

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ДОВЕРИН®

Регистрационный номер:

Торговое наименование: ДОВЕРИН®

Международное непатентованное наименование: дротаверин

Лекарственная форма: таблетки

Состав:

Одна таблетка содержит:

действующее вещество: дротаверина гидрохлорид в пересчете на 100 % вещество - 40 мг.

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 63 мг, крахмал картофельный - 32 мг, магния стеарат - 1 мг, тальк - 3 мг, метилцеллюлоза - 1 мг.

Описание: Круглые, плоскоцилиндрические таблетки, желтого с зеленоватым оттенком цвета, с фаской.

Фармакотерапевтическая группа: спазмолитическое средство.

Код АТХ: A03AD02

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Дротаверин представляет собой производное изохинолина, которое проявляет мощное спазмолитическое действие на гладкую мускулатуру за счет ингибирования фермента фосфодиэстеразы IV типа (ФДЭ IV). Ингибирование фермента ФДЭ IV приводит к повышению концентрации цАМФ, инаktivации киназы легкой цепи миозина, что в дальнейшем вызывает расслабление гладкой мускулатуры.

Снижающий концентрацию ионов Ca^{2+} эффект дротаверина через цАМФ объясняет антагонистический эффект дротаверина по отношению к ионам Ca^{2+} .

In vitro дротаверин ингибирует фермент ФДЭ IV без ингибирования ферментов ФДЭ III и ФДЭ V. Поэтому эффективность дротаверина зависит от концентраций ФДЭ IV в разных тканях. ФДЭ IV наиболее важна для подавления сократительной активности гладкой

мускулатуры, в связи с чем селективное ингибирование ФДЭ IV 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 фермента ФДЭ III, 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. Вследствие своего сосудорасширяющего действия дротаверин улучшает кровоснабжение тканей.

Таким образом, вышеописанные механизмы действия дротаверина устраняют спазм гладкой мускулатуры, что приводит к уменьшению боли.

Фармакокинетика

Абсорбция

По сравнению с папаверином дротаверин при приеме внутрь быстрее и более полно абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. После пресистемного метаболизма в системный кровоток поступает 65 % принятой дозы дротаверина. Максимальная концентрация ($C_{\max}$) дротаверина в плазме крови достигается через 45-60 минут.

Распределение

In vitro дротаверин имеет высокую связь с белками плазмы (95-98 %), особенно с альбумином, γ и β -глобулинами. Дротаверин равномерно распределяется в тканях, проникает в гладкомышечные клетки. Не проникает через гематоэнцефалический барьер. Дротаверин и/или его метаболиты могут незначительно проникать через плацентарный барьер.

Метаболизм

Дротаверин почти полностью метаболизируется в печени.

Выведение

Период полувыведения дротаверина составляет 8-10 часов. В течение 72 часов дротаверин практически полностью выводится из организма. Около 50 % дротаверина выводится почками и около 30 % - через желудочно-кишечный тракт. Дротаверин главным образом

экскретируется в виде метаболитов, неизменная форма дротаверина в моче не обнаруживается.

Показания к применению

Препарат показан к применению у взрослых и детей старше 6 лет при:

- спазмах гладкой мускулатуры при заболеваниях желчевыводящих путей: холецистолитиаз, холангиолитиаз, холецистит, перихолецистит, холангит, папиллит;
- спазмах гладкой мускулатуры мочевыводящих путей: нефролитиаз, уретролитиаз, пиелит, цистит, спазмы мочевого пузыря.

В качестве вспомогательной терапии применяется при:

- спазмах гладкой мускулатуры желудочно-кишечного тракта: язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, гастрит, спазмы кардии и привратника, энтерит, колит, спастический колит с запором, синдром раздраженного кишечника с метеоризмом;
- головных болях напряжения;
- дисменорее (менструальных болях).

Противопоказания

- Гиперчувствительность к дротаверину или к любому из вспомогательных веществ в составе препарата;
- тяжелая печеночная или почечная недостаточность;
- тяжелая сердечная недостаточность (синдром низкого сердечного выброса);
- детский возраст до 6 лет;
- период грудного вскармливания (отсутствие клинических данных);
- наследственная непереносимость галактозы, дефицит лактазы и синдром мальабсорбции глюкозы-галактозы (из-за присутствия в составе препарата лактозы моногидрата).

С осторожностью

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

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

В проведенных исследованиях не выявлено тератогенного или эмбриотоксического действия дротаверина, а также неблагоприятного воздействия на течение беременности. Однако, при необходимости применения препарата во время беременности, следует соблюдать осторожность, и назначать препарат только после оценки соотношения потенциальной пользы для матери и возможного риска для плода.

В связи с отсутствием исследований на животных и клинических данных, назначать дротаверин в период грудного вскармливания не рекомендуется.

Данные о влиянии препарата на фертильность отсутствуют.

Способ применения и дозы

Взрослые

По 1-2 таблетки на один прием 2-3 раза в день. Максимальная суточная доза – 6 таблеток (что соответствует 240 мг).

Дети

Клинические исследования по применению дротаверина у детей не проводились.

В случае назначения дротаверина детям:

- *от 6 до 12 лет*: по 1 таблетке на один прием 1-2 раза в день. Максимальная суточная доза - 2 таблетки (что соответствует 80 мг);
- *старше 12 лет*: по 1 таблетке на один прием 1-4 раза в день или по 2 таблетки на один прием 1-2 раза в день. Максимальная суточная доза - 4 таблетки (что соответствует 160 мг).

При приеме препарата без консультации с врачом рекомендованная продолжительность приема препарата обычно составляет 1-2 дня. В случаях, когда дротаверин применяется в качестве вспомогательной терапии, продолжительность лечения без консультации с врачом может быть больше (2-3 дня). Если болевой синдром сохраняется, пациенту следует обратиться к врачу.

Побочное действие

Ниже представлены неблагоприятные реакции, наблюдавшиеся в клинических исследованиях, разделенные по системам органов с указанием частоты их возникновения в соответствии со следующими градациями, рекомендованными Всемирной Организацией Здравоохранения: очень часто ($\geq 10\%$); часто ($\geq 1\%$, $< 10\%$); нечасто ($\geq 0,1\%$, $< 1\%$); редко

($\geq 0,01$ %, $< 0,1$ %); очень редко, включая отдельные сообщения ($< 0,01$ %); частота неизвестна (по имеющимся данным частоту определить нельзя).

Нарушения со стороны нервной системы:

редко: головная боль, головокружение, бессонница.

Нарушения со стороны сердца:

редко: учащенное сердцебиение.

Нарушения со стороны сосудов:

редко: гипотензия.

Желудочно-кишечные нарушения:

редко: тошнота, запор.

Нарушения со стороны иммунной системы:

редко: аллергические реакции (ангионевротический отек, крапивница, сыпь, зуд) (см. раздел «Противопоказания»).

Передозировка

Передозировка дроперазина ассоциировалась с нарушениями сердечного ритма и проводимости, включая полную блокаду ножек пучка Гиса и остановку сердца, которая может быть фатальной.

В случае передозировки пациенты должны находиться под медицинским наблюдением, и при необходимости, им должно проводиться симптоматическое и направленное на поддержание основных функций организма лечение, включая искусственное вызывание рвоты или промывание желудка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

С леводопой

Ингибиторы фосфодиэстеразы, подобные папаверину, снижают антипаркинсоническое действие леводопы. При назначении дроперазина одновременно с леводопой возможно усиление ригидности и тремора.

С другими спазмолитическими средствами, включая м-холиноблокаторы

Взаимное усиление спазмолитического действия.

Особые указания

Каждая таблетка лекарственного препарата ДОВЕРИН[®], 40 мг содержит 63 мг лактозы моногидрата. У пациентов с непереносимостью лактозы это может вызвать нарушения со

стороны желудочно-кишечного тракта. Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы лопарей или глюкозо-галактозной мальабсорбцией препарат принимать не следует (см. раздел «Противопоказания»).

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

При приеме внутрь в терапевтических дозах дротаверин не оказывает влияния на способность управлять автомобилем и выполнять работы, требующие повышенного внимания. При появлении каких-либо побочных действий, вопрос о вождении транспорта и работе с механизмами требует индивидуального рассмотрения.

В случае появления головокружения после приема препарата, следует избегать занятия потенциально опасными видами деятельности, такими, как управление автомобилем и работа с механизмами.

Форма выпуска

Таблетки, 40 мг.

По 6, 10 или 12 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 50 таблеток в банку из полиэтилена низкого давления, укупоренную крышкой из полиэтилена низкого давления. Свободное пространство в банках заполняют уплотнителем (амортизатором из полиэтилена высокого давления). На банки наклеивают этикетки.

Банку или 1, 2, 3, 4 или 5 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона для потребительской тары марки хромовый или хром-эрзац.

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, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают без рецепта.

Производитель

ООО «Авексима Сибирь»

652473, Россия, Кемеровская обл. - Кузбасс, г. Анжеро-Судженск, ул. Герцена, д. 7.

тел./факс: (38453) 5-23-51.

Владелец регистрационного удостоверения/ Организация, принимающая претензии потребителей

ОАО «Авексима»

125284, Россия, г. Москва, Ленинградский проспект, д. 31А, стр. 1.