

## ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

### ДРОТАВЕРИН

#### *Склад:*

діюча речовина: 1 таблетка містить дротаверину гідрохлориду у перерахуванні на 100 % речовину 40 мг;

допоміжні речовини: крохмаль картопляний; лактоза, моногідрат; повідон; кальцію стеарат.

Лікарська форма. Таблетки.

*Основні фізико-хімічні властивості:* таблетки світло-жовтого, світло-жовтого з зеленуватим відтінком, жовтого або жовтого з зеленуватим відтінком кольору круглої форми з плоскою поверхнею, з фаскою. На поверхні таблеток можлива мармуровість.

Фармакотерапевтична група. Засоби, які застосовуються при функціональних шлунково-кишкових розладах.

Код АТХ А03А D02.

#### **Фармакологічні властивості.**

##### *Фармакодинаміка.*

Дротаверин – похідне ізохіноліну, який проявляє спазмолітичну дію на гладку мускулатуру шляхом пригнічення дії ферменту фосфодіестераза IV (ФДЕ IV), що спричиняє збільшення концентрації цАМФ і, завдяки інактивації легкого ланцюжка кінази міозину (MLCK), до розслаблення гладкого м'яза.

In vitro дротаверин пригнічує дію ферменту ФДЕ IV і не впливає на дію ізоферментів фосфодіестераза III (ФДЕ III) і фосфодіестераза V (ФДЕ V). ФДЕ IV має велике функціональне значення для зниження скорочувальної активності гладких м'язів, тому вибірккові інгібітори цього ферменту можуть бути корисними для лікування хвороб, які супроводжуються гіперрухливістю, а також різних захворювань, під час яких виникають спазми шлунково-кишкового тракту.

У клітинах гладких м'язів міокарда та судин цАМФ гідролізується здебільшого ізоферментом ФДЕ III, тому дротаверин є ефективним спазмолітичним засобом, який не має значних

побічних ефектів з боку серцево-судинної системи та сильної терапевтичної дії на цю систему.

Дротаверин ефективний при спазмах гладкої мускулатури як нервового, так і м'язового походження. Дротаверин діє на гладку мускулатуру шлунково-кишкової, біліарної, сечостатевої та судинної систем незалежно від типу їхньої автономної іннервації.

Він посилює кровообіг у тканинах завдяки своїй здатності розширювати судини.

#### *Фармакокінетика.*

Дія дротаверину є сильнішою за дію папаверину, абсорбція більш швидка та повна, він менше зв'язується з білками сироватки крові. Перевагою дротаверину є також те, що, на відміну від папаверину, після його парентерального введення не спостерігається такого побічного ефекту як стимуляція дихання.

Дротаверин швидко та повністю абсорбується після перорального застосування. Він високою мірою (95-98 %) зв'язується з альбумінами плазми крові, гама- та бета-глобулінами. Максимальна концентрація у сироватці крові досягається протягом 45-60 хвилин після перорального застосування. Після первинного метаболізму 65 % застосованої дози надходить до кровообігу в незміненому вигляді.

Метаболізується у печінці. Період напіввиведення становить 8-10 годин.

За 72 години дротаверин практично повністю виводиться з організму, приблизно 50 % виводиться із сечею та приблизно 30 % – з калом. В основному дротаверин виводиться у формі метаболітів, у незмінній формі в сечі не виявляється.

### **Клінічні характеристики**

#### ***Показання.***

З лікувальною метою при:

- спазмах гладкої мускулатури, пов'язаних із захворюваннями біліарного тракту: холецистолітіазі, холангіолітіазі, холециститі, перихолециститі, холангіті, папіліті;
- спазмах гладкої мускулатури при захворюваннях сечового тракту: нефролітіазі, уретролітіазі, пієліті, циститі, тенезмах сечового міхура.

Як допоміжне лікування при:

- спазмах гладкої мускулатури шлунково-кишкового тракту: виразковій хворобі шлунка та дванадцятипалої кишки, гастриті, кардіо- та/або пілороспазмі, ентериті, коліті, спастичному коліті із запором і синдромі подразненого кишечника, що супроводжується метеоризмом;
- головному болю напруження;
- гінекологічних захворюваннях (дисменорея).

#### ***Протипоказання.***

Підвищена чутливість до дротаверину або до будь-якого компонента препарату. Тяжка печінкова, ниркова або серцева недостатність (синдром малого серцевого викиду).

*Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.*

Інгібітори фосфодіестерази, такі як папаверин, знижують антипаркінсонічний ефект леводопи. Слід з обережністю застосовувати препарат Дротаверин одночасно з леводопою, оскільки антипаркінсонічний ефект останньої зменшується, а ригідність та тремор посилюються.

### **Особливості застосування.**

Застосовувати з особливою обережністю при артеріальній гіпотензії.

Кожна таблетка препарату Дротаверин містить 50 мг лактози. Не застосовувати для лікування хворих, із рідкісними спадковими захворюваннями, такі як непереносимість галактози, дефіцит лактази Лаппа або синдром мальабсорбції глюкози-галактози.

*Застосування у період вагітності або годування груддю.*

**Вагітність.** Як показали результати ретроспективних клінічних досліджень та досліджень на тваринах, пероральне застосування препарату не спричиняло жодних ознак будь-якого прямого або непрямого впливу на вагітність, ембріональний розвиток, пологи або післяпологовий розвиток. Однак необхідно з обережністю призначати препарат вагітним жінкам.

**Годування груддю.** Через відсутність даних у період годування груддю застосування препарату не рекомендується.

*Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.*

Якщо у пацієнтів після застосування препарату спостерігається запаморочення, вони повинні уникати потенційно небезпечних занять, таких як керування автомобілем і виконання робіт, що потребують підвищеної уваги.

*Спосіб застосування та дози.*

Дорослі: звичайна середня доза становить 120-240 мг на добу за 2-3 прийоми;

У разі застосування дротаверину дітям:

дітям віком 6-12 років максимальна добова доза становить 80 мг (розподілена на 2 прийоми);

дітям віком від 12 років максимальна добова доза становить 160 мг (розподілена на

2-4 прийоми).

*Діти.* Дітям віком до 6 років застосування препарату протипоказано.

Застосування дротаверину дітям не оцінювалося у клінічних дослідженнях.

*Передозування.*

*Симптоми:* при значному передозуванні дротаверину спостерігалися порушення серцевого ритму та провідності, у тому числі повна блокада пучка Гіса та зупинка серця, які можуть бути летальними.

При передозуванні пацієнт повинен знаходитися під ретельним спостереженням лікаря та отримувати симптоматичне лікування, включаючи викликання блювання та/або промивання шлунка.

### ***Побічні реакції.***

Побічні дії, що, можливо, були спричинені дротаверином, розподілені за системою органів та частотою виникнення: дуже поширені ( $> 1/10$ ), поширені ( $> 1/100$ ,  $< 1/10$ ), непоширені ( $> 1/1000$ ,  $< 1/100$ ), поодинокі ( $> 1/10000$ ,  $< 1/1000$ ), вкрай поодинокі ( $< 1/10000$ ).

*З боку імунної системи:* поодинокі: алергічні реакції, включаючи ангіоневротичний набряк, кропив'янку, висипання, свербіж, гіперемію шкіри, пропасницю, озноб, підвищення температури тіла, слабкість.

*З боку серцево-судинної системи:* поодинокі: прискорене серцебиття, артеріальна гіпотензія.

*З боку нервової системи:* поодинокі: головний біль, запаморочення, безсоння.

*З боку шлунково-кишкового тракту:* поодинокі: нудота, запор, блювання.

*Термін придатності.* 5 років.

*Умови зберігання.* Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Зберігати в недоступному для дітей місці.

*Упаковка.* По 10 таблеток у блістері; 1 або 2, або 3 блістери у пачці.

*Категорія відпуску.* Без рецепта.

Виробник. ПАТ «Київмедпрепарат».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 01032, м. Київ, вул. Саксаганського, 139.

## ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного средства

## ДРОТАВЕРИН

### *Состав:*

действующее вещество: 1 таблетка содержит дротаверина гидрохлорида в пересчете на 100 % вещество 40 мг;

вспомогательные вещества: крахмал картофельный; лактоза, моногидрат; повидон; кальция стеарат.

Лекарственная форма. Таблетки.

*Основные физико-химические свойства:* таблетки светло-желтого, светло-желтого с зеленоватым оттенком, жёлтого или желтого с зеленоватым оттенком цвета круглой формы с плоской поверхностью, с фаской. На поверхности таблеток возможна мраморность.

Фармакотерапевтическая группа. Средства, применяющиеся при функциональных желудочно-кишечных расстройствах.

Код АТХ А03А D02.

### ***Фармакологические свойства.***

### *Фармакодинамика.*

Дротаверин – производное изохинолина, который оказывает спазмолитическое действие на гладкую мускулатуру путем угнетения действия фермента фосфодиэстеразы IV

(ФДЭ IV), что влечет к увеличению концентрации цАМФ и, благодаря инактивации легкой цепочки киназы миозина (MLCK), к расслаблению гладких мышц.

In vitro дротаверин подавляет действие фермента ФДЭ IV и не влияет на действие изоферментов фосфодиэстеразы III (ФДЭ III) и фосфодиэстеразы V (ФДЭ V). ФДЭ IV имеет большое функциональное значение для снижения сократительной активности гладких мышц, поэтому выборочные ингибиторы этого фермента могут быть полезными для лечения болезней, сопровождающихся гиперподвижностью, а также различных заболеваний, при которых возникают спазмы желудочно-кишечного тракта.

В клетках гладких мышц миокарда и сосудов цАМФ гидролизуется в основном изоферментом ФДЭ III, поэтому дротаверин является эффективным спазмолитическим средством, которое не имеет значительных побочных эффектов со стороны сердечно-сосудистой системы и сильного терапевтического действия на эту систему.

Дротаверин эффективен при спазмах гладкой мускулатуры как нервного, так и мышечного происхождения. Дротаверин действует на гладкую мускулатуру желудочно-кишечной, билиарной, мочеполовой и сосудистой систем независимо от типа их автономной иннервации.

Он усиливает кровообращение в тканях благодаря своей способности расширять сосуды.

### *Фармакокинетика.*

Действие дротаверина является сильнее действия папаверина, абсорбция более быстрая и полная, он меньше связывается с белками сыворотки крови. Преимуществом дротаверина является также то, что, в отличие от папаверина, после его парентерального введения не наблюдается такого побочного эффекта как стимуляция дыхания.

Дротаверин быстро и полностью абсорбируется после перорального применения. Он в высокой степени (95-98 %) связывается с альбуминами плазмы крови, гамма- и бета-глобулинами. Максимальная концентрация в сыворотке крови достигается в течение 45-60 минут после перорального применения. После первичного метаболизма 65 % примененной дозы поступает в кровоток в неизменном виде.

Метаболизируется в печени. Период полувыведения составляет 8-10 часов.

За 72 часа дротаверин практически полностью выводится из организма, более 50 % выводится с мочой и приблизительно 30 % – с калом. В основном дротаверин выводится в форме метаболитов, в неизменной форме в моче не обнаруживается.

### **Клинические характеристики.**

## ***Показания.***

С лечебной целью при:

- спазмах гладкой мускулатуры, связанных с заболеваниями билиарного тракта: холецистолитиазе, холангиолитиазе, холецистите, перихолецистите, холангите, папиллите;
- спазмах гладкой мускулатуры при заболеваниях мочевого тракта: нефролитиазе, уретролитиазе, пиелите, цистите, тенезмах мочевого пузыря.

Как дополнительное лечение при:

- спазмах гладкой мускулатуры желудочно-кишечного тракта: язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, гастрите, кардио- и/или пилороспазме, энтерите, колите, спастическом колите с запором и синдроме раздраженного кишечника, сопровождающемся метеоризмом;
- головной боли напряжения;
- гинекологических заболеваниях (дисменорея).

## ***Противопоказания.***

Повышенная чувствительность к дротаверину или к какому-либо компоненту препарата. Тяжелая печеночная, почечная или сердечная недостаточность (синдром малого сердечного выброса).

## ***Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.***

Ингибиторы фосфодиэстеразы, такие как папаверин, снижают антипаркинсонический эффект леводопы. Следует с осторожностью применять препарат Дротаверин одновременно с леводопой, так как антипаркинсонический эффект последней уменьшается, а ригидность и тремор усиливаются.

## ***Особенности применения.***

Применять с особой осторожностью при артериальной гипотензии.

Каждая таблетка препарата Дротаверин содержит 50 мг лактозы. Не применять для лечения больных с редкими наследственными заболеваниями, такими как непереносимость галактозы, дефицит лактазы Лаппа или синдром мальабсорбции глюкозы-галактозы.

Применение в период беременности или кормления грудью.

**Беременность.** Как показали результаты ретроспективных клинических исследований и исследований на животных, пероральное применение препарата не вызывало никаких признаков какого-либо прямого или непрямого влияния на беременность, эмбриональное

развитие, роды или послеродовое развитие. Однако необходимо с осторожностью назначать препарат беременным женщинам.

*Кормление грудью.* Из-за отсутствия данных в период кормления грудью, применение препарата не рекомендуется.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Если у пациентов после применения препарата наблюдается головокружение, они должны избегать потенциально опасных занятий, таких как управление автомобилем и выполнения работ, которые требуют повышенного внимания.

*Способ применения и дозы.*

Взрослые: обычная средняя доза составляет 120-240 мг в сутки за 2-3 приема;

В случае применения дротаверина детям:

для детей 6-12 лет максимальная суточная доза составляет 80 мг (разделена на 2 приема);

для детей с 12 лет максимальная суточная доза составляет 160 мг (разделена на 2-4 приема).

Дети. Детям возрастом до 6 лет применение препарата противопоказанно.

Применение дротаверина детям не оценивалось в клинических исследованиях.

*Передозировка.*

*Симптомы:* при значительной передозировке дротаверина наблюдались нарушения сердечного ритма и проводимости, в том числе полная блокада пучка Гиса и остановка сердца, которые могут быть летальными.

При передозировке пациент должен находиться под тщательным наблюдением врача и получать симптоматическое лечение, включая стимуляцию рвоты и/или промывание желудка.

***Побочные реакции.***

Побочные действия, которые, возможно, были вызваны дротаверином, распределены по органам и частоте возникновения: очень часто ( $> 1/10$ ), часто ( $> 1/100$ ,  $< 1/10$ ),



нечасто ( $> 1/1000$ ,  $< 1/100$ ), редко ( $> 1/10000$ ,  $< 1/1000$ ), очень редко ( $< 1/10000$ ).

Со стороны иммунной системы: редко: аллергические реакции, включая ангионевротический отек, крапивницу, сыпь, зуд, гиперемию кожи, лихорадку, озноб, повышение температуры тела, слабость.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко: учащенное сердцебиение, артериальная гипотензия.

Со стороны нервной системы: редко: головная боль, головокружение, бессонница.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: редкие: тошнота, запор, рвота.

*Срок годности.* 5 лет.

Условия хранения. Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка. По 10 таблеток в блистере; 1 или 2, или 3 блистера в пачке.

Категория отпуска. Без рецепта.

Производитель. ПАО «Киевмедпрепарат».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.

Украина, 01032, г. Киев, ул. Саксаганского, 139.