

ИНСТРУКЦИЯ  
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА  
**ТОЛПЕРИЗОН ОРГАНИКА**

**Регистрационный номер:**

**Торговое наименование:** Толперизон Органика

**Международное непатентованное наименование:** толперизон

**Лекарственная форма:** таблетки, покрытые пленочной оболочкой

**Состав:** 1 таблетка содержит *действующее вещество:* толперизона гидрохлорид – 50,00 мг или 150,00 мг, *вспомогательные вещества:* лактозы моногидрат – 48,50 мг или 145,50 мг, крахмал кукурузный – 28,96 мг или 86,88 мг, целлюлоза микрокристаллическая тип 101 – 14,00 мг или 42,00 мг, тальк – 4,50 мг или 13,50 мг, стеариновая кислота – 1,31 мг или 3,93 мг, гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза) 2910 тип 606 – 1,20 мг или 3,60 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) – 0,80 мг или 2,40 мг, лимонной кислоты моногидрат – 0,73 мг или 2,19 мг, *состав оболочки:* опадрай II белый (серия 30F28359) – 5,00 мг или 10,00 мг или другая пленкообразующая система с указанным составом: (гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза) 2910 – 2,00 мг или 4,00 мг, титана диоксид – 1,25 мг или 2,50 мг, полиэтиленгликоль (макрогол) – 0,80 мг или 1,60 мг, лактозы моногидрат – 0,65 мг или 1,30 мг, триацетин – 0,30 мг или 0,60 мг).

**Описание:** круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета; на поперечном разрезе ядро почти белого цвета.

**Фармакотерапевтическая группа:** Миорелаксанты; миорелаксанты центрального действия; другие миорелаксанты 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. Основным эффектом 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.

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  $\alpha$ -адренергических антагонистов и антимиускариновым 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*

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

#### *Выведение*

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.

### **С осторожностью**

Препарат следует применять с осторожностью у женщин, пациентов с гиперчувствительностью к лидокаину и/или другим препаратам или с аллергией в

анамнезе (см. раздел «Особые указания»), у пациентов с почечной и печеночной недостаточностью (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Если у Вас имеется какое - либо из вышеперечисленных состояний/заболеваний перед приемом препарата обязательно проконсультируйтесь 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 1 триместре), за исключением случаев, когда ожидаемая польза определенно 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 разламывая таблетку, запивая небольшим количеством воды. Биодоступность толперизона снижается при приеме натошак.

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, лимфаденопатия.

*Нарушения со стороны иммунной системы:*

редко - реакции гиперчувствительности\*, анафилактические реакции;

очень редко - анафилактический шок.

частота неизвестна: ангионевротический отек, включая отек лица, губ.

*Нарушения метаболизма и питания:*

нечасто - анорексия;

очень редко - полидипсия.

*Психические нарушения:*

нечасто – бессонница, нарушение сна;

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 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, учащенное дыхание.

*Желудочно - кишечные нарушения:*

нечасто - дискомфорт в животе, диарея, сухость во рту, диспепсия, 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, зуд, крапивница, сыпь.

*Нарушения со стороны мышечной, скелетной 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 нарушения и реакции в месте введения:*

нечасто - астения, дискомфорт, усталость;

редко - чувство опьянения, 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.

\* 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**

Симптомы: сонливость, желудочно-кишечные нарушения (тошнота, рвота, боль в эпигастрии), тахикардию, повышение артериального давления, брадикардию и вертиго. В тяжелых случаях судороги, угнетение дыхания, апноэ 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, толтеродин, венлафаксин, атомоксетин, дезипрамин, декстрометорфан, метопролол, небиволол, 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 натошак.

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.

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).

Следует информировать лечащего врача обо всех принимаемых вами лекарственных препаратах.

### **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.

Пациентам с редко встречающейся непереносимостью лактозы, дефицитом лактазы и/или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот препарат.

### **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, 150 мг.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой.

2, 3, 4, 5, 6, 9 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению (листочком-вкладышем) помещают в пачку из картона.

### **Условия хранения**

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

### **Срок годности**

3 года.

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

### **Условия отпуска**

Отпускают по рецепту.

### **Владелец регистрационного удостоверения/Производитель/Организация, принимающая претензии потребителя:**

Акционерное общество «Органика» (АО «Органика»), Россия, 654034, Кемеровская область - Кузбасс, г.о. Новокузнецкий, г. Новокузнецк, район Кузнецкий, шоссе Кузнецкое, д. 3, тел. (3843) 994-222, root@organica.su