

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата

ТОЛИЗОР

Регистрационный номер: ЛП-003217
Торговое наименование: Толлизор
Международное непатентованное наименование: толперизон
Лекарственная форма: капсулы
Состав:

Одна капсула 50 мг содержит:

Активное вещество: толперизона гидрохлорид –50,00 мг;

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 55,22 мг; лактозы моногидрат (сахар молочный) - 34,33 мг; кроскармеллоза натрия - 6,32 мг; гипромеллоза - 1,58 мг; лимонной кислоты моногидрат - 1,50 мг; магния стеарат - 1,05 мг.

Состав корпуса капсулы: краситель железа оксид желтый - 0,0733 %; титана диоксид - 1,0000 %; вода – 14,50 %; желатин - до 100 %.

Состав крышечки капсулы: краситель железа оксид черный - 0,0500 %; титана диоксид - 2,0000 %; вода – 14,50 %; желатин - до 100 %.

Одна капсула 150 мг содержит:

Активное вещество: толперизона гидрохлорид – 150,00 мг;

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая – 70,00 мг; лактозы моногидрат (сахар молочный) - 43,50 мг; кроскармеллоза натрия - 12,00 мг; гипромеллоза - 3,00 мг; лимонной кислоты моногидрат - 4,50 мг; магния стеарат - 2,00 мг.

Состав корпуса капсулы: краситель железа оксид черный - 0,0500 %; титана диоксид - 2,0000 %; вода – 14,50 %; желатин - до 100 %.

Состав крышечки капсулы: краситель хинолиновый желтый - 0,7500 %; краситель солнечный закат желтый - 0,0059 %; титана диоксид - 2,0000 %; вода – 14,50 %; желатин - до 100 %.

Описание:

Дозировка 50 мг. Капсулы твердые желатиновые № 2. Корпус желтого с кремовым оттенком цвета, крышечка светло-серого цвета, непрозрачные.

Дозировка 150 мг. Капсулы твердые желатиновые № 0. Корпус светло-серого цвета, крышечка желтого цвета, непрозрачные.

Содержимое капсул – смесь порошка и гранул белого или почти белого цвета с характерным запахом. Допускается уплотнение содержимого капсул в комки по форме капсулы, легко разрушаемые при надавливании.

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, он 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 α-адренергических антагонистов и антимускариновым действием.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь толперизон хорошо всасывается в тонкой кишке. Максимальная плазменная концентрация отмечается через 0,5-1 ч 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 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 любому из компонентов препарата или химически сходному эперизону.

Миастения gravis.

Детский возраст до 18-ти лет.

Грудное вскармливание.

Непереносимость лактозы, недостаточность лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

С осторожностью

Применять женщинам, пациентам с гиперчувствительностью к лидокаину и/или другим препаратам, или имеющих аллергию в анамнезе (см. раздел **«Особые указания»**), пациентам с почечной и печёночной недостаточностью (см. раздел **«Способ применения и дозы»**).

Если у Вас имеется какое-либо из перечисленных состояний/заболеваний, перед применением препарата следует проконсультироваться с врачом.

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 при беременности (особенно в I триместре), за исключением случаев, когда ожидаемая польза определено оправдывает потенциальный риск для плода.

Период грудного вскармливания

Поскольку данные о выделении толперизона с грудным молоком отсутствуют, то его применение в период кормления грудью противопоказано.

Способ применения и дозы

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

Доза препарата подбирается исходя из индивидуальной потребности пациента и переносимости препарата.

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

Рекомендуемая суточная доза 150-450 мг, разделенная на 3 части.

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. Применение препарата не рекомендуется у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью.

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. Применение препарата не рекомендуется у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью.

Побочное действие

Профиль безопасности толперизона подтверждаетс данными применения более чем у 12 000 пациентов. В соответствии с этими данными наиболее частыми были нарушения со стороны кожи и подкожных тканей, общие расстройства, нарушения со стороны нервной системы и желудочно-кишечно-го тракта.

В пострегистрационный период реакции гиперчувствительности составили 50-60 % всех побочных

реакций. Большинство побочных реакций не были серьезными и проходили самостоятельно. Жизнеугрожающие реакции гиперчувствительности регистрировались очень редко.

Побочные реакции приведены ниже в соответствии с классификацией MedDRA и частотой: нечасто (≥1/1000, <1/100), редко (≥1/10000, <1/1000), очень редко (<1/10000), частота неизвестна (невозможно оценить на основании имеющихся данных).

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

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

Нарушения со стороны обмена веществ и питания: нечасто – анорексия; очень редко – полидипсия.

Нарушения психики: нечасто – нарушение сна, бессонница; 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, летаргия.

Нарушения со стороны органа зрения: редко – нечеткость зрения.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения: 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».

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

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: нечасто – дискомфорт в животе, диспепсия, диарея, сухость во рту, тошнота; редко – боль в эпигастральной области, запор, метеоризм, рвота.

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

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

Нарушения со стороны скелетно-мышечной системы 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 расстройства и нарушения в месте введения: нечасто – астения, дискомфорт, усталость; редко – чувство опыянения, 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 любые из указанных в инструкции нежелательных реакций усугубляются, или Вы заметили любые другие нежелательные реакции, не указанные в инструкции, сообщите об этом лечащему врачу.

Передозировка

Симптомы передозировки чаще всего включают: сонливость, желудочно-кишечные нарушения (тошнота, рвота, боль в эпигастрии), тахикардия, повышение артериального давления, брадикинезия и вертиго. В тяжелых случаях судороги и кома.

Лечение: специфического антидота нет, рекомендована симптоматическая терапия.

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 средств, которые метаболизируются преимущественно изоферментом CYP2D6 (тиоридазон, толперодин, венлафаксин, атомoksetин, дезипрамин, декстрометорфан, метопролол, небиволол, перфеназин).

В лабораторных экспериментах на микросомах печени человека и гепатоцитах человека значительного ингибирования или индукции других изофер-

ментов 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 его очень низкий. При одновременном применении с другими миорелаксантами центрального действия дозу толперизона следует уменьшать.

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

Особые указания

Наиболее частыми нежелательными реакциями являются реакции гиперчувствительности.

Аллергические реакции проявляются от легких кожных до тяжелых системных, включая анафилактический шок. Симптомы аллергической реакции: покраснение, сыпь, крапивница, зуд, ангионевротический отек (отек Квинке), тахикардия, артериальная гипотензия и 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, следует немедленно прекратить прием толперизона и немедленно обратиться к врачу. Не следует повторно назначать толперизон после эпизода гиперчувствительности к лекарственному препарату, его содержащему.

Препарат «Толлизор» содержит лактозы моногидрат, поэтому пациентам с редкой наследственной непереносимостью галактозы, недостаточностью лактазы и глюкозо-галактозной мальабсорбцией принимать препарат «Толлизор» не следует.

Влияние препарата на способность управлять транспортными средствами и механизмами

Толлизор не влияет на способность управлять 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

Капсулы по 50 и 150 мг.

По 5, 7, 10, 20, 30 капсул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 10, 20, 30, 40, 50, 60 или 100 капсул в банки из полиэтиленерифталата или банки полимерные для лекарственных средств.

Одну банку или 1, 2, 3, 4, 5, 6 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в картонную упаковку (пачку).

Для дозирования 150 мг: комплект (по 3 контурные ячейковые упаковки по 10 капсул в пачке из картона и по 3 контурные ячейковые упаковки по 10 капсул в пачке из картона) в пачку из картона для потребительской тары.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Держатель регистрационного удостоверения:

ООО «Атолл»

Россия, 445351, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Строителей, д. 6.

Производитель: ООО «Озон»

Россия, 445351, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Организация, принимающая претензии: ООО «Озон»

Россия, 445351, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел.: +79874599991; +79874599992

E-mail:ozon@ozon-pharm.ru