

ИНСТРУКЦИЯ  
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

**Толзитол® Табс**

**Регистрационный номер:**

**Торговое наименование:** Толзитол® Табс

**Международное непатентованное или группировочное наименование:**

Толперизон

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

**Состав**

на 1 таблетку:

|                                  |           |           |
|----------------------------------|-----------|-----------|
| <i>Действующее вещество:</i>     | 50 мг     | 150 мг    |
| Толперизона гидрохлорид          | 50,00 мг  | 150,00 мг |
| <i>Вспомогательные вещества:</i> |           |           |
| Лактозы моногидрат               | 48,70 мг  | 146,10 мг |
| Крахмал кукурузный               | 29,77 мг  | 89,31 мг  |
| Целлюлоза микрокристаллическая   | 14,00 мг  | 42,00 мг  |
| Тальк                            | 4,50 мг   | 13,50 мг  |
| Стеариновая кислота              | 1,50 мг   | 4,50 мг   |
| Кремния диоксид коллоидный       | 0,80 мг   | 2,40 мг   |
| Кислоты лимонной моногидрат      | 0,73 мг   | 2,19 мг   |
| Масса ядра                       | 150,00 мг | 450,00 мг |
| <i>Пленочная оболочка:</i>       |           |           |
| Поливиниловый спирт              | 2,00 мг   | 4,00 мг   |
| частично гидролизованный         | (40,00 %) | (40,00 %) |
| Титана диоксид (E171)            | 1,25 мг   | 2,50 мг   |
|                                  | (25,00 %) | (25,00 %) |

|                                                        |                      |                      |
|--------------------------------------------------------|----------------------|----------------------|
| Макрогол (Полиэтиленгликоль)                           | 1,01 мг<br>(20,20 %) | 2,02 мг<br>(20,20 %) |
| Тальк                                                  | 0,74 мг<br>(14,80 %) | 1,48 мг<br>(14,80 %) |
| или                                                    |                      |                      |
| Готовое пленочное покрытие Опадрай® II белый 85F18422: | 5,00 мг              | 10,00 мг             |
| [Поливиниловый спирт частично гидролизованный          | 40,00 %              | 40,00 %              |
| Титана диоксид                                         | 25,00 %              | 25,00 %              |
| Макрогол 4000 (Полиэтиленгликоль 4000)                 | 20,20 %              | 20,20 %              |
| Тальк]                                                 | 14,80 %              | 14,80 %              |
| или                                                    |                      |                      |
| идентичная по составу пленочная оболочка               | 5,00 мг              | 10,00 мг             |

### Описание

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые, со слабым характерным запахом. На поперечном разрезе ядро белого или 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. 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  $\alpha$ -адренергических антагонистов и антиму斯卡риновым действием.

### ***Фармакокинетика***

#### **Абсорбция**

После приема внутрь толперизон хорошо всасывается в тонком кишечнике. 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 на 100 % и увеличивает максимальную плазменную концентрацию примерно на 45 % по сравнению с приемом препарата натощак, задерживая время достижения максимальной концентрации примерно на 30 мин.

#### **Биотрансформация**

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

### Элиминация

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 (в том числе мышечный спазм при дорсопатиях) у взрослых

### **Противопоказания**

- Гиперчувствительность к толперизону или химически сходному эперизону, или к любому из компонентов препарата
- Миастения gravis
- Беременность и период грудного вскармливания
- Детский возраст до 18 лет
- Непереносимость галактозы, недостаточность лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция

### **С осторожностью**

Препарат следует применять с осторожностью:

- у женщин;
- у 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, 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**

Внутри, после еды, не разжевывая, не разламывая таблетку, запивая стаканом воды.

Биодоступность толперизона снижается при приеме натошак.

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

Рекомендованная суточная доза в зависимости от индивидуальной потребности и переносимости препарата пациентом составляет 150–450 мг, разделенная на 3 приема.

### ***Особые группы пациентов***

#### **Пациенты с нарушением функции почек**

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 нарушением функции печени

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 тяжелом поражении печени назначение толперизона не рекомендуется.

### ***Применение у детей***

Безопасность и эффективность препарата Толзитол® Табс у детей в возрасте от 0 до 18 лет на данный момент не установлены. Данные отсутствуют. Препарат Толзитол® Табс противопоказан у детей в возрасте от 0 до 18 лет.

### **Побочное действие**

Профиль безопасности толперизона оценивался по данным постмаркетингового применения более чем у 12000 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-кишечного тракта.

При постмаркетинговом применении 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 ( $\geq 1/1000$ ,  $< 1/100$ ), редко ( $\geq 1/10000$ ,  $< 1/1000$ ), 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 метаболизма и питания***

*Нечасто:* анорексия.

*Очень редко:* полидипсия.

### ***Психические нарушения***

*Нечасто:* нарушения сна, бессонница.

*Редко:* нарушение 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».

### ***Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения***

*Редко:* одышка, носовое кровотечение, учащенное дыхание.

### ***Желудочно-кишечные нарушения***

*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, зуд, сыпь, крапивница.

***Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани***

*Нечасто:* боль в мышцах, мышечная слабость, боль в конечностях.

*Редко:* дискомфорт в конечностях.

*Очень редко:* остеопения.

***Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей***

*Редко:* энурез, протеинурия.

***Общие расстройства 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.

***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***

Симптомы передозировки чаще всего включают сонливость, желудочно-кишечные нарушения (тошноту, рвоту, боль в эпигастральной области), тахикардию, повышение артериального давления, брадикардию и вертиго. В тяжелых случаях судороги, угнетение дыхания, апноэ и кома.

## **Лечение**

Специфического антидота нет, рекомендуется проводить симптоматическую терапию.

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами**

В фармакокинетических исследованиях лекарственных взаимодействий установлено, что совместный прием толперизона с субстратом изофермента CYP2D6 декстрометорфаном способствует увеличению концентрации в крови средств, которые метаболизируются преимущественно изоферментом CYP2D6, например, тиоридазина, толтеролина, венлафаксина, атомоксетина, дезипрамина, декстрометорфана, метопролола, небиволола, перфеназина.

В исследованиях *in vitro* на микросомах печени человека и гепатоцитах человека выраженное ингибирование или индукция других изоферментов CYP (CYP2B6, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP1A2, CYP3A4) не подтверждены.

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, поэтому применение препарата рекомендуется после приема пищи.

Несмотря на то, что толперизон является препаратом центрального действия, его потенциальный седативный эффект низкий. В случае совместного приема с другими миорелаксантами центрального действия следует оценить необходимость снижения дозы толперизона.

Толперизон усиливает действие нифлумовой кислоты, поэтому следует уменьшить дозу нифлумовой кислоты или другого нестероидного противовоспалительного средства в случае одновременного применения с толперизоном.

### **Особые указания**

Наиболее частыми нежелательными реакциями при применении толперизона в пострегистрационном периоде были реакции гиперчувствительности. Их выраженность варьирует от легких кожных реакций до тяжелых системных реакций, включая анафилактический шок. Симптомами реакций гиперчувствительности могут быть покраснение, сыпь, крапивница, зуд, ангионевротический отек (отек Квинке), тахикардия, артериальная гипотензия и одышка.

Женщины и пациенты с повышенной чувствительностью к другим препаратам или с аллергией в анамнезе могут быть подвержены более высокому риску гиперчувствительности к толперизону.

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 возможных симптомов гиперчувствительности. При появлении симптомов аллергии пациенту следует прекратить прием толперизона и немедленно обратиться к врачу. Нельзя повторно назначать толперизон после эпизода гиперчувствительности к лекарственному препарату, его содержащему.

### ***Вспомогательные вещества***

Препарат Толзитол® Табс содержит лактозу. Пациентам с редкой наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы лопарей или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот препарат.

### **Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами**

Толперизон не влияет на способность управлять транспортными средствами и механизмами. Пациентам, у которых есть головокружение, сонливость,

нарушение внимания, эпилепсия, нечеткость зрения или мышечная слабость во время приема препарата, следует проконсультироваться с врачом.

### **Форма выпуска**

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 50 мг, 150 мг.

5, 7, 10, 14, 15, 20, 25 или 30 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки ПВХ и фольги алюминиевой печатной лакированной.

5, 10, 20, 30, 40, 50, 60 или 100 таблеток в банку из полиэтилентерефталата для лекарственных средств, укупоренную крышкой навинчиваемой с контролем первого вскрытия из полиэтилена низкого давления или в банку полимерную из полиэтилена низкого давления, укупоренную крышкой навинчиваемой из полиэтилена низкого давления для лекарственных средств. Допускается свободное пространство в банке заполнять ватой медицинской гигроскопической.

Одну банку или 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона.

### **Условия хранения**

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

### **Срок годности**

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

### **Условия отпуска**

Отпускают по рецепту.

### **Держатель регистрационного удостоверения**

Российская Федерация

ООО «ПРОМОМЕД РУС»

Адрес: 129090, г. Москва, проспект Мира, дом 13, строение 1, офис 13

Телефон: +7 (495) 640-25-28

Электронная почта: reception@promomed.pro

**Производитель**

АО «Биохимик», Российская Федерация

Юридический адрес: 430030, Республика Мордовия, г. Саранск, ул. Васенко,  
д. 15А

Адрес места производства: 430030, Республика Мордовия, г. Саранск,  
ул. Васенко, д.15А

Телефон: +7 (8342) 38-03-68

Адрес электронной почты: biohimic@promomed.pro

Адрес в сети интернет: promomed.ru

**Организация, принимающая претензии потребителей**

ООО «ПРОМОМЕД РУС», Российская Федерация

Адрес: 129090, г. Москва, проспект Мира, дом 13, строение 1, офис 13

Телефон: 8 800 222 95 63; 8 800 777 86 04 (круглосуточно)

Электронная почта: hot\_line@promomed.pro