

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Толперизон Медисорб

Регистрационный номер: ЛП-№(000928)-(РГ-РУ)
Торговое наименование: Толперизон Медисорб
Международное непатентованное или группировочное наименование: толперизон
Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав на одну таблетку:

Действующее вещество: толперизона гидрохлорид 50,00 мг или 150,00 мг;

Вспомогательные вещества: лимонной кислоты моногидрат, лактозы моногидрат, крахмал картофельный, целлюлоза микрокристаллическая (тип 102), кремния диоксид коллоидный (аэросил), магния стеарат;

Состав пленочной оболочки Opady II (85F18422): поливиниловый спирт, титана диоксид, макрогол (ПЭГ), тальк.

Описание: Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета. На поперечном разрезе ядро белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: миорелаксант центрального действия.

Код АТХ: M03BX04

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Толперизон является миорелаксантом центрального действия. Точный механизм действия полностью не выяснен. Толперизон обладает высокой аффинностью к нервной ткани, достигая наибольших концентраций в стволе головного мозга, спинном мозге и периферической нервной системе. Основной эффект толперизона опосредован торможением спинальных рефлекторных дуг. Вероятно, этот эффект совместно с устранением облегчения проведения возбуждения по нисходящим путям обеспечивает терапевтическое воздействие толперизона.

Химическая структура толперизона схожа со структурой лидокаина. Подобно лидокаину, толперизон обладает мембраностабилизирующим действием и снижает электрическую возбудимость двигательных нейронов и первичных афферентных волокон. Толперизон дозозависимо тормозит активность потенциалзависимых натриевых каналов. Соответственно, снижается амплитуда и частота потенциала действия.

Был доказан угнетающий эффект на потенциалзависимые кальциевые каналы. Предполагается, что в дополнение к его мембраностабилизирующему действию толперизон может также тормозить выброс медиатора. Толперизон обладает некоторыми слабыми свойствами альфа-адренергических антагонистов и антимиокаринным действием.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь толперизон хорошо всасывается в тонком кишечнике. Максимальная плазменная концентрация отмечается через 0,5-1,0 час после приема.

По причине выраженного пресистемного метаболизма биодоступность составляет около 20%. Богатая жирами пища увеличивает биодоступность принятого внутрь толперизона примерно до 100% и увеличивает максимальную плазменную концентрацию примерно на 45% по сравнению с приемом препарата натощак, задерживая время достижения максимальной концентрации примерно на 30 мин.

Метаболизм

Толперизон интенсивно метаболизируется в печени и почках. Фармакологическая активность метаболитов неизвестна.

Выведение

Практически полностью (более 99%) выводится почками в форме метаболитов. Период полувыведения ($T_{1/2}$) после приема внутрь – около 2,5 ч.

Показания к применению

Симптоматическое лечение спастичности у взрослых, обусловленной инсультом. Миофасциальный болевой синдром средней и тяжелой степени тяжести (в т.ч. мышечный спазм при дорсопатиях).

Противопоказания

- гиперчувствительность к толперизону и/или к другим вспомогательным компонентам препарата;
- миастения gravis;
- детский возраст до 18 лет;
- период грудного вскармливания;
- редко встречающаяся наследственная непереносимость галактозы, дефицит лактазы лопарей или глюкозо-галактозная мальабсорбция.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

В экспериментальных исследованиях на животных не выявлено тератогенного действия толперизона. По причине отсутствия значимых клинических данных толперизон не следует применять во время беременности (особенно в I триместре), за исключением случаев, когда ожидаемая польза определенно оправдывает потенциальный риск для плода.

Период грудного вскармливания

Поскольку данные о выделении толперизона с грудным молоком отсутствуют, то его применение в период грудного вскармливания противопоказано (см. раздел «Противопоказания»).

Способ применения и дозы

Внутрь. После еды, запивая стаканом воды. Биодоступность толперизона снижается при приеме натощак.

По 50 мг 3 раза в день, постепенно повышая дозу до 150 мг 3 раза в день.

Особые группы пациентов

Пациенты с почечной недостаточностью

Опыт применения толперизона у пациентов с почечной недостаточностью ограничен, у данной категории пациентов чаще возникали нежелательные реакции. Поэтому у пациентов с нарушениями функции почек средней степени необходимо проводить подбор дозы толперизона с тщательным наблюдением за состоянием здоровья пациента и контролем функции почек. При тяжелом поражении почек назначение толперизона не рекомендуется.

Пациенты с печеночной недостаточностью

Опыт применения толперизона у пациентов с печеночной недостаточностью ограничен, у данной категории пациентов чаще возникали нежелательные реакции. Поэтому у пациентов с нарушениями функции печени средней степени необходимо проводить подбор дозы толперизона с тщательным наблюдением за состоянием здоровья пациента и контролем функции печени. При тяжелых поражениях печени назначение толперизона не рекомендуется.

Побочное действие

Профиль безопасности толперизона подтверждается данными применения более чем у 12000 пациентов. Согласно этим данным, наиболее часто описаны нарушения со стороны кожи и подкожных тканей, общие, неврологические и желудочно-кишечные расстройства. В пострегистрационный период использования толперизона количество полученных сообщений о развитии реакций гиперчувствительности, связанных с применением толперизона, составило около 50-60% всех полученных сообщений. В большинстве случаев это были несерьезные нежелательные реакции. Об угрожающих жизни аллергических реакциях сообщалось очень редко.

Частота нежелательных реакций классифицирована согласно рекомендациям Всемирной организации здравоохранения: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$); редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$); частота неизвестна (частоту возникновения нежелательных реакций невозможно оценить на основании имеющихся данных).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: очень редко – анемия, лимфоаденопатия.

Нарушения со стороны иммунной системы: редко – реакции гиперчувствительности, анафилактические реакции; очень редко – анафилактический шок; частота неизвестна – ангионевротический отек, включая отек лица, губ.

Нарушения метаболизма и питания: нечасто – анорексия; очень редко – полидипсия.

Психические нарушения: нечасто – бессонница, нарушение сна; редко – снижение активности, депрессия; очень редко – спутанность сознания.

Нарушения со стороны нервной системы: нечасто – головная боль, головокружение, сонливость; редко – нарушение внимания, тремор, эпилепсия, гипестезия, парестезия, судороги, недомогание, летаргия.

Нарушения со стороны органа зрения: редко – нечеткость зрения.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта: редко – шум в ушах, вертиго.

Нарушения со стороны сердца: редко – стенокардия, тахикардия, ощущение сердцебиения; очень редко – брадикардия.

Нарушения со стороны сосудов: нечасто – артериальная гипотензия; редко – «приливы» крови к лицу.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: редко – одышка, носовое кровотечение, учащенное дыхание.

Желудочно-кишечные нарушения: нечасто – дискомфорт в животе, диарея, сухость во рту, диспепсия, тошнота; редко – боль в эпигастральной области, запор, метеоризм, рвота.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: редко – печеночная недостаточность средней степени.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: редко – аллергический дерматит, повышенная потливость, кожный зуд, крапивница, кожная сыпь.

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани: нечасто – мышечная слабость, миалгия, боль в конечностях; редко – дискомфорт в конечностях; очень редко – остеопения.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: редко – энурез, протеинурия.

Общие нарушения и реакции в месте введения: нечасто – астения, дискомфорт, усталость; редко – чувство опьянения, чувство жара, раздражительность, жажда; очень редко – дискомфорт в грудной клетке.

Лабораторные и инструментальные данные: редко – снижение артериального давления, гипербилирубинемия, изменение активности печеночных ферментов, тромбоцитопения, лейкоцитоз; очень редко – увеличение концентрации креатинина в плазме крови.

Если у Вас отмечаются нежелательные реакции, указанные в инструкции или они усугубляются, или Вы заметили любые другие нежелательные реакции, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

Передозировка

Симптомы передозировки чаще всего включают: сонливость, желудочно-кишечные нарушения (тошнота, рвота, боль в эпигастрии), тахикардия, повышение артериального давления, брадикардия и вертиго. В тяжелых случаях судороги, угнетение дыхания, апноэ и кома. Лечение: специфического антидота нет, рекомендована симптоматическая терапия.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

В фармакокинетических исследованиях лекарственных взаимодействий установлено, что совместный прием толперизона с субстратом изофермента CYP2D6 декстрометорфаном способствует увеличению концентрации в крови средств, которые метаболизируются преимущественно изоферментом CYP2D6, например, тиоридазона, толтероидина, венлафаксина, атомoksetина, дезипрамина, декстрометорфана, метопролола, небиволола и перфеназина.

В исследованиях *in vitro* на микросомах печени человека и гепатоцитах человека выражено ингибирование или индукция других изоферментов CYP2B6, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP1A2, CYP3A4 не подтверждены. Повышение экспозиции толперизона не ожидается после одновременного введения субстратов изофермента CYP2D6 и/или других препаратов из-за разнообразия метаболических путей толперизона.

Биодоступность толперизона снижается при приеме натощак, поэтому применение препарата рекомендуется после приема пищи.

Хотя толперизон влияет на центральную нервную систему, его потенциальный седативный эффект низкий. В случае совместного приема с другими миорелаксантами центрального действия следует оценить необходимость снижения дозы толперизона.

Толперизон усиливает действие нифлумовой кислоты, поэтому следует уменьшить дозу нифлумовой кислоты или другого нестероидного противовоспалительного препарата (НПВП) в случае одновременного применения с толперизоном.

Особые указания

Наиболее частыми нежелательными реакциями при применении толперизона в пострегистрационном периоде были реакции гиперчувствительности.

Их выраженность варьирует от легких кожных реакций до тяжелых системных реакций, включая анафилактический шок. Симптомами реакции гиперчувствительности могут быть: сыпь, крапивница, зуд, ангионевротический отек, тахикардия, артериальная гипотензия, одышка.

Женщины и пациенты с повышенной чувствительностью к другим препаратам или с аллергией в анамнезе могут быть подвержены более высокому риску гиперчувствительности к толперизону.

В случае известной гиперчувствительности к лидокаину при применении толперизона следует соблюдать повышенную осторожность из-за возможных перекрестных реакций.

Необходимо рекомендовать пациентам иметь осторожность в отношении возможных симптомов аллергии. Пациенты должны быть осведомлены о том, что при появлении симптомов аллергии следует прекратить прием толперизона и немедленно обратиться за медицинской помощью.

После эпизода гиперчувствительности к толперизону повторно назначать препарат нельзя.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Толперизон не влияет на способность к управлению транспортными средствами и механизмами. Пациенты, у которых наблюдалось головокружение, сонливость, нарушение внимания, судороги, нарушение зрения или мышечная слабость во время приема препарата должны обратиться к врачу.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 50 мг и 150 мг.

По 7, 10 или 14 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку картонную.

Условия хранения

При температуре не выше 30 °С.
Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.
Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель:

Акционерное общество «Медисорб»
Юридический адрес: 614042, Пермский край, г. Пермь, ул. Гальперина, д. 6
Адрес места осуществления производства: Пермский край, г. Пермь, ул. Причальная, зд. 16

Владелец регистрационного удостоверения / Организация, принимающая претензии потребителей:

Акционерное общество «Медисорб»
Юридический адрес: 614042, Пермский край, г. Пермь, ул. Гальперина, д. 6
Тел/факс: (342) 259-41-41
E-mail: info@medisorb.ru
www.medisorb.ru