

Склад

діюча речовина: толперизону гідрохлорид;

1 таблетка містить толперизону гідрохлориду 150 мг;

допоміжні речовини: кислота лимонна, моногідрат; кремнію діоксид колоїдний безводний; кислота стеаринова; тальк; целюлоза мікрокристалічна; крохмаль кукурудзяний; лактози моногідрат; гіпромелоза; макрогол 6000; титану діоксид (E 171).

Лікарська форма

Таблетки, вкриті оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки круглої форми, вкриті оболонкою, білого або майже білого кольору, з верхньою і нижньою опуклими поверхнями. На розламі під лупою видно ядро, оточене одним суцільним шаром.

Фармакотерапевтична група

Засоби, що впливають на опорно-руховий апарат. Міорелаксанти. Міорелаксанти з центральним механізмом дії. Інші міорелаксанти центральної дії. Толперизон. Код АТХ M03B X04.

Фармакодинаміка

Толперизон є міорелаксантом центральної дії. Механізм дії толперизону повністю не з'ясований.

Він володіє високою афінністю до нервової тканини, досягаючи найбільших концентрацій у стовбурі головного мозку, спинному мозку та периферичній нервовій системі.

Найбільш значущим ефектом толперизону є його гальмівна дія на спинномозковий рефлекторний шлях. Імовірно, цей ефект спільно з інгібуючою дією на спадні провідні шляхи зумовлює терапевтичну користь толперизону.

Хімічна структура толперизону схожа зі структурою лідокаїну. Як і лідокаїн, він чинить мембраностабілізуючу дію та знижує електричну збудливість рухових нейронів і первинних аферентних волокон. Толперизон дозозалежно гальмує активність потенціал-залежних натрієвих каналів. Відповідно, знижується амплітуда і частота потенціалу дії.

Був доведений пригнічувальний ефект на потенціалзалежні кальцієві канали. Передбачається, що на додаток до його мембраностабілізуючої дії толперизон може також гальмувати викид медіатору.

На довершення до всього толперизон має деякі слабо виражені властивості альфа-адренергічних антагоністів і чинить антимускаринову дію.

Фармакокінетика

Після прийому всередину толперизон добре всмоктується у тонкому кишечнику. Максимальна концентрація препарату у плазмі крові досягається через 0,5–1,5 години після прийому. У зв'язку зі значно вираженим метаболізмом першого проходження біодоступність толперизону становить приблизно 20 %. Жирна їжа збільшує біодоступність препарату після прийому всередину приблизно на 100 %, а максимальну концентрацію у плазмі - приблизно на 45 % порівняно з прийомом натщесерце. Час досягнення максимальної концентрації при цьому збільшується приблизно на 30 хвилин.

Толперизон інтенсивно метаболізується печінкою і нирками. Препарат майже повністю виводиться нирками (більше ніж 99 %) у вигляді метаболітів.

Фармакологічна активність метаболітів невідома. Період напіввиведення толперизону після внутрішньовенного введення становить близько 1,5 години, після прийому всередину - приблизно 2,5 години.

Показання

Симптоматичне лікування м'язового спазму у дорослих після перенесеного інсульту.

Протипоказання

- Гіперчутливість до діючої речовини або подібного з нею за хімічним складом еперизону, або до будь-якої з допоміжних речовин.
- Міастенія гравіс.
- Період годування груддю.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій

Фармакокінетичні дослідження лікарських взаємодій з декстрометорфаном, субстратом CYP2D6, продемонстрували, що одночасне призначення толперизону підвищує концентрації у плазмі крові препаратів, які переважно метаболізуються цитохромом CYP2D6, зокрема концентрації тіоридазину, толтеродину,

венлафаксину, атомоксетину, дезипраміну, декстрометорфану, метопрололу, небівололу, перфеназину.

У дослідженнях *in vitro* у мікросомах печінки і гепатоцитах людини значущого інгібування або індукції інших ізоферментів CYP (CYP2B6, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP1A2, CYP3A4) не виявлено.

Очікується, що при одночасному прийомі з іншими субстратами CYP2D6 та/або іншими препаратами експозиція толперизону зростати не буде, що зумовлено різноманітністю шляхів метаболізму толперизону.

При прийомі толперизону натщесерце його біодоступність знижується, тому при призначенні препарату рекомендується враховувати зв'язок з прийомом їжі.

Хоча толперизон є препаратом центральної дії, імовірність розвитку седативного ефекту при його застосуванні мала. У разі одночасного призначення з іншими міорелаксантами центральної дії необхідно розглянути питання про зниження дози толперизону.

Толперизон потенціює ефекти ніфлумінової кислоти, тому при одночасному прийомі з толперизоном дозу ніфлумінової кислоти, так само як і інших НПЗП, доцільно зменшити.

Особливості застосування

Реакції гіперчутливості

У постмаркетинговий період при застосуванні толперизону найчастіше спостерігалися побічні реакції гіперчутливості. Їх вираженість варіює від легких шкірних реакцій до тяжких системних реакцій, включаючи анафілактичний шок. Симптомами реакцій гіперчутливості можуть бути еритема, висип, кропив'янка, свербіж, ангіоневротичний набряк, тахікардія, гіпотензія або задишка.

У жінок з гіперчутливістю до інших препаратів або алергічними станами в анамнезі ризик реакцій гіперчутливості при прийомі толперизону більш високий.

Хімічна структура толперизону схожа зі структурою лідокаїну, тому при алергічній реакції в анамнезі на лідокаїн ймовірний розвиток такої реакції на толперизон. Перед початком лікування толперизоном пацієнти повинні повідомити про наявність гіперчутливості на лідокаїн.

Необхідно рекомендувати пацієнтам бути уважними до свого стану для виявлення можливих симптомів алергії. Пацієнти повинні бути інформовані про те, що при появі симптомів алергії слід припинити прийом толперизону і негайно

звернутися за медичною допомогою.

Після епізоду гіперчутливості до толперизону повторно призначати препарат не можна.

Препарат містить лактози моногідрат. У разі непереносимості лактози, дефіциті лактази саамів (*Lapp lactase deficiency*) або мальабсорбції глюкози-галактози не слід застосовувати цей препарат.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами

Враховуючи можливість розвитку таких симптомів як запаморочення, сонливість, порушення уваги, епілепсія, нечіткість зору слід з обережністю застосовувати препарат при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Застосування у період вагітності або годування груддю

За даними досліджень на тваринах, толперизон не чинить тератогенної дії.

Зважаючи на відсутність значущих клінічних даних застосування препарату, толперизон не слід застосовувати у період вагітності.

Оскільки невідомо, чи проникає толперизон у грудне молоко, застосування препарату у період годування груддю протипоказане.

Спосіб застосування та дози

Препарат слід приймати після їди, запиваючи 1 склянкою води. Недостатній прийом їжі може зменшити біодоступність толперизону.

Дорослі: залежно від індивідуальної потреби й переносимості по 150–450 мг на добу за 3 прийоми.

Пацієнти з порушеннями функцій нирок

Досвід застосування препарату пацієнтам з ураженням нирок обмежений, у таких хворих відзначалася більш висока частота небажаних ефектів. У зв'язку з цим при помірному ураженні нирок рекомендується індивідуальне титрування дози з ретельним наглядом за станом пацієнта і контролем функції нирок. При тяжкому ураженні нирок призначати толперизон не рекомендується.

Пацієнти з порушеннями функцій печінки

Досвід застосування препарату пацієнтам з ураженням печінки обмежений, у таких хворих відзначалася більш висока частота небажаних явищ. У зв'язку з цим при помірному ураженні печінки рекомендується індивідуальне титрування дози з ретельним наглядом за станом пацієнта і контролем функції печінки. При тяжкому ураженні печінки призначати толперизон не рекомендується.

Діти

Безпека та ефективність толперизону для дітей не вивчені.

Передозування

Дані щодо передозування толперизону є недостатніми.

Симптоми при передозуванні в основному можуть включати сонливість, прояви з боку шлунково-кишкового тракту (нудота, блювання, біль в епігастрії), тахікардія, артеріальна гіпертензія, брадикінезія та вертиго. У важких випадках були повідомлення про судоми та кому.

Для толперизону не існує специфічного антидоту. У разі передозування рекомендується симптоматичне лікування.

Побічні реакції

Профіль безпеки таблеток, що містять толперизон, заснований на даних стосовно більш ніж 12000 пацієнтів. Відповідно до цих даних найчастіше виникали такі побічні реакції як порушення з боку шкіри і підшкірної клітковини, системні порушення, порушення з боку нервової і травної систем.

За даними постмаркетингового спостереження, приблизно 50 – 60 % випадків побічних реакцій, асоційованих з прийомом толперизону, становлять реакції гіперчутливості. Більшість цих реакцій були несерйозними і проходили самостійно. Реакції гіперчутливості, що становили загрозу для життя, виникали у поодиноких випадках.

Побічні реакції наведені за класами систем органів відповідно до Медичного словника регуляторної діяльності MedDRA, з використанням визначень частоти MedDRA: нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), рідко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$), дуже рідко ($< 1/10000$), невідомої частоти (не можна оцінити за наявними даними).

Класи систем органів	Нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$)	Рідко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$)	Дуже рідко ($< 1/10000$)
З боку крові та лімфатичної системи			Анемія
З боку імунної системи		Реакція гіперчутливості Анафілактична реакція	Анафілаксія
З боку обміну речовин та харчування	Анорексія		Полідипсія
Порушення психіки	Безсоння Порушення сну	Зниження активності Депресія	Сплутаність
З боку нервової системи	Головний біль Запаморочення Сонливість	Порушення уваги Тремор Судоми Гіперстезія Парестезія Летаргія (підвищена сонливість)	
З боку органів зору		Порушення зору	
З боку органів слуху і лабіринтні порушення		Шум у вухах Вертиго	

З боку серця		Стенокардія Тахікардія Прискорене серцебиття Зниження артеріального тиску	Брадика
З боку судин	Гіпотонія	Гіперемія шкіри	
З боку дихальної системи, органів грудної клітки і середостіння		Утруднення дихання Носова кровотеча Прискорене дихання	
З боку шлунково-кишкового тракту	Відчуття дискомфорту у животі Діарея Сухість слизової оболонки порожнини рота Диспепсія Нудота	Болі в епігастрії Запор Метеоризм Блювання	
З боку печінки та жовчовивідних шляхів		Пошкодження печінки легкого ступеня	

З боку шкіри та підшкірних тканин		Алергічний дерматит Гіпергідроз Свербіж Кропив'янка Висип	
З боку скелетно-м'язової системи та сполучної тканини	М'язова слабкість Міалгія Болі у кінцівках	Відчуття дискомфорту у кінцівках	Остеопе
З боку нирок і сечовивідних шляхів		Енурез Протеїнурія	
Загальні порушення та ускладнення у місці введення	Астенія Дискомфорт Підвищена втомлюваність	Відчуття сп'яніння Відчуття жару Дратівливість Спрага	Відчуття грудях
Лабораторні та інструментальні дані		Зниження артеріального тиску Підвищення концентрації білірубіну в крові Зміна активності печінкових ферментів Зниження кількості тромбоцитів Лейкоцитоз	Підвище концент в крові

Термін придатності

2 роки.

Умови зберігання

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 30 оС. Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка

По 10 таблеток у блістері. По 3 блістери у пачці з картону.

Категорія відпуску

За рецептом.

Виробник

ПрАТ «Технолог».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності

Україна, 20300, Черкаська обл., місто Умань, вулиця Стара прорізна, будинок 8.

Джерело інструкції

Інструкцію лікарського засобу взято з офіційного джерела — [Державного реєстру лікарських засобів України](#).