

**ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
Толперизон Медисорб**

Перед применением препарата полностью прочитайте инструкцию.

Храните инструкцию вместе с препаратом до окончания приема.

Регистрационный номер: ЛП-005639

Торговое наименование препарата: Толперизон Медисорб

Международное непатентованное наименование: толперизон

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав на 1 таблетку: действующее вещество: толперизона гидрохлорид 50,0 мг или 150,0 мг;

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

оболочка: 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

Миорелаксант центрального действия. 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. Также 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 α -адренергических антагонистов и антимиокардиновым действием.

Фармакокинетика

Абсорбция и распределение

После приема внутрь толперизон хорошо всасывается в тонком кишечнике. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 0,5-1 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 и выведение

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

Выводится через почки в виде метаболитов (более чем в 99%). Фармакологическая активность метаболитов неизвестна. Период полувыведения ($T_{1/2}$) после приема внутрь примерно 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;
- непереносимость лактозы, дефицит лактазы и/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 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.

Способ применения и дозы

Внутрь, после еды, не разжевывая, не разламывая таблетку, запивая небольшим количеством воды. Биодоступность толперизона снижается при приеме натощак.

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

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, составляло около 50-60% всех полученных сообщений. В большинстве случаев это были несерьезные побочные реакции. Об угрожающих жизни аллергических реакциях сообщалось очень редко.

Частота побочных явлений 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 – реакция гиперчувствительности*, анафилактические реакции; очень редко – анафилактический шок.

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

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

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

Нарушения со стороны органа зрения: редко – снижение

остроты 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, тахипноз.

Желудочно-кишечные нарушения: нечасто – дискомфорт в животе, диспепсия, диарея, сухость во рту, тошнота; редко – боль в эпигастрии, 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, гипергидроз, кожный зуд, кожная сыпь, крапивница.

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани: нечасто – боль в мышцах, мышечная слабость, 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, чувство усталости, недомогания; редко – ощущение опьянения, ощущение тепла, раздражительность, жажда; очень редко – дискомфорт в грудной клетке.

Лабораторные и инструментальные данные: редко – гипербилирубинемия, нарушение функции печени, тромбоцитопения, лейкоцитоз; очень редко – гиперкреатининемия.

* В рамках пострегистрационного мониторинга сообщалось об ангионевротическом отеке, включая отек лица и губ (частота неизвестна).

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях с целью обеспечения непрерывного мониторинга отношения пользы и риска лекарственного препарата. Если у Вас возникли какие-либо нежелательные реакции, обратитесь к лечащему врачу, работнику аптеки или производителю. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях.

Передозировка

Данные о передозировке толперизона немногочисленные.

В доклинических исследованиях острой токсичности высокие дозы толперизона вызывали атаксию, тонико-клонические судороги, одышку и дыхательный паралич.

Толперизон не имеет специфического антидота. При передозировке рекомендуется симптоматическое и поддерживающее лечение.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Исследования фармакокинетического лекарственного взаимодействия с маркерным субстратом изофермента CYP2D6 декстрометорфаном показали, что одновременное применение толперизона может повысить содержание в крови лекарственных веществ, которые метаболизируются преимущественно изоферментом CYP2D6 (тиоридазон, толтеродин, венлафаксин, атомоксетин, дезипрамин, декстрометорфан, метопролол, небилोल, перфеназин).

В лабораторных экспериментах на микросомах печени человека и гепатоцитах человека значительного ингибирования или индукции других изоферментов CYP (CYP2B6, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP1A2, CYP3A4) не обнаружено.

В связи с разнообразием метаболических путей толперизона повышение экспозиции толперизона при одновременном применении субстратов изофермента CYP2D6 и (или) других препаратов не ожидается.

Биодоступность толперизона снижается при приеме натощак.

Несмотря на то, что толперизон является препаратом центрального действия, седативный эффект у него очень низкий. При одновременном применении с другими миорелаксантами центрального действия дозу толперизона следует уменьшать.

Средства для общей анестезии, периферические миорелаксанты, психотропные препараты, клонидин – усиливают эффект толперизона.

Толперизон усиливает действие нифлумовой кислоты, поэтому при одновременном применении следует рассматривать уменьшение дозы нифлумовой кислоты или других нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП).

Особые указания

Наиболее частыми нежелательными реакциями являются реакции гиперчувствительности.

Аллергические реакции проявляются от легких кожных до тяжелых системных, включая анафилактический шок. Симптомы аллергических реакций: покраснение, сыпь, крапивница, зуд, ангионевротический отек (отек Квинке), тахикардия, артериальная гипотензия, одышка. Пациенты женского пола с реакциями гиперчувствительности к другим препаратам или аллергическими реакциями в анамнезе подвержены более высокому риску.

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

Пациентам следует быть внимательными в отношении любых симптомов гиперчувствительности. Если возникли симптомы, то следует немедленно прекратить прием толперизона и немедленно обратиться к врачу. Не следует повторно назначать толперизон после эпизода гиперчувствительности к лекарственному препарату, его содержащему.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и работу с механизмами

При приеме толперизона возможно развитие побочных эффектов (головокружение, сонливость), поэтому следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и выполнении работ, требующих повышенной концентрации внимания.

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.

По 30, 60 или 100 таблеток в банки полимерные с крышкой.

Каждую банку или 1,2,3,4,5 или 6 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.

Срок годности

3 года.

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска

Отпуск по рецепту.

Производитель:

Акционерное общество «Медисорб»
Юридический адрес: 614113, Россия, г. Пермь, ул. Гальперина, 6

Адрес места осуществления производства: 614113, г. Пермь, ул. Причальная, д.16
Организация, принимающая претензии от потребителей: АО «Медисорб» 614113, Россия, г. Пермь, ул. Гальперина, 6
Тел/факс: (342) 259-41-41
E-mail: info@medisorb.ru
www.medisorb.ru



МЕДИСОРБ