

## ИНСТРУКЦИЯ по применению лекарственного препарата для медицинского применения ДРОТАВЕРИН

**Регистрационный номер:** ЛП-002834

**Торговое название:** Дротаверин

**Международное непатентованное название:** дротаверин

**Лекарственная форма:** таблетки

**Состав на 1 таблетку:**

<b>Активное вещество:</b> дротаверина гидрохлорид	40,00 мг	80,00 мг
<b>Вспомогательные вещества:</b> лактозы моногидрат (сахар молочный)	16,60 мг	33,20 мг
целлюлоза микрокристаллическая	20,00 мг	40,00 мг
крахмал кукурузный	10,00 мг	20,00 мг
кроскармеллоза натрия	4,00 мг	8,00 мг
повидон-К25	3,50 мг	7,00 мг
магния стеарат	0,90 мг	1,80 мг

**Описание:** круглые плоскоцилиндрические таблетки от светло - желтого с зеленоватым оттенком до желтого с зеленоватым оттенком цвета с риской с одной стороны и с фаской. Допускается наличие мраморности.

**Фармакотерапевтическая группа:** спазмолитическое средство

**Код АТХ:** А03АD02

### ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

#### Фармакодинамика

Дротаверин - 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 (ФДЭ). Фермент фосфодиэстераза необходим для гидролиза цАМФ (циклического аденозин-3', 5'-монофосфата) до АМФ (аденозин-5'-монофосфата). Ингибирование фермента фосфодиэстеразы приводит к повышению концентрации цАМФ, которое запускает следующую каскадную реакцию: высокие концентрации цАМФ активируют цАМФ зависимое фосфорилирование киназы легких цепей миозина (КЛЦМ). Фосфорилирование КЛЦМ приводит к понижению ее аффинности к ионам кальция - калмодулиновому комплексу, в результате чего инактивированная форма КЛЦМ поддерживает мышечное расслабление. цАМФ, кроме этого, влияет на цитозольную концентрацию иона кальция благодаря стимулированию транспорта иона кальция в экстрацеллюлярное пространство и саркоплазматический ретикулум. Этот эффект дротаверина по понижению цитозольной концентрации иона кальция через цАМФ объясняет его антагонистический эффект по отношению к иону кальция.

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. 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 эффективен при спазмах гладкой мускулатуры как нейрогенного, так и мышечного происхождения. Независимо от типа вегетативной иннервации дротаверин расслабляет гладкую мускулатуру желудочно-кишечного тракта, желчевыводящих путей, мочеполовой системы, сосудов.

Вследствие своего сосудорасширяющего действия дротаверин улучшает кровоснабжение тканей.

#### Фармакокинетика

##### Абсорбция

После приема внутрь дротаверин быстро и полностью абсорбируется. Биодоступность -100%. После пресистемного метаболизма в системный кровоток поступает 65 % принятой дозы дротаверина. Максимальная плазменная концентрация ( $C_{max}$ ) достигается через 45-60 минут.

##### Распределение

In vitro дротаверин имеет высокую связь с белками плазмы (95-97%), особенно с альбумином,  $\gamma$  и  $\beta$ -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.

##### Метаболизм

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

##### Выведение

Период полувыведения дротаверина составляет 8-10 часов.

За 72 часа дротаверин практически полностью выводится из организма, более 50 % препарата выводится почками (в основном, в виде метаболитов) и около 30 % через желудочно-кишечный тракт (экскреция в желчь). Неизмененный дротаверин в моче не обнаруживается.

### ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

- Спазм гладкой мускулатуры при заболеваниях желчевыводящих путей: холецистолитиаз, холангиолитиаз, холецистит, перихолецистит, холангит, воспаление сосочка двенадцатиперстной кишки;

- Спазм гладкой мускулатуры при заболеваниях мочевыводящих путей: нефролитиаз, уретролитиаз, пиелит, цистит, спазм мочевого пузыря;

В качестве вспомогательной терапии:

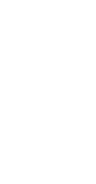
- при спазмах гладкой мускулатуры желудочно-кишечного тракта: язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, гастрит, спазм кардии и привратника, энтерит, колит, спастический колит с запором и синдром раздраженного кишечника с метеоризмом после исключения заболеваний, проявляющихся синдромом «острого живота» (аппендицит, перитонит, перфорация язвы, острый панкреатит и др.);

- при головных болях напряжения;

- при дисменорее.

### 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, недостаточность лактазы или синдром мальабсорбции глюкозы/галактозы;

### С ОСТОРОЖНОСТЬЮ

Артериальная гипотензия, беременность, одновременный прием с леводопой.

### ПРИМЕНЕНИЕ ВО ВРЕМЯ БЕРЕМЕННОСТИ И В ПЕРИОД ГРУДНОГО ВСКАРМЛИВАНИЯ

По данным экспериментов на животных и ретроспективных исследований клинических данных дротаверин не обладает тератогенным и эмбриотоксическим действием. Однако применение препарата во время беременности рекомендуется только после тщательного взвешивания соотношения потенциальной пользы для матери и возможного риска для плода. Не рекомендуется применять препарат в период грудного вскармливания.

### СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Внутрь.

Взрослые: по 40 - 80 мг (1-2 таблетки) 2-3 раза в сутки. Максимальная разовая доза - 80 мг, максимальная суточная доза - 240 мг.

Дети в возрасте от 6 до 12 лет максимальная суточная доза составляет 80 мг, разделенная на 2 приема.

Дети старше 12 лет - максимальная суточная доза составляет 160 мг, разделенная на 2-4 приема.

Рекомендуемая продолжительность лечения без консультации врача 1 -2 дня.

### ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

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

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

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, запор.

Со стороны иммунной системы: аллергические реакции (ангионевротический отек, крапивница, сыпь, зуд).

### ПЕРЕДОЗИРОВКА

Симптомами передозировки могут быть аритмия сердца и нарушения проводимости (в т.ч. полная блокада ножек пучка Гиса), остановка сердца, вплоть до летального исхода.

Лечение: промывание желудка, симптоматическая терапия.

### ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

С леводопой

При одновременном применении дротаверин может ослабить противопаркинсонический эффект леводопы, то есть, усилить ригидность и тремор.

С другими спазмолитическими средствами, включая м-холиноблокаторы

Взаимное усиление спазмолитического действия.

С морфином

Снижает спазмогенную активность морфина.

С фенобарбиталом

Фенобарбитал усиливает спазмолитическое действие дротаверина.

С трициклическими антидепрессантами, хинидином, прокаиनाмидом

Усиливает выраженность снижения артериального давления, вызванного этими препаратами.

Препараты, значительно связывающиеся с белками плазмы (более 80%)

Дротаверин значительно связывается с белками плазмы, преимущественно альбумином,  $\gamma$  и  $\beta$ -глобулинами (см. раздел «Фармакокинетика»).

Отсутствуют данные по взаимодействию дротаверина с препаратами, значительно связывающимися с белками плазмы, однако существует гипотетическая возможность их взаимодействия с дротаверином на уровне связи с белком (вытеснение одного из препаратов другим из связи с белком и увеличение концентрации свободной фракции в крови препарата с менее сильной связью с белком), что гипотетически может повысить риск возникновения фармакодинамических и/или токсических побочных эффектов этого препарата.

### ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Применение препарата при артериальной гипотензии требует повышенной осторожности. Данная форма препарата противопоказана для пациентов с непереносимостью лактозы, дефицитом лактазы, синдромом мальабсорбции глюкозы/галактозы.

Применение препарата у детей в возрасте от 6 лет строго по показаниям и только по назначению врача.

**Влияние на способность управлять автомобилем и другими механизмами**

При приеме внутрь в терапевтических дозах дротаверин не оказывает влияния на способность управлять транспортными средствами и выполнять работы, требующие повышенного внимания. При проявлении каких-либо побочных действий вопрос о вождении транспорта или занятии другими потенциально опасными видами деятельности требует индивидуального рассмотрения. В случае появления головокружения после приема препарата, следует избегать занятий потенциально опасными видами деятельности, такими, как управление, транспортными средствами и работа с механизмами.

### ФОРМА ВЫПУСКА

Таблетки 40,0 мг, 80,0 мг.

По 10, 14, 25, 30, 50 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной. По 10, 20, 30, 40, 50 или 100 таблеток в банки из полиэтилентерефталата или в банки полимерные для лекарственных средств.

Одну банку или 1, 2, 3, 4, 5 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в картонную упаковку (пачку).

### Условия хранения

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

Хранить в недоступном для детей месте.

### Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

### Условия отпуска

Отпускают без рецепта.

**Юридический адрес: 445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Песочная, д. 11  
Адрес места производства (адрес для переписки, в том числе для приема претензий):  
445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6  
Тел./факс: (84862) 3-41-09, 7-18-51  
E-mail: ozon\_pharm@samtel.ru  
www.ozonpharm.ru**

**ПРОИЗВОДИТЕЛЬ ООО «Озон»**