

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению препарата

Но-шпа® форте

Регистрационный номер: П N015632/01 - 120712

Торговое название: Но-шпа® форте.

Международное непатентованное название: дротаверин.

Лекарственная форма: таблетки.

Состав

В 1 таблетке содержится:

действующее вещество: дротаверина гидрохлорид – 80 мг;

вспомогательные вещества: магния стеарат, тальк, повидон, крахмал кукурузный, лактозы моногидрат.

Описание

Продолговатые двояковыпуклые таблетки желтого с зеленоватым или оранжевым оттенком цвета, с гравировкой «NOSPA» на одной стороне и линией разлома на другой стороне.

Фармакотерапевтическая группа: спазмолитическое средство.

Код АТХ: A03AD02.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Дротаверин представляет собой 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 Ca^{2+} -калмодулиновому комплексу, в результате чего инактивированная форма КЛЦМ поддерживает мышечное расслабление. цАМФ, кроме этого, 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 IV без ингибирования изоферментов ФДЭ III и ФДЭ V. Поэтому эффективность дротаверина зависит от концентраций ФДЭ IV в тканях, содержание которой в разных тканях различается. 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 изофермента 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, сосудов.

Вследствие своего сосудорасширяющего действия дротаверин улучшает кровоснабжение тканей.

Фармакокинетика

По сравнению с папаверином дротаверин при приеме внутрь быстрее и более полно абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Абсорбция составляет 100%. Однако после метаболизма при «первом прохождении через печень» в системный кровоток поступает 65% принятой дозы. Максимальная плазменная концентрация (C_{max}) достигается через 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.

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

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

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

В качестве вспомогательной терапии:

при спазмах гладкой мускулатуры желудочно-кишечного тракта: язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, гастрит, спазмы кардии и привратника, энтерит, колит, спастический колит с запором и синдром 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.
- Выраженная печеночная или почечная недостаточность.
- Тяжелая сердечная недостаточность (снижение сердечного выброса).
- Период кормления грудью (см. раздел «Беременность и период лактации»).
- Детский возраст (клинических исследований у детей не проводилось).
- Наследственная непереносимость лактозы, недостаточность лактазы, галактоземия или синдром мальабсорбции глюкозы/галактозы (из-за присутствия в составе препарата лактозы) (см. «Особые указания»).

С осторожностью

- При артериальной гипотензии.
- У беременных женщин (см. раздел «Беременность и период лактации»).

Беременность и период лактации

По ограниченному количеству ретроспективных данных по применению препарата у человека и данным исследований у животных при приеме дротаверина внутрь не получено доказательства наличия у него тератогенного или эмбриотоксического действия, а также неблагоприятного воздействия на течение беременности. Несмотря на это, при применении препарата у беременных женщин следует соблюдать осторожность и назначать препарат только после тщательного взвешивания соотношения пользы и риска для матери и риска для ребенка.

Исследований по экскреции дротаверина в материнское молоко у животных не проводилось. В связи с отсутствием таких исследований у животных и клинических данных, назначать дротаверин в период лактации не рекомендуется.

Способ применения и дозы

Препарат принимается внутрь. Обычно средняя суточная доза составляет 120-240 мг (суточная доза делится на 2-3 приема).

Побочное действие

Указанные ниже побочные эффекты, которые в клинических исследованиях расценивались как, по крайней мере, возможно связанные с дротаверином, даются в соответствии со следующими градациями частоты их возникновения: очень часто (1/10), часто ($\geq 1/100$, 1/10); редко ($\geq 1/1000$, 1/100); иногда ($\geq 1/10000$, 1/1000); очень редко (включая отдельные сообщения) (1/10000); неизвестная частота (определить частоту возникновения по имеющимся данным невозможно) и сгруппированы по системам органов.

Со стороны нервной системы

- Иногда: головная боль, головокружение, бессонница.

Со стороны сердечно-сосудистой системы

- Иногда: учащенное сердцебиение, снижение артериального давления.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

- Иногда: тошнота, запоры.

Со стороны иммунной системы

- Иногда – аллергические реакции (ангионевротический отек, крапивница, сыпь, зуд) (см. раздел «Противопоказания»).

Передозировка

В случае передозировки пациенты должны находиться под медицинским наблюдением и, при необходимости, им должно проводиться симптоматическое и направленное на поддержание основных функций организма лечение.

Данные по передозировке препарата отсутствуют.

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 Но-шпа® форте содержится 104 мг лактозы. При приеме согласно рекомендованному режиму дозирования с каждой дозой может поступать до 156 мг лактозы (1,5 таблетки Но-шпа® форте), что может вызывать у больных, страдающих непереносимостью лактозы, нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта. Данная форма препарата неприемлема для больных, страдающих дефицитом лактазы, галактоземией или синдромом мальабсорбции глюкозы/галактозы.

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 следует избегать занятий потенциально-опасными видами деятельности, такими как управление транспортными средствами и работа с механизмами.

Форма выпуска

Таблетки 80 мг.

По 10 таблеток в блистере из алюминиевой фольги/алюминиевой фольги, ламинированной полимером.

По 10 таблеток в блистер из ПВХ / алюминиевой фольги.

По 2 блистера вместе с инструкцией по применению в картонную пачку.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

Для таблеток в блистерах из алюминиевой фольги/ алюминиевой фольги, ламинированной полимером: 5 лет.

Для таблеток в блистерах из ПВХ / алюминиевой фольги: 3 года.

Не применять препарат после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

Без рецепта.

Производитель

ХИНОИН Завод Фармацевтических и Химических Продуктов ЗАО

ул. Леваи, 5, 2112 Верешедьхаз, Венгрия.

Претензии потребителей направлять по адресу в России:

115035, Москва, ул. Садовническая улица, 82, стр. 2.

Телефон: (495)-721-14-00. Факс (495)- 721-14-11.