

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ДРОТАВЕРИН

(DROTAVERINE)

Склад:

діюча речовина: дротаверину гідрохлорид;

1 таблетка містить: дротаверину гідрохлорид – 0,04 г;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, крохмаль картопляний, лактози моногідрат, кремнію діоксид колоїдний безводний, кальцію стеарат.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки круглої форми від світло-жовтого до темно-жовтого кольору, з двоопуклою поверхнею, допускається мармуровість.

Фармакотерапевтична група.

Засоби, які застосовують при функціональних шлунково-кишкових розладах.

Код АТХ А03А D02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Дротаверин – похідне ізохіноліну, чинить спазмолітичну дію безпосередньо на гладку мускулатуру шляхом пригнічення дії ферменту фосфодіестерази IV (ФДЕ IV), що спричиняє збільшення концентрації цАМФ і завдяки інактивації легкого ланцюжка кінази міозину (MLCK) призводить до розслаблення гладких м'язів.

In vitro дротаверин пригнічує дію ферменту ФДЕ IV і не впливає на дію ізоферментів фосфодіестерази III (ФДЕ III) і фосфодіестерази V (ФДЕ V). ФДЕ IV має велике функціональне значення для зниження скорочувальної активності гладких м'язів, тому вибіркові 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.

Дія дротаверину є сильнішою за дію папаверину, абсорбція швидша та повніша, 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.

Фармакінетика.

Дротаверин швидко та повністю абсорбується після перорального застосування. Він високою мірою (95–98 %) зв'язується з альбумінами плазми, 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 у 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 у 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 обережністю при артеріальній гіпотензії.

Препарат Дротаверин містить лактозу. Не застосовувати для лікування пацієнтів, які страждають на рідкісні спадкові захворювання, такі як непереносимість галактози, дефіцит лактази Лаппа або синдром мальабсорбції глюкози-галактози.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність. Через недостатність клінічних даних призначати препарат вагітним жінкам можна лише за умови, що переваги застосування перевищують ризики. Активна речовина проникає через плаценту. Препарат не можна застосовувати під час пологів через підвищений ризик кровотечі у післяпологовий період.

Годування груддю. Оскільки дротаверин екскретується у грудне молоко, у період годування груддю застосування препарату не рекомендується.

Фертильність. Даних щодо впливу на фертильність людини немає.

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

Якщо після застосування препарату спостерігається запаморочення, слід уникати 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.

Діти: застосування дротаверину дітям у клінічних дослідженнях не вивчали; якщо ж

застосування дротаверину є необхідним, то:

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).

Даних щодо застосування препарату дітям віком до 6 років немає.

Діти. Дітям віком до 6 років застосування препарату протипоказано.

Застосування дротаверину дітям не оцінювали у клінічних дослідженнях.

Передозування.

Симптоми: при значному передозуванні дротаверину спостерігалися порушення серцевого ритму та провідності, в 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 реакції, що спостерігали під час клінічних досліджень і, можливо, були спричинені дротаверином, розподілені за системою органів та частотою виникнення: дуже часто ($>1/10$), часто ($>1/100$, $<1/10$), нечасто ($>1/1000$, $<1/100$), рідко ($>1/10000$, $<1/1000$), дуже рідко ($<1/10000$), частота виникнення невідома: не може бути розрахована за наявними даними.

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

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

З боку нервової системи. Рідко: головний біль, запаморочення, безсоння.

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

Термін придатності. 3 роки.

Не застосовувати після закінчення терміну придатності, зазначеного на упаковці.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері, по 1 або 2 блістери в пачці з картону.

Категорія відпуску.

Без рецепта.

Виробник.

ПАТ «Хімфармзавод «Червона зірка».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

61010, Україна, м. Харків, вул. Гордієнківська, 1.

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного средства

ДРОТАВЕРИН

(DROTAVERINE)

Состав:

действующее вещество: дротаверина гидрохлорид;

1 таблетка содержит: дротаверина гидрохлорид – 0,04 г;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, крахмал картофельный, лактозы моногидрат, кремния диоксид коллоидный безводный, кальция стеарат.

Лекарственная форма. Таблетки.

Основные физико-химические свойства: таблетки круглой формы от светло-желтого до темно-желтого цвета, с двояковыпуклой поверхностью, допускается мраморность.

Фармакотерапевтическая группа.

Средства, применяемые при функциональных желудочно-кишечных расстройствах.

Код АТХ А03А D02.

Фармакологические свойства.**Фармакодинамика.**

Дротаверин – производное изохинолина, оказывает спазмолитическое действие непосредственно на гладкую мускулатуру путем угнетения действия фермента фосфодиэстеразы IV (ФДЭ IV), что вызывает увеличение концентрации цАМФ и благодаря инактивации легкой цепочки киназы миозина (MLCK) приводит к расслаблению гладких мышц.

In vitro дротаверин угнетает 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 избирательные ингибиторы этого фермента могут быть полезными для лечения болезней, которые сопровождаются гиперподвижностью, а также различных заболеваний, во время которых возникают спазмы желудочно-кишечного тракта.

В клетках гладких мышц миокарда и сосудов цАМФ гидролизуется преимущественно изоферментом ФДЭ III, поэтому дротаверин является эффективным спазмолитическим средством, которое не обладает значительными побочными эффектами 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.

Действие дротаверина 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.

Фармакокинетика.

Дротаверин быстро и полностью абсорбируется после перорального применения. Он высокой степенью (95–98 %) связывается с альбуминами плазмы, 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 неизмененном виде.

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

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

Клинические характеристики.

Показания.

С лечебной целью при:

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

Как вспомогательное 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, сопровождающегося метеоризмом;
- головной боли напряжения;
- гинекологических заболеваниях (дисменорея).

Противопоказания.

Повышенная чувствительность к дротаверину или к любому 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, поскольку антипаркинсонический эффект последней уменьшается, а ригидность и тремор усиливаются.

Особенности применения.

Применять с осторожностью при артериальной гипотензии.

Препарат Дротаверин содержит лактозу. Не применять для лечения пациентов, страдающих редкими наследственными заболеваниями, такими как непереносимость галактозы, дефицит лактазы Лаппа или синдром мальабсорбции глюкозы-галактозы.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Беременность. Из-за недостаточности клинических данных назначать препарат беременным женщинам можно только при условии, что преимущества применения превышают риски. Активное вещество проникает через плаценту. Препарат нельзя применять во время родов из-за повышенного риска кровотечения в послеродовой период.

Кормление грудью. Поскольку дротаверин экскретируется в грудное молоко, в период кормления грудью применение препарата не рекомендуется.

Фертильность. Данных относительно влияния на фертильность человека нет.

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

Если после применения препарата наблюдается головокружение, следует избегать управления автомобилем и выполнения работ, требующих повышенного внимания.

Способ применения и дозы.

Взрослые: обычная средняя доза составляет 120–240 мг в сутки в 2–3 приема.

Дети: применение дротаверина детям в клинических исследованиях не изучали; если же применение дротаверина необходимо, то:

детям 6–12 лет максимальная суточная доза составляет 80 мг (распределенная на 2 приема);

детям старше 12 лет максимальная суточная доза составляет 160 мг (распределенная на 2–4 приема).

Данных о применении препарата детям до 6 лет нет.

Дети. Детям до 6 лет применение препарата противопоказано.

Применение дротаверина детям не оценивали 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 вызов рвоты и/или промывание желудка.

Побочные реакции.

Побочные реакции, которые наблюдали во время клинических исследований и, возможно, были вызваны дротаверином, распределены по системе органов и частоте возникновения: очень часто ($>1/10$), часто ($>1/100$, $<1/10$), нечасто ($>1/1000$, $<1/100$), редко ($>1/10000$, $<1/1000$), очень редко ($<1/10000$), частота возникновения неизвестна: не может быть рассчитана по имеющимся данным.

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. Редко: тошнота, запор, рвота.

Срок годности. 3 года.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения.

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка.

По 10 таблеток в блистере, по 1 или 2 блистера в пачке из картона.

Категория отпуска.

Без рецепта.

Производитель.

ПАО «Химфармзавод «Красная звезда».

Местонахождение производителя и адрес места осуществления его деятельности.

61010, Украина, г. Харьков, ул. Гордиенковская, 1.