

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
ДРОТАВЕРИН ВЕЛФАРМ

Регистрационный номер: ЛП-004748

Торговое наименование препарата: ДРОТАВЕРИН ВЕЛФАРМ

Международное непатентованное наименование: дротаверин

Лекарственная форма: таблетки

Состав на одну таблетку:

Действующее вещество: дротаверина гидрохлорид – 40,0 мг.

Вспомогательные вещества: повидон (поливинилпирролидон низкомолекулярный медицинский 12600 ± 2700 , пласдон К-17), лактозы моногидрат (сахар молочный), кальция стеарат, крахмал картофельный, тальк.

Описание

Круглые плоскоцилиндрические таблетки от светло-желтого с зеленоватым оттенком цвета до желтого с зеленоватым оттенком цвета с фаской. Допускается наличие «мраморности».

Фармакотерапевтическая группа: спазмолитическое средство.

Код АТХ: A03AD02

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Дротаверин – миотропный спазмолитик. Производное изохинолина, по химической структуре и фармакологическим свойствам близкое папаверину, но обладающее более сильным и продолжительным действием.

Дротаверин обладает мощным спазмолитическим действием на гладкую мускулатуру за счет ингибирования фермента фосфодиэстеразы 4 (ФДЭ-4). Фермент ФДЭ-4 необходим для гидролиза цАМФ до АМФ. Ингибирование фермента ФДЭ-4 приводит к повышению концентрации цАМФ, которое запускает следующую каскадную реакцию: высокие концентрации цАМФ активируют цАМФ-зависимое фосфорилирование киназы легких цепей миозина (КЛЦМ или MLCK). Фосфорилирование КЛЦМ приводит к понижению ее аффинности к Ca^{2+} – кальмодулиновому комплексу, в результате чего инактивированная форма КЛЦМ поддерживает мышечное расслабление.

Кроме этого, цАМФ влияет на цитозольную концентрацию иона Ca^{2+} благодаря стимулированию транспорта Ca^{2+} в экстрацеллюлярное пространство и саркоплазматический ретикулум. Этот эффект дротаверина по понижению цитозольной

концентрации иона Ca^{2+} через цАМФ объясняет его антагонистический эффект по отношению к Ca^{2+} .

In vitro дротаверин ингибирует изофермент ФДЭ-4 без ингибирования изоферментов ФДЭ-3 и ФДЭ-5. Поэтому эффективность дротаверина зависит от концентраций ФДЭ-4 в тканях, содержание которой в разных тканях различается. ФДЭ-4 наиболее важна для подавления сократительной активности гладкой мускулатуры, в связи с чем селективное ингибирование ФДЭ-4 может быть полезным для лечения гиперкинетических дискинезий и различных заболеваний, сопровождающихся спастическим состоянием желудочно-кишечного тракта (ЖКТ).

Гидролиз цАМФ в миокарде и гладкой мускулатуре сосудов происходит, главным образом, с помощью изофермента ФДЭ-3, чем объясняется тот факт, что при высокой спазмолитической активности у дротаверина отсутствуют серьезные побочные эффекты со стороны сердца и сосудов и выраженные эффекты в отношении сердечно-сосудистой системы.

Дротаверин эффективно устраняет спазмы гладкой мускулатуры нервной и мышечной этиологии. Независимо от типа вегетативной иннервации дротаверин расслабляет гладкую мускулатуру ЖКТ, желчевыводящих путей, мочеполовой системы, сосудов.

Вследствие сосудорасширяющего действия дротаверин улучшает кровоснабжение тканей. Не влияет на вегетативную нервную систему, не проникает в центральную нервную систему (ЦНС). Наличие непосредственного влияния на гладкую мускулатуру позволяет использовать дротаверин в качестве спазмолитика в случаях, когда противопоказаны лекарственные средства из группы м-холиноблокаторов (закрытоугольная глаукома, гипертрофия предстательной железы).

Фармакокинетика

По сравнению с папаверином дротаверин при приеме внутрь быстрее и более полно абсорбируется из ЖКТ. Биодоступность составляет около 100 %. Период полуабсорбции равен 12 мин.

Однако после метаболизма при «первом прохождении через печень» в системный кровоток поступает 65 % принятой дозы. Максимальная плазменная концентрация (C_{max}) достигается в течение 45-60 минут.

In vitro дротаверин имеет высокую связь с белками плазмы (95-97 %), особенно с альбумином, γ - и β -глобулинами.

Дротаверин равномерно распределяется по тканям, проникает в гладкомышечные клетки. Не проникает через гематоэнцефалический барьер. Дротаверин и/или его метаболиты могут незначительно проникать через плацентарный барьер.

Дротаверин почти полностью метаболизируется в печени путем О-дезэтилирования. Его метаболиты быстро конъюгируют с глюкуроновой кислотой. Главным метаболитом является 4'-дезэтилдротаверин, кроме которого были идентифицированы 6-дезэтилдротаверин и 4'-дезэтилдротавералдин.

Период полувыведения ($T_{1/2}$) дротаверина составляет 8-10 часов.

В течение 72 часов дротаверин практически полностью выводится из организма, более 50 % препарата выводится почками (в основном, в виде метаболитов) и около 30 % через ЖКТ (экскреция в желчь). Неизмененный дротаверин в моче не обнаруживается.

Показания к применению

- спазмы гладкой мускулатуры при заболеваниях желчевыводящих путей: холецистолитиаз, холангиолитиаз, холецистит, перихолецистит, холангит, воспаление сосочка двенадцатиперстной кишки (папиллит);
- спазмы гладкой мускулатуры при заболеваниях мочевыводящих путей: нефролитиаз, уретролитиаз, пиелит, цистит, спазмы мочевого пузыря.

В качестве вспомогательной терапии:

- при спазмах гладкой мускулатуры ЖКТ: язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, гастрит, спазмы кардии и привратника, энтерит, колит, спастический колит, сопровождающиеся запором и синдромом раздраженного кишечника с метеоризмом;
- при тензорных головных болях (головных болях напряжения);
- при альгодисменорее.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к дротаверину и/или вспомогательным веществам, входящим в состав препарата;
- тяжелая печеночная или почечная недостаточность;
- тяжелая сердечная недостаточность (синдром низкого сердечного выброса);
- период грудного вскармливания;
- детский возраст до 6 лет;
- наследственная непереносимость лактозы, дефицит лактазы, галактоземия или синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции (из-за присутствия в составе препарата лактозы моногидрата).

С осторожностью

- при артериальной гипотензии;
- у детей (недостаточно клинического опыта применения);
- у беременных женщин (см. раздел «Применение при беременности и в период грудного вскармливания»);

– одновременное применение с леводопой (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Дротаверин не обладает тератогенным и эмбриотоксическим действием, не оказывает неблагоприятного воздействия на течение беременности. Несмотря на это, при применении препарата у беременных женщин следует соблюдать осторожность и назначать препарат только после оценки соотношения предполагаемой пользы для матери и возможного риска для плода.

В связи с отсутствием клинических данных препарат не рекомендуется назначать в период грудного вскармливания.

Способ применения и дозы

Внутрь.

Взрослые

По 1-2 таблетки (40-80 мг) 2-3 раза в сутки. Максимальная суточная доза – 6 таблеток (240 мг).

Дети

Клинические исследования по применению дротаверина у детей не проводились.

Для детей в возрасте 12 лет и старше: по 1 таблетке (40 мг) 1-4 раза в сутки или по 2 таблетки (80 мг) 1-2 раза в сутки. Максимальная суточная доза – 4 таблетки (160 мг).

Для детей в возрасте от 6 до 12 лет: по 1 таблетке (40 мг) 1-2 раза в сутки. Максимальная суточная доза – 2 таблетки (80 мг).

Рекомендуемая продолжительность лечения без консультации врача – 1-2 дня. В случаях, когда дротаверин применяется в качестве вспомогательной терапии, продолжительность лечения без консультации врача может быть больше (2-3 дня). Если болевой синдром сохраняется, пациенту следует обратиться к врачу.

Если пациент может самостоятельно диагностировать симптомы своего заболевания, так как они являются для него хорошо известными, то эффективность лечения, а именно исчезновение болей, также легко поддается оценке пациентом. Если в течение нескольких часов наблюдается умеренное уменьшение боли или отсутствие уменьшения боли, или если боль существенно не уменьшается после приема максимальной суточной дозы, рекомендуется обратиться к врачу.

Побочное действие

Частота проявления неблагоприятных побочных реакций приведена в соответствии с классификацией Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): очень часто – более 1/10, часто – более 1/100 и менее 1/10, нечасто – более 1/1000 и менее 1/100, редко – более 1/10000

и менее 1/1000, очень редко – менее 1/10000, включая отдельные сообщения, частота неизвестна (определить частоту возникновения по имеющимся данным невозможно).

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

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко – ощущение сердцебиения, снижение артериального давления.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: редко – тошнота, запор.

Со стороны иммунной системы: редко – ангионевротический отек, крапивница, сыпь, зуд; очень редко – анафилактический шок (см. раздел «Противопоказания»).

Передозировка

Симптомами передозировки дротаверина могут быть нарушения сердечного ритма и проводимости (включая полную блокаду ножек пучка Гиса) и остановка сердца, вплоть до летального исхода.

Лечение: промывание желудка, симптоматическая терапия.

Специфического антидота не существует.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

С леводопой: при одновременном применении дротаверин может ослабить противопаркинсонический эффект леводопы, то есть усилить ригидность и тремор.

С папаверином, бендазолом и другими спазмолитиками (в том числе, с м-холиноблокаторами): усиление спазмолитического действия.

С морфином: уменьшение спазмогенной активности морфина.

С фенobarбиталом: усиление спазмолитического действия дротаверина.

Особые указания

Применение препарата при артериальной гипотензии требует повышенной осторожности.

В каждой таблетке содержится 66,45 мг лактозы моногидрата, это может вызвать у пациентов с непереносимостью лактозы нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта. Данная форма препарата неприемлема для пациентов с дефицитом лактазы, галактоземией или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции (см. раздел «Противопоказания»).

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

При приеме внутрь в терапевтических дозах дротаверин не оказывает влияния на способность управлять транспортными средствами и выполнять работы, требующие повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При проявлении каких-либо побочных действий вопрос о вождении транспорта или занятии другими потенциально опасными видами деятельности требует индивидуального рассмотрения.

В случае появления головокружения следует избегать занятий потенциально опасными видами деятельности, такими как управление транспортными средствами и работы с механизмами.

Форма выпуска

Таблетки 40 мг.

6, 10, 12, 14, 20, 24, 25, 30, 50 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

20, 30, 50, 60, 100 таблеток в банку полимерную из полипропилена или полиэтилена низкого давления.

Каждую банку, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10 контурных ячейковых упаковок с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

200 контурных ячейковых упаковок с равным количеством инструкций по применению помещают в тару из гофрированного картона (для стационаров).

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают без рецепта.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение

Общество с ограниченной ответственностью «Велфарм» (ООО «Велфарм»), Россия
125362, г. Москва, ул. Водников, д. 2, офис 31

Производитель/Организация, принимающая претензии

Общество с ограниченной ответственностью «Велфарм» (ООО «Велфарм»), Россия
Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 11

Тел./факс: (3522) 48-60-00

e-mail: fsk@velpharm.ru

Сообщить о нежелательных реакциях можно по телефону (3522) 55-51-80 или на сайте: www.brway.ru, в разделе «VELPHARM» - «Фармаконадзор».