.02.09



### **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**

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. Взаимодействия с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействия**

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

### **4.6. 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.

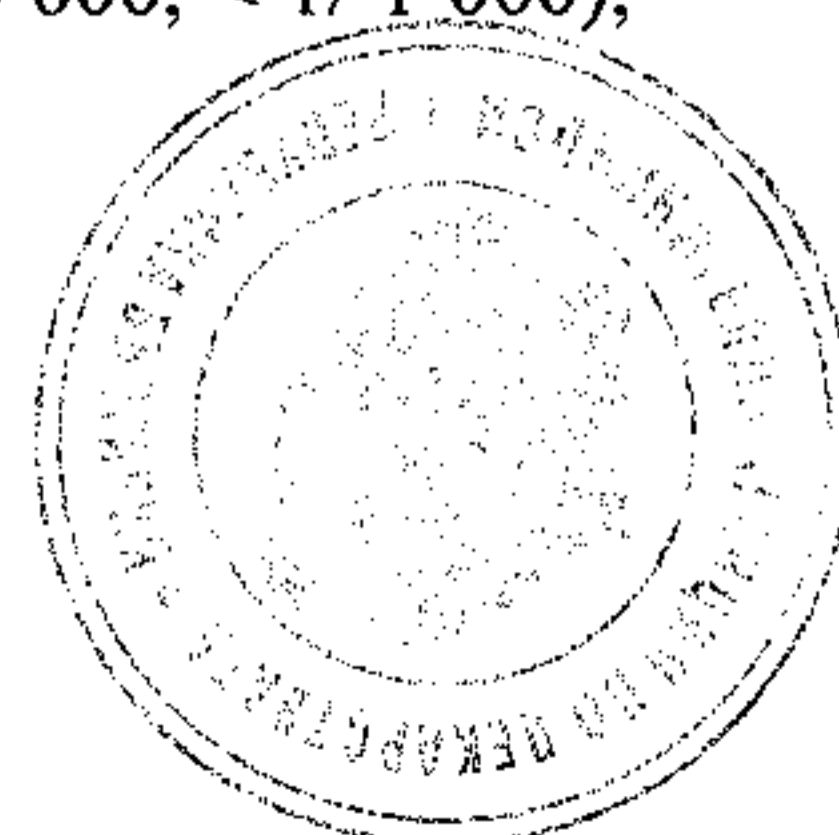
Кърмене: Поради липса на достатъчно данни, употребата му по време на кърмене не се препоръчва.

### **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 реакции, установени при клиничните изпитвания и за които се съобщава, като евентуално свързани с приема на дротаверин, разделени в групи по честота: много често (> 1/10); често (> 1/ 100, < 1/10); нечесто (> 1/1 000, < 1/ 100) ; рядко (<1/ 100 000, < 1/ 1 000); много рядко (<1/ 100 000) са следните:



### *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.

## **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:** A03AD 02

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 сърдечносъдови нежелани реакции и силна



сърдечносъдова терапевтична активност.

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 гастроинтестиналната, билиарната, урогениталната и васкуларната система.

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.

### **5.2. Фармакокинетични свойства**

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

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

Практически, за 72 часа дротаврин 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.

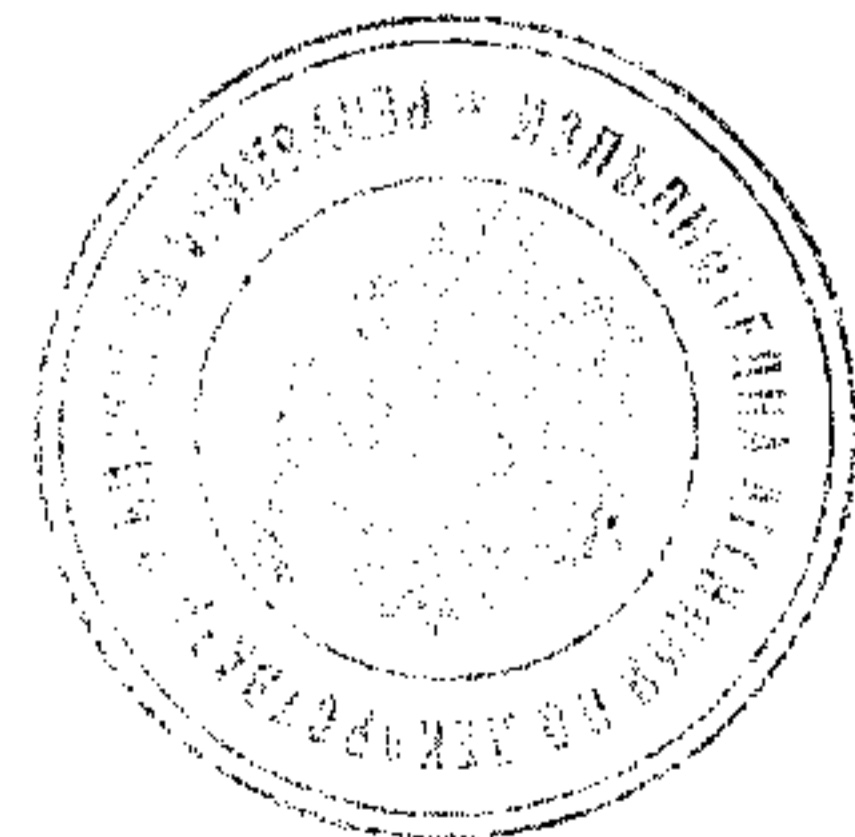
*Подостра токсичност:*

При прилагането на drotaverine 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 п| оцентен)

Вода за инжекции

**6.2. Несъвместимости**

Не е приложимо

**6.3. Срок на годност**

2 години.

**6.4. Специални условия на съхранение**

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

Да се съхранява на място, недостъпно за деца!

Да не се използва след изтичане на срока на годност, обозначен върху опаковката.

**6.5. Данни за опаковката**

2 ml разтвор в ампула. 10 ампули в една пластична опаковка.

**6.6. Специални предпазни мерки при изхвърляне / и работа**

Няма специални изисквания.

**7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба**

АДИФАРМ ЕАД

бул. Симеоновско шосе № 130

София 1700, България

**8. Номер на разрешението за употреба**

**9. Дата на първо разрешаване/ подновяване на разрешението за употреба**

**10. Дата на актуализация на текста.**

Февруари 2009 г.

