Но-шпа



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 6, 10 шт. - блистеры ПВХ/Алюминий (1, 2, 3, 4, 5) - пачки картонные.

Таблетки 60, 100 шт. - флаконы полипропиленовые (1) с пробкой полиэтиленовой, снабженной штучным дозатором - пачки картонные.

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 2 мл - ампулы темного стекла (5) - упаковки ячейковые контурные пластиковые (1, 5) - пачки картонные.

Состав:

Одна таблетка содержит

Активное вещество: дротаверина гидрохлорид 40 мг

Вспомогательные вещества: магния стеарат — 3 мг; тальк — 4 мг; повидон — 6 мг; крахмал кукурузный — 35 мг; лактозы моногидрат — 52 мг.

Одна ампула раствора для внутривенного и внутримышечного введения содержит

Активное вещество: дротаверина гидрохлорид 40 мг

Вспомогательные вещества: натрия дисульфит (натрия метабисульфит) — 2 мг, этанол 96% — 132 мг, вода для инъекций — до 2 мл.

Описание:

Раствор для инъекций: прозрачная жидкость зеленовато-желтого цвета.

Таблетки: круглые двояковыпуклые, желтого цвета, с зеленоватым или оранжевым оттенком, на одной стороне гравировка «spa».

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Миотропный спазмолитик, производное изохинолина. 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.
Фармакокинетика

Абсорбция. После приема внутрь дротаверин быстро и полностью абсорбируется. После пресистемного метаболизма в системный кровоток поступает 65% принятой дозы дротаверина. C_{max} в плазме достигается через 45–60 мин.

Распределение. In vitro дротаверин имеет высокую связь с белками плазмы (95–98%), особенно с альбумином, γ и β-глобулинами.

Дротаверин равномерно распределяется по тканям, проникает в гладкомышечные клетки. Не проникает через ГЭБ. Дротаверин и/или его метаболиты могут 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. У человека для оценки показателей фармакокинетики дротаверина использовалась двухкамерная математическая модель. Конечный $T_{1/2}$ плазменной радиоактивности составлял 16 ч.

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

Показания к применению:

Препарат рекомендован к применению при следующих состояниях:

— 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 после исключения заболеваний, проявляющихся синдромом "острый живот" (аппендицит, перитонит, перфорация язвы, острый панкреатит);

— головные боли напряжения (для приема внутрь);

— альгодисменорея.

При применении в качестве вспомогательного средства препарат вводят парентерально при невозможности применения таблеток.

Относится к болезням:

- Альгодисменорея
- Гастрит
- Головная боль
- Колит
- Мигрень
- Нефролитиаз
- Папиллит
- Перихолецистит
- Пиелит
- Спазм мочевого пузыря
- Спазмы
- Спазмы кардии и привратника
- Уретролитиаз
- Холангиолитиаз
- Холангит
- Холецистит
- Холецистолитиаз
- Цистит
- Энтерит
- Язвенная болезнь желудка

Противопоказания:

Препарат не должен применяться при наличии какого-либо из состояний, перечисленных ниже:

— почечная недостаточность тяжелой степени;

— тяжелая печеночная недостаточность;

— тяжелая сердечная недостаточность (синдром низкого сердечного выброса);

— детский возраст до 6 лет (для таблеток);

— детский возраст (для парентерального введения, т.к. клинических исследований у детей не проводилось);

— период грудного вскармливания (клинические данные отсутствуют);

— редкая наследственная непереносимость галактозы, дефицит лактазы, синдром мальабсорбции глюкозы-галактозы (для таблеток, из-за присутствия в их составе лактозы);

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— повышенная чувствительность к натрия дисульфиту (для раствора для в/в и в/м введения).

С *осторожностью:* применяют препарат при артериальной гипотензии (из-за опасности коллапса), при беременности; у детей (для таблеток).

Способ применения и дозы:

Взрослым при приеме внутрь рекомендуемая суточная доза составляет 120-240 мг (в 2-3 приема). Максимальная разовая доза составляет 80 мг. Максимальная суточная доза - 240 мг.

Средняя суточная доза для в/м введения взрослым составляет 40-240 мг (разделенная на 1-3 введения/сут). При

острых коликах (почечные или желчные) препарат вводят в/в медленно в дозе 40-80 мг (продолжительность введения приблизительно 30 сек).

Клинических исследований с применением дротаверина с участием детей не проводилось.

В случае назначения препарата Но-шпа максимальная суточная доза при приеме внутрь для детей в возрасте от 6 до 12 лет составляет 80 мг в 2 приема, в возрасте старше 12 лет - 160 мг в 2-4 приема.

Продолжительность лечения без консультации с врачом:

При приеме препарата без консультации с врачом рекомендованная продолжительность приема препарата обычно составляет 1-2 дня. Если в течение этого периода болевой синдром не уменьшается, пациенту следует обратиться к врачу, чтобы уточнить диагноз и при необходимости изменить терапию. В случаях, когда дротаверин используется в качестве вспомогательной терапии, продолжительность лечения без консультации с врачом может быть больше (2-3 дня).

Метод оценки эффективности:

Если пациент может легко самостоятельно диагностировать симптомы своего заболевания, т.к. они являются для него хорошо известными, то эффективность лечения, а именно исчезновение болей, также легко поддается оценке пациентом. В случае если в течение нескольких часов после приема препарата в максимальной разовой дозе 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:

Определение частоты побочных реакций: очень часто (≥10%), часто (≥1%, <10); нечасто (≥ 0.1%, < 1%); редко (≥ 0.01%, < 0.1%), очень редко, включая отдельные сообщения (< 0.01%), частота неизвестная (по имеющимся данным частоту определить нельзя.

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

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

Со стороны пищеварительной системы: редко – тошнота, запор.

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

Местные реакции: редко - реакции в месте введения.

Передозировка:

Данные по передозировке препарата Но-шпа отсутствуют.

Лечение: в случае передозировки пациенты должны находиться под медицинским наблюдением. Если препарат недавно был принят внутрь можно искусственно вызвать рвоту или промыть желудок. При необходимости следует проводить симптоматическое и направленное на поддержание основных функций организма лечение.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Как показали исследования репродуктивности у животных и ретроспективные данные по клиническому применению дротаверина, применение дротаверина при беременности не оказывало ни тератогенного, ни эмбриотоксического действия.

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

В связи с отсутствием необходимых клинических данных препарат противопоказан в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Ингибиторы ФДЭ, подобные папаверину, ослабляют противопаркинсонический эффект леводопы. При назначении препарата Но-шпа® одновременно с леводопой возможно усиление ригидности и тремора.

При одновременном применении с дротаверином происходит взаимное усиление спазмолитического действия папаверина, бендазола и других спазмолитиков, включая м-холиноблокаторы.

Но-шпа усиливает артериальную гипотензию, вызываемую трициклическими антидепрессантами, хинидином и прокаинамидом.

Но-шпа снижает спазмогенную активность морфина.

Фенобарбитал усиливает спазмолитическое действие дротаверина.

Дротаверин в значительной степени связывается с белками плазмы, преимущественно альбумином, β-и γ-глобулинами. Данные по взаимодействию дротаверина с препаратами, значительно связывающимися с белками плазмы, отсутствуют. Однако можно предположить возможность их взаимодействия с дротаверином на уровне связывания с белками плазмы - вытеснение одного из препаратов другим из мест связывания и увеличение концентрации свободной фракции в крови препарата с более слабым связыванием с белками. Это гипотетически может повышать риск возникновения фармакодинамических и/или токсических побочных эффектов этого препарата.

Особые указания и меры предосторожности:

В состав таблеток входит 52 мг лактозы, вследствие этого возможны жалобы со стороны пищеварительной системы у пациентов, страдающих непереносимостью латозы. Поэтому препарат в форме таблеток не назначают пациентам с дефицитом лактазы, галактоземией или синдромом нарушенной абсорбции глюкозы/галактозы.

В состав раствора для в/в и в/м введения входит натрия бисульфит, который может вызвать аллергические реакции, включая анафилактические и бронхоспазм, у чувствительных лиц (особенно у лиц с бронхиальной астмой или аллергическими реакциями в анамнезе). При повышенной чувствительности к метабисульфиту натрия парентерального применения препарата следует избегать.

При в/в введении препарата пациентам с пониженным АД больной должен находиться в горизонтальном положении в связи с риском развития коллапса.

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

После парентерального введения препарата рекомендуется воздержаться от вождения автотранспорта и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующей высокой концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения:

Таблетки в блистерах алюминий/алюминий следует хранить при температуре не выше 30°С.

Таблетки в блистерах ПВХ/алюминий следует хранить при температуре не выше 25°С.

Таблетки во флаконах и раствор для в/в и в/м введения следует хранить в защищенном от света месте при температуре от 15° до 25°С.

Срок годности:

Таблетки в блистерах алюминий/алюминий, таблетки во флаконах и раствор для в/в и в/м введения — 5 лет. Таблетки в блистерах ПВХ/алюминий — 3 года.

Условия отпуска в аптеке:

Без рецепта.

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