

ЗАТВЕРДЖЕНО
Наказ Міністерства охорони
здоров'я України
01.12.14 № 905
Реєстраційне посвідчення
№ UA/9556/02/01
UA/9556/02/02

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу
ТОЛПЕРІЛ-ЗДОРОВ'Я

Склад:

діюча речовина: tolperisone; 1 таблетка містить толперизону гідрохлориду 50 мг або 150 мг;
допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна; лактоза, моногідрат; кислота стеаринова; крохмаль картопляний; крохмаль кукурудзяний; тальк; кислота лимонна, моногідрат; кремнію діоксид колоїдний безводний; гіпромелоза; титану діоксид (Е 171); поліетиленгліколь 6000.

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки, вкриті плівковою оболонкою, білого або майже білого кольору, круглої форми з двоопуклою поверхнею.

Фармакотерапевтична група. Міорелаксанти центральної дії. Код АТХ M03B X04.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Міорелаксанти центральної дії. Механізм дії зумовлений гальмуванням провідності імпульсів первинних аферентних волокон і рухових нейронів у результаті мембраностабілізуючої і місцевоанестезуючої дії, що призводить до блокування спинномозкових моно- і полісинаптичних рефлексів. Шляхом гальмування надходження Ca^{2+} у синапси вторинно перешкоджає виходу медіаторів. Гальмує проведення збудження за ретикулоспінальним шляхом. Посилює периферичний кровотік незалежно від впливу ЦНС. У розвитку цього ефекту може відігравати роль слабкий спазмолітичний і антиадренергічний ефект толперизону.

Фармакокінетика. При прийомі внутрішньо добре всмоктується у тонкому кишечнику. C_{max} у плазмі крові досягається через 0,5-1 годину; внаслідок значного первинного метаболізму біодоступність становить приблизно 20 %. Піддається інтенсивному метаболізму у печінці і нирках. Виводиться нирками, більше 99 % – у вигляді метаболітів, фармакологічна активність яких невідома. $T_{1/2}$ – приблизно 2,5 години.

Клінічні характеристики.

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

Протипоказання. Підвищена чутливість до компонентів препарату/еперизону. Міастенія гравіс.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. Одночасне призначення толперизону підвищує концентрації у крові препаратів, які переважно метаболізуються CYP2D6, зокрема тіоридазину, толтеродину, венлафаксину, атомоксетину, дезипраміну, декстрометорфану, метопрололу, небіволулу, перфеназину. Значущого інгібування або індукції інших ізоферментів CYP (2B6, 2C8, 2C9, 2C19, 1A2, 3A4) не виявлено.

Очікується, що при одночасному прийомі з іншими субстратами CYP2D6 і/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.

Толперизон посилює дію ніфлумової кислоти, тому при одночасному застосуванні може знадобитися зниження дози останньої, так само, як і інших НПЗП.

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

Особливості застосування. Спостерігалися побічні реакції гіперчутливості. Їх вираженість варіює від легких шкірних реакцій до тяжких системних реакцій, включаючи анафілактичний шок. Симптомами реакцій гіперчутливості можуть бути еритема, висипи, кропив'янка, свербіж, ангіоневротичний набряк, тахікардія, артеріальна гіпотензія або задишка.

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

Необхідно рекомендувати пацієнтам бути уважними до свого стану для виявлення можливих симптомів алергії. Пацієнти мають бути проінформовані 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 лактозу, що слід враховувати пацієнтам із рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, недостатністю лактази, синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції.

Застосування у період вагітності або годування груддю. Існують дані, що толперизон не чинить тератогенну дію у тварин. Застосування препарату у I триместрі вагітності протипоказане. Застосування препарату у II і III триместрах вагітності можливе, коли, на думку лікаря, очікувана користь значною мірою перевищує потенційний ризик для плода/дитини.

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

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами. Враховуючи можливість розвитку запаморочення, сонливості, порушення уваги, епілепсії, нечіткості зору, слід з обережністю застосовувати препарат при керуванні автотранспортом та іншими механізмами.

Спосіб застосування і дози. Препарат слід приймати після їди, запиваючи склянкою води. Недостатній прийом їжі може знизити біодоступність толперизону.

Дорослим залежно від індивідуальної потреби й переносимості – по 150-450 мг/добу за 3 прийоми.

Тривалість курсу лікування визначається індивідуально.

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

Діти. Безпека і ефективність застосування толперизону дітям не вивчені.

Передозування. Дані щодо передозування обмежені. Препарат має широкий терапевтичний індекс, за даними доза 600 мг, прийнята внутрішньо, не викликала симптомів інтоксикації у дітей. Дратівливість спостерігалася, коли дітям давали внутрішньо 300-600 мг на добу. Існують дані, що введення високих доз викликало атаксію, тоніко-клонічні судоми, утруднення і зупинку дихання.

Лікування: симптоматична і підтримуюча терапія. Специфічного антидоту немає.

Побічні реакції. Зазвичай препарат добре переноситься, оскільки має дуже хороший профіль безпеки. Найбільш часто виникали такі побічні реакції, як порушення з боку шкіри, системні порушення з боку нервової і травної систем. Приблизно 50-60 % випадків побічних реакцій, асоційованих із застосуванням толперизону, становили реакції гіперчутливості. Загалом, ці реакції були несерйозними і проходили самостійно. Також виникали реакції гіперчутливості, що становили загрозу для життя.

З боку системи крові і лімфатичної системи: анемія, лімфаденопатія.

З боку імунної системи: реакція гіперчутливості, анафілактична реакція, анафілактичний шок.

З боку нервової системи: головний біль, запаморочення, сонливість, порушення уваги, тремор, судоми, гіпестезія, парестезія, порушення сну, сплутаність свідомості, летаргія (підвищена сонливість), безсоння, зниження активності, депресія.

З боку органів чуття: порушення зору, шум у вухах, вертиго.

З боку судинної системи: гіпотонія, гіперемія шкіри.

З боку серця: стенокардія, тахікардія, прискорене серцебиття, зниження артеріального тиску, брадикардія.

З боку дихальної системи: утруднення дихання, носова кровотеча, прискорене дихання.

З боку травної системи: нудота, блювання, відчуття дискомфорту у животі, діарея, сухість слизової оболонки порожнини рота, диспепсія, біль в епігастрії, запор, метеоризм, пошкодження печінки легкого ступеня.

З боку шкіри: алергічний дерматит, гіпергідроз, свербіж, кропив'янка, висипи.

З боку кістково-м'язової системи: м'язова слабкість, міалгія, відчуття дискомфорту/біль у кінцівках, остеопенія.

З боку сечовидільної системи: енурез, протеїнурія.

Загальні порушення: астенія, дискомфорт, підвищена стомлюваність, анорексія, відчуття сп'яніння, відчуття жару, дратівливість, спрага, полідипсія, відчуття дискомфорту у грудях.

Лабораторні показники: підвищення концентрації білірубину у крові, зміна активності печінкових ферментів, зниження кількості тромбоцитів, лейкоцитоз, підвищення концентрації креатиніну у крові.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. В оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.
Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою, по 50 мг або 150 мг № 10×3 у блістерах у коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ТОВ «Фармацевтична компанія «Здоров'я».

Заявник. ТОВ «Фармацевтична компанія «Здоров'я».

Місцезнаходження виробника/заявника та його адреса місця провадження діяльності.
Україна, 61013, м. Харків, вул. Шевченка, 22.

Дата останнього перегляду.

Узгоджено з матеріалами
реєстраційного досьє та достовірно
відомими даними щодо застосування
лікарського засобу

Узгоджено з матеріалами
реєстраційного досьє та достовірно
відомими даними щодо застосування
лікарського засобу