Но-шпа форте



Код АТХ:

- A03AD02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Дротаверин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

◊ ***Таблетки*** желтого цвета с зеленоватым или оранжевым оттенком, двояковыпуклые, продолговатые, с гравировкой "NOSPA" на одной стороне и линией разлома - на другой.

	1 таб.
дротаверина гидрохлорид	80 мг

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

10 шт. - блистеры из алюминиевой фольги/алюминиевой фольги, ламинированной полимером (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры из ПВХ/алюминиевой фольги (2) - пачки картонные.
24 шт. - блистеры из ПВХ/алюминиевой фольги (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Спазмолитическое средство, производное изохинолина, по химической структуре и фармакологическим свойствам близкое папаверину, но обладающее более сильным и продолжительным действием. Оказывает мощное спазмолитическое действие на гладкую мускулатуру за счет ингибирования фермента ФДЭ. Фермент ФДЭ необходим для гидролиза цАМФ до АМФ. Ингибирование ФДЭ 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 этого инактивированная форма КЛЦМ поддерживает мышечное расслабление. Кроме того, цАМФ влияет на цитозольную концентрацию иона Ca^{2+} благодаря стимулированию транспорта Ca^{2+} в экстрацеллюлярное пространство и саркоплазматический ретикулум. Этот понижающий концентрацию иона Ca^{2+} эффект дротаверина через цАМФ объясняет антагонистический эффект дротаверина по отношению к Ca^{2+}.

In vitro дротаверин ингибирует изофермент ФДЭ4 без ингибирования изоферментов ФДЭ3 и ФДЭ5. Поэтому эффективность дротаверина зависит от концентрации ФДЭ4 в тканях (содержание ФДЭ4 в разных тканях различается). ФДЭ4 наиболее важна для подавления сократительной активности гладкой мускулатуры, в связи с чем селективное ингибирование ФДЭ4 может быть полезным для лечения гиперкинетических дискинезий и различных заболеваний, сопровождающихся спастическим состоянием ЖКТ.

Гидролиз цАМФ в миокарде и гладкой мускулатуре сосудов происходит, главным образом, с помощью изофермента ФДЭ3, 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 ЖКТ, желчевыводящих путей, мочеполовой системы.

Вследствие своего сосудорасширяющего действия дротаверин улучшает кровоснабжение тканей.

Фармакокинетика

Всасывание

По сравнению с папаверином дротаверин при приеме внутрь быстрее и более полно абсорбируется из ЖКТ. Абсорбция составляет 100%. После метаболизма при "первом прохождении" через печень в системный кровоток поступает 65% принятой дозы дротаверина. C_{max} в плазме крови достигается через 45-60 мин.

Распределение

In vitro - дротаверин в высокой степени связывается с белками плазмы (95-98%), особенно с альбумином, β-и γ-глобулинами.

Дротаверин равномерно распределяется в тканях, проникает в гладкомышечные клетки.

Не проникает через ГЭБ. Дротаверин и/или его метаболиты способны незначительно проникать через плацентарный барьер.

Метаболизм

У человека 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.

Выведение

$T_{1/2}$ составляет 8-10 ч.

В течение 72 часов дротаверин практически полностью выводится из организма. Более 50% дротаверина выводится почками и около 30% - через кишечник (экскреция в желчь). Дротаверин главным образом экскретируется в виде метаболитов, неизмененный дротаверин в моче не обнаруживается.

Показания к применению:

— спазмы гладкой мускулатуры при заболеваниях желчевыводящих путей: холецистолитиаз, холангиолитиаз, холецистит, перихолецистит, холангит, папиллит;

— спазмы гладкой мускулатуры мочевыделительной системы: 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 с запором и синдром раздраженного кишечника с метеоризмом;

— головные боли напряжения;

— альгодисменорея.

Относится к болезням:

- Альгодисменорея
- Гастрит
- Запор
- Кардит
- Колит
- Метеоризм
- Нефрит
- Нефролитиаз
- Папиллит
- Перихолецистит
- Пиелит
- Синдром раздраженного кишечника
- Спазмы
- Спазмы кардии и привратника
- Уретрит
- Уретролитиаз
- Холангиолитиаз
- Холангит
- Холера
- Холецистит
- Холецистолитиаз
- Цистит
- Энтерит
- Язвенная болезнь
- Язвенная болезнь желудка

Противопоказания:

— выраженная почечная недостаточность;

— выраженная печеночная недостаточность;

— тяжелая сердечная недостаточность (снижение сердечного выброса);

— детский возраст (клинических исследований у детей не проводилось);

— период грудного вскармливания;

— наследственная непереносимость лактозы, недостаточность лактазы, галактоземия, синдром мальабсорбции глюкозы-галактозы (из-за присутствия в составе таблеток лактозы);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* применяют препарат при артериальной гипотензии, при беременности.

Способ применения и дозы:

Препарат назначают внутрь в суточной дозе 120-240 мг в 2-3 приема.

Побочное действие:

Указанные ниже побочные эффекты, которые в клинических исследованиях расценивались как, по крайней мере, возможно связанные с дротаверином, приведены в соответствии со следующей частотой возникновения: очень часто (≥ 1/10), часто (≥1/100, <1/10); редко (≥ 1/1000, < 1/100); иногда (≥ 1/10 000, < 1/1000); очень редко, включая отдельные сообщения (< 1/10 000); частота неизвестна (по имеющимся данным частоту возникновения определить невозможно).

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

Со стороны сердечно-сосудистой системы: иногда – учащенное сердцебиение, снижение АД.

Со стороны пищеварительной системы: иногда – тошнота, запор.

Аллергические реакции: редко - зуд, сыпь, крапивница, ангионевротический отек.

Передозировка:

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

Лечение: в случае передозировки пациенты должны находиться под медицинским наблюдением. При необходимости следует проводить симптоматическое и направленное на поддержание основных функций организма лечение.

Применение при беременности и кормлении грудью:

По ограниченному числу ретроспективных данных по применению препарата у человека и данным исследований у животных, применение дротаверина при беременности не оказывало ни тератогенного, ни эмбриотоксического действия, а также неблагоприятного воздействия на течение беременности.

При беременности препарат следует применять с осторожностью и только в тех случаях, когда потенциальная польза терапии для матери превышает возможный риск для плода.

Исследований по изучению выделения дротаверина с грудным молоком у животных не проводилось, клинические данные также отсутствуют, поэтому препарат противопоказан в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении Но-шпа форте возможно уменьшение противопаркинсонического эффекта леводопы, т.е. усиление ригидности и тремора.

При одновременном применении Но-шпа форте усиливает спазмолитическое действие папаверина, бендазола и других спазмолитиков (в т.ч. м-холиноблокаторов).

При одновременном применении Но-шпа форте уменьшает спазмогенную активность морфина.

При одновременном применении фенобарбитал усиливает выраженность спазмолитического действия дротаверина.

Особые указания и меры предосторожности:

При применении препарата у пациентов с артериальной гипотензией требуется повышенная осторожность.

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 пациентов, страдающих непереносимостью лактозы, нарушения со стороны ЖКТ. Данная форма препарата неприемлема для пациентов с дефицитом лактазы, галактоземией или синдромом мальабсорбции глюкозы/галактозы.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

При приеме внутрь в терапевтических дозах дротаверин не оказывает влияние на способность к вождению автотранспорта и выполнять работу, требующую повышенной концентрации внимания.

При проявлении каких-либо побочных реакций вопрос о вождении транспорта и работе с механизмами требует индивидуального рассмотрения. В случае появления головокружения после приема препарата пациент должен избегать занятий потенциально опасными видами деятельности, такими как управление транспортными средствами и работа с механизмами.

При нарушениях функции почек

Противопоказан к применению при почечной недостаточности тяжелой степени.

При нарушениях функции печени

Противопоказан к применению при тяжелой печеночной недостаточности.

Применение в детском возрасте

Клинических исследований у детей не проводилось.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C. 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.

Условия отпуска в аптеке:

Без рецепта.

Источник: http://drugs.thead.ru/No-Shpa_Forte