

Charakterystyka Produktu Leczniczego

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

NO-SPA Ampułki 20 mg/ml, roztwór do wstrzykiwań

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

1 ml roztworu do wstrzykiwań zawiera 20 mg chlorowodoru drotaweryny (*Drotaverini hydrochloridum*).

2 ml (1 ampłka) zawierają 40 mg chlorowodoru drotaweryny.

Substancje pomocnicze patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Roztwór do wstrzykiwań.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1. Wskazania do stosowania

Stany skurczowe mięśni gładkich związane z chorobami dróg żółciowych: kamica dróg żółciowych, zapaleniem pęcherzyka żółciowego.

Stany skurczowe mięśni gładkich dróg moczowych:

kamica nerkowa, zapalenie miedniczek nerkowych, zapalenie pęcherza moczowego, bolesne parcie na mocz.

Wspomagająco

-w stanach skurczowych mięśni gładkich przewodu pokarmowego: w chorobie wrzodowej żołądka i dwunastnicy, w stanach skurczowych wpustu i odźwiernika żołądka, zespole drażliwego jelita grubego, zaparciach spastycznych i wzdęciach jelit,

-w stanach skurczowych w obrębie dróg rodnych: w bolesnym miesiączkowaniu.

4.2. Dawkowanie i sposób podawania

Dawka dobową wynosi 40 do 240 mg i należy ją podawać w 1 do 3 dawkach podzielonych, podskórnie lub domięśniowo.

W przypadku ostrego napadu kamicy żółciowej lub nerkowej stosuje się 40 do 80 mg drotaweryny powoli (ok. 30 sek.) dożylnie.

W innych spastycznych bólach brzucha stosuje się 40 do 80 mg drotaweryny domięśniowo lub podskórnie. W razie konieczności dawkę produktu można powtórzyć maksymalnie do 3 razy na dobę.

4.3. Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na drotawerynę lub którykolwiek składnik preparatu (zwłaszcza nadwrażliwość na pirosiarczyn).

Ciężka niewydolność nerek i wątroby.

Ciężka niewydolność serca (zespół małego rzutu).

Dzieci.

4.4. Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Należy zachować ostrożność podczas podawania produktu leczniczego pacjentom z niedociśnieniem tętniczym. Z powodu ryzyka wystąpienia zapaści, dożylnie lek należy podawać leżącemu pacjentowi.

Produkt leczniczy zawiera pirosiarczyn, który może powodować wystąpienie reakcji alergicznych, w tym objawy anafilaktyczne i skurcz oskrzeli u wrażliwych pacjentów,

zwłaszcza tych z astmą i alergią w wywiadzie.

W przypadku nadwrażliwości na pirosiarczyn sodu należy unikać podawania produktu leczniczego parenteralnie (patrz pkt 4.3).

Należy zachować ostrożność podczas podawania drotaweryny w postaci roztworu do wstrzykiwań kobietom w ciąży (patrz pkt. 4.6).

Nie należy stosować drotaweryny w okresie porodu (patrz punkt 4.6)

4.5. Interakcje z innymi lekami i inne rodzaje interakcji

Inhibitory fosfodiesterazy, takie jak papaweryna i jej pochodne zmniejszają przeciwparkinsonowe działanie lewodopy. W przypadku jednoczesnego stosowania drotaweryny i lewodopy może dojść u pacjenta do nasilenia drżeń i sztywności.

4.6. Ciąża i laktacja

Ciąża

Ze względu na brak wystarczających badań, preparat można stosować u pacjentek w okresie ciąży jedynie w przypadkach gdy korzyść jego zastosowania przewyższa czynniki ryzyka.

Substancja czynna przechodzi przez łożysko.

W badaniu klinicznym stwierdzono zwiększone ryzyko krwotoku poporodowego u pacjentek otrzymujących drotawerynę w trakcie porodu. Dlatego nie należy stosować drotaweryny w okresie porodu.

Karmienie piersią

Nie wiadomo czy drotaweryna przenika do mleka kobiecego. Stosownie drotaweryny w okresie karmienia piersią nie jest zalecane.

4.7. Wpływ leku na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu

Należy poinformować pacjentów, że po podaniu parenteralnym leku, zwłaszcza dożylnym, powinni unikać wykonywania potencjalnie niebezpiecznych czynności, takich jak prowadzenie pojazdów lub obsługa maszyn.

4.8. Działania niepożądane

Podczas badań klinicznych następujące działania niepożądane zgłaszane przez badaczy jako co najmniej możliwie związane z drotaweryną są przedstawione według częstości występowania (często >1% <10%; niezbyt często >0,1% <1%; rzadko >0,01% <0,1%) i klasyfikacji układ-narząd.

Zaburzenia żołądka i jelit:

Rzadko: nudności i zaparcia.

Zaburzenia układu nerwowego:

Rzadko: bóle głowy, zawroty głowy, bezsenność.

Zaburzenia serca i naczyń:

Rzadko: kołatanie serca, niedociśnienie tętnicze

Zaburzenie układu immunologicznego:

Rzadko: reakcje alergiczne, zwłaszcza u pacjentów nadwrażliwych na pirosiarczyn.

4.9. Przedawkowanie

Brak doniesień na temat przedawkowania produktu leczniczego.

W badaniach klinicznych, przy znacznym, zamierzonym przedawkowaniu drotaweryny odnotowano pojedyncze przypadki zaburzenia rytmu serca i przewodnictwa włączając całkowity blok odnogi pęczka Hisa i zatrzymanie krążenia, które może być śmiertelne.

W razie wystąpienia przedawkowania należy dokładnie obserwować pacjenta i wdrożyć leczenie objawowe.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1. Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: papaweryna i jej pochodne
kod ATC: A 03 AD 02

Silne działanie spazmolityczne drotaweryny jest wynikiem jej znacznego hamującego działania na enzym fosfodiesterazę. Enzym fosfodiesteraza jest odpowiedzialny za hydrolizę cAMP do AMP. Zatem zahamowanie fosfodiesterazy powoduje zwiększenie stężenia cAMP, co prowadzi do następującej kaskady zjawisk. Duże stężenie cAMP aktywuje zależną od cAMP kinazę fosforylującą lekkie łańcuchy miozyny (MLCK). Fosforylacja MLCK powoduje zmniejszenie jej powinowactwa do kompleksu Ca-kalmodulina i w ten sposób nieczynna postać MLCK utrzymuje mięsień w stanie rozkurczu. cAMP wpływa również na stężenie jonu Ca^{++} w cytozolu przez stymulowanie transportu jonów Ca^{++} do przestrzeni zewnątrzkomórkowej i reticulum sarkoplazmatycznego. To stężenie jonu Ca^{++} zmniejszające działanie drotaweryny poprzez cAMP tłumaczy antagonistyczne działanie drotaweryny w stosunku do Ca^{++} .

Drotaweryna hamuje *in vitro* enzym fosfodiesterazę (PDE) IV, nie hamując izoenzymów PDE III i PDE V. PDE IV spełnia bardzo ważną rolę w zmniejszaniu kurczliwości mięśni gładkich, co sugeruje, że wybiórcze inhibitory PDE IV mogą być stosowane w leczeniu nasilonej perystaltyki i różnych chorób przebiegających ze stanami spastycznymi przewodu pokarmowego.

Enzym, który hydrolizuje cAMP w mięśniu sercowym i w komórkach mięśni gładkich naczyń, jest głównie izoenzymem PDE III, to wyjaśnia, dlaczego drotaweryna będąc lekiem spazmolitycznym nie wywołuje ciężkich niepożądanych objawów ze strony układu krążenia i nie ma terapeutycznego wpływu na krążenie.

Drotaweryna jest stosowana w skurczu mięśni gładkich, pochodzenia zarówno nerwowego, jak i mięśniowego. Działanie rozkurczające drotaweryny nie zależy od rodzaju unerwienia oraz lokalizacji mięśni gładkich (przewód pokarmowy, układ moczowo-płciowy, układ krążenia oraz drogi żółciowe). Drotaweryna działając rozszerzająco na naczynia powoduje zwiększenie przepływu krwi przez tkanki.

5.2. Właściwości farmakokinetyczne

Drotaweryna szybko i całkowicie wchłania się po podaniu parenteralnym.

W osoczu wiąże się z albuminami i alfa- i beta-globulinami.

Produkt leczniczy jest metabolizowany w wątrobie; okres półtrwania wynosi 16-22 godziny.

Podczas pierwszego przejścia przez wątrobę 65% podanej dawki drotaweryny dociera do krążenia w postaci niezmienionej.

Więcej niż 50% podanej dawki jest wydalane z moczem, około 30% z kałem; lprodukt jest wydalany głównie w postaci metabolitów.

5.3. Dane przedkliniczne o bezpieczeństwie

Dane niekliniczne, uzyskane na podstawie konwencjonalnych badań farmakologicznych dotyczących bezpieczeństwa stosowania, toksyczności po podaniu wielokrotnym, genotoksyczności, potencjalnego działania rakotwórczego i toksycznego wpływu na reprodukcję, nie ujawniają występowania szczególnego zagrożenia dla człowieka.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1. Wykaz substancji pomocniczych

Sodu pirosiarczyn

Etanol 96%

Woda do wstrzykiwań

6.2. Niezgodności farmaceutyczne

Nie stwierdzono.

6.3. Okres ważności

36 miesięcy

6.4. Specjalne środki ostrożności przy przechowywaniu

Produkt leczniczy przechowywać w temperaturze poniżej 25°C. Chronić od światła.

6.5. Rodzaj i zawartość opakowania

5 ampulek ze szkła oranżowego po 2 ml w tekturowym pudełku.

6.6. Instrukcja dotycząca przygotowania produktu leczniczego do stosowania i usuwania jego pozostałości

Brak specjalnych zaleceń.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

CHINOIN

Pharmaceutical and Chemical Works Private Co. Ltd.

Tó u. 1-5

H-1045 Budapeszt

Węgry

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

R/0307

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU / DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

04.05.1993; 16.06.2008

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO