

Состав

действующее вещество: толперизон гидрохлорид;

1 таблетка содержит толперизон гидрохлорида 150 мг;

вспомогательные вещества: кислота лимонная, моногидрат; кремния диоксид коллоидный безводный; кислота стеариновая; тальк; целлюлоза микрокристаллическая; крахмал кукурузный; лактозы моногидрат; гипромеллоза; макрогол 6000; титана диоксида (Е 171).

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые оболочкой.

Основные физико-химические свойства: таблетки круглой формы, покрытые оболочкой, белого или почти белого цвета с верхней и нижней выпуклыми поверхностями. На разломе под лупой видно ядро, окруженное одним сплошным слоем.

Фармакотерапевтическая группа

Средства, воздействующие на опорно-двигательный аппарат. Миорелаксанты. Миорелаксанты с центральным механизмом действия. Другие миорелаксанты центрального действия. Толперизон. Код АТХ М03В Х04.

Фармакодинамика

Толперизон является миорелаксантом центрального действия. Механизм действия толперизона полностью не выяснен.

Он обладает высокой аффинностью к нервной ткани, достигая наибольших концентраций в стволе головного мозга, спинном мозге и периферической нервной системе.

Наиболее значимым эффектом толперизона является его тормозное действие на спинномозговой рефлекторный путь. Вероятно, этот эффект совместно с ингибирующим действием на нисходящие ведущие пути обуславливает терапевтическую пользу толперизона.

Химическая структура толперизона схожа со структурой лидокаина. Как и лидокаин, он оказывает мембраностабилизирующее действие и снижает электрическую возбудимость двигательных нейронов и первичных афферентных

волокон. Толперизон дозозависимо тормозит активность потенциал-зависимых натриевых каналов. Соответственно, снижается амплитуда и частота потенциала деяния.

Был доказан угнетающий эффект на потенциалзависимые кальциевые каналы. Предполагается, что в дополнение к мембраностабилизирующему действию толперизон может также тормозить выброс медиатора.

В довершение ко всему толперизон обладает некоторыми слабо выраженными свойствами альфа-адренергических антагонистов и оказывает антиму斯卡риновое действие.

Фармакокинетика

После приёма внутрь толперизон хорошо всасывается в тонком кишечнике. Максимальная концентрация препарата в плазме крови достигается через 0,5–1,5 часа после приема. В связи с значительно выраженным метаболизмом первого прохождения биодоступность толперизона составляет примерно 20%. Жирная пища увеличивает биодоступность препарата после приема внутрь примерно на 100%, а максимальную концентрацию в плазме - примерно на 45% по сравнению с приемом натощак. Время достижения максимальной концентрации увеличивается приблизительно на 30 минут.

Толперизон интенсивно метаболизируется печенью и почками. Препарат почти полностью выводится почками (более 99%) в виде метаболитов.

Фармакологическая активность метаболитов неизвестна. Период полувыведения толперизона после введения составляет около 1,5 часа, после приема внутрь - примерно 2,5 часа.

Показания

Симптоматическое лечение мышечного спазма у взрослых после перенесенного инсульта.

Противопоказания

- Гиперчувствительность к действующему веществу или сходному с ним по химическому составу эпизона, или к любому из вспомогательных веществ.
- Миастения гравис.
- Период кормления грудью.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Фармакокинетические исследования лекарственных взаимодействий с декстрометорфаном, субстратом CYP2D6, продемонстрировали, что одновременное назначение толперизона повышает концентрации в плазме крови препаратов, преимущественно метаболизирующихся цитохромом CYP2D6, в частности концентрации тиоридазина, толтероидина, венлафаксина, декокрокузин,

В исследованиях *in vitro* в микросомах печени и гепатоцитах человека значимого ингибирования или индукции других изоферментов CYP (CYP2B6, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP1A2, CYP3A4) не обнаружено.

Ожидается, что при одновременном приеме с другими субстратами CYP2D6 и/или другими препаратами экспозиция толперизона не будет возрастать, что обусловлено разнообразием путей метаболизма толперизона.

При приеме толперизона натощак его биодоступность снижается, поэтому при назначении препарата рекомендуется учитывать связь с приемом пищи.

Хотя толперизон является препаратом центрального действия, вероятность развития седативного эффекта при его применении мала. При одновременном назначении с другими миорелаксантами центрального действия необходимо рассмотреть вопрос о снижении дозы толперизона.

Толперизон потенцирует эффекты нифлуминовой кислоты, поэтому при одновременном приеме с толперизоном дозу нифлуминовой кислоты, равно как и других НПВП, целесообразно уменьшить.

Особенности применения

Реакции гиперчувствительности

В постмаркетинговый период при применении толперизона наиболее часто наблюдались побочные реакции гиперчувствительности. Их выраженность варьирует от легких кожных реакций до тяжелых системных реакций, включая анафилактический шок. Симптомами реакций гиперчувствительности могут быть эритема, сыпь, крапивница, зуд, ангионевротический отек, тахикардия, гипотензия или одышка.

У женщин с гиперчувствительностью к другим препаратам или аллергическими состояниями в анамнезе риск реакций гиперчувствительности при приеме толперизона более высок.

Химическая структура толперизона схожа со структурой лидокаина, поэтому при аллергической реакции в анамнезе на лидокаин возможно развитие такой реакции на толперизон. Перед началом лечения толперизоном пациенты должны сообщить о наличии гиперчувствительности к лидокаину.

Необходимо рекомендовать пациентам быть внимательными к своему состоянию для выявления 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.

Препарат содержит моногидрат лактозы. В случае непереносимости лактозы, дефицита лактазы саамов (*Lapp lactase deficiency*) или мальабсорбции глюкозы-галактозы не следует применять этот препарат.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Учитывая возможность развития таких симптомов как головокружение, сонливость, нарушение внимания, эпилепсия, нечеткость зрения, следует с осторожностью применять при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

По данным исследований на животных, толперизон не оказывает тератогенного действия.

Ввиду отсутствия значимых клинических данных применения препарата толперизон не следует применять в период беременности.

Поскольку неизвестно, проникает ли толперизон в грудное молоко, применение препарата в период кормления грудью противопоказано.

Способ применения и дозы

Препарат следует принимать после еды, запивая 1 стаканом воды. Недостаточный прием пищи может снизить биодоступность толперизона.

Взрослые: в зависимости от индивидуальной потребности и переносимости по 150–450 мг в сутки в 3 приема.

Пациенты с нарушениями функции почек

Опыт применения препарата пациентам с поражением почек ограничен, у таких больных отмечалась более высокая частота побочных эффектов. В связи с этим при умеренном поражении почек рекомендуется индивидуальное титрование дозы с тщательным наблюдением за состоянием пациента и контролем функции почек. При тяжелом поражении почек назначать толперизон не рекомендуется.

Пациенты с нарушениями функции печени

Опыт применения препарата пациентам с поражением печени ограничен, у таких больных отмечалась более высокая частота нежелательных явлений. В связи с этим при умеренном поражении печени рекомендуется индивидуальное титрование дозы с тщательным наблюдением за состоянием пациента и контролем функции печени. При тяжелом поражении печени назначать толперизон не рекомендуется.

Дети

Безопасность и эффективность толперизона для детей не изучены.

Передозировка

Данные о передозировке толперизоном недостаточные.

Симптомы при передозировке в основном могут включать сонливость, проявления со стороны желудочно-кишечного тракта (тошнота, рвота, боль в эпигастрии), тахикардия, артериальная гипертензия, брадикардия и вертиго. В тяжелых случаях сообщалось о судорогах и коме.

Для толперизона не существует специфического антидота. В случае передозировки рекомендуется симптоматическое и поддерживающее лечение.

Побочные реакции

Профиль безопасности таблеток, содержащих толперизон, основан на данных о более чем 12000 пациентов. В соответствии с этими данными наиболее часто возникали такие побочные реакции как нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки, системные нарушения, нарушения со стороны нервной и пищеварительной систем.

По данным постмаркетингового наблюдения, примерно 50–60 % случаев побочных реакций, ассоциированных с приемом толперизона, составляют реакции гиперчувствительности. Большинство этих реакций были несерьезными

и проходили самостоятельно. Реакции гиперчувствительности, представляющие угрозу для жизни, возникали в единичных случаях.

Побочные реакции приведены по классам систем органов согласно Медицинского словаря регуляторной деятельности MedDRA, с использованием определений частоты MedDRA: нечасто ($\geq 1/1000$, $<1/100$), редко ($\geq 1/10000$, $<1/1000$), очень редко ($<1/10000$), неизвестной частоты (нельзя оценить по имеющимся данным).

Классы систем органов	Нечасто ($\geq 1/1000$, $<1/100$)	Редко ($\geq 1/10000$, $<1/1000$)	Очень редко ($<1/10000$)
Со стороны крови и лимфатической системы			Анемия Лимфаденопатия
Со стороны иммунной системы		Реакция гиперчувствительности Анафилактическая реакция	Анафилактический шок
Со стороны обмена веществ и питания	Анорексия		Полидипсия
Нарушения психики	Бессонница Нарушения сна	Снижение активности Депрессия	Спутанность сознания

Со стороны нервной системы	Головная боль Головокружение Сонливость	Нарушения внимания Тремор Судороги Гипестезия Парестезия Летаргия (повышенная сонливость)	
Со стороны органов зрения		Нарушения зрения	
Со стороны органов слуха и лабиринтные нарушения		Шум в ушах Вертиго	
Со стороны сердца		Стенокардия Тахикардия Ускоренное сердцебиение Снижение артериального давления	Брадикардия
Со стороны сосудов	Гипотония	Гиперемия кожи	
Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения		Затруднения дыхания Носовое кровотечение Ускоренное дыхание	

Со стороны желудочно- кишечного тракта	Ощущение дискомфорта в животе Диарея Сухость слизистой оболочки полости рта Диспепсия Тошнота	Боль в эпигастрии Запор Метеоризм Рвота	
Со стороны печени и желчевыводящих путей		Повреждение печени легкой степени	
Со стороны кожи и подкожных тканей		Аллергический дерматит Гипергидроз Зуд Крапивница Сыпь	
Со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани	Мышечная слабость Миалгия Боль в конечностях	Ощущение дискомфорта в конечностях	Остеопения

Со стороны почек и мочевыводящих путей		Энурез Протеинурия	
Общие расстройства и нарушения в месте введения	Астения Дискомфорт Повышенная утомляемость	Ощущение опьянения Ощущение жара Раздражительность Жажда	Ощущение дискомфорта в груди
Лабораторные и инструментальные данные		Снижение артериального давления Повышение концентрации билирубина в крови Смена активности печеночных ферментов Снижение количества тромбоцитов Лейкоцитоз	Повышение концентрации креатинина в крови

Срок годности

2 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 30 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере. По 3 блистера в пачке из картона.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ЧАО «Технолог».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 20300, Черкасская обл., город Умань, улица Старая прорезная, дом 8.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).