

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Толперизон Органика, 50 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Толперизон Органика, 150 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: толперизон.

Толперизон Органика, 50 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит 50 мг толперизона гидрохлорида.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат (см. раздел 4.4.).

Толперизон Органика, 150 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Каждая таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит 150 мг толперизона гидрохлорида.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат (см. разделы 4.3., 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета; на поперечном разрезе ядро почти белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат Толперизон Органика показан к применению взрослым в возрасте от 18 лет:

- симптоматическое лечение спастичности у взрослых, обусловленной инсультом;
- миофасциальный болевой синдром средней и тяжелой степени тяжести (в т.ч. мышечный спазм при дорсопатиях).

4.2. Режим дозирования и способ применения

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

Режим дозирования

Взрослые

Рекомендованная суточная доза зависит от индивидуальной потребности и переносимости препарата.

По 50 мг 3 раза в день, постепенно повышая дозу до 150 мг 3 раза в день.

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.

Дети

Безопасность и эффективность препарата Толперизон Органика у детей и подростков младше 18 лет не установлены. Препарат Толперизон Органика противопоказан у детей и подростков в возрасте до 18 лет (см. раздел 4.3.).

Способ применения

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

Биодоступность толперизона снижается при приеме натошак.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к толперизону или химически сходному эперизону или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.;
- миастения gravis;
- детский возраст до 18 лет;
- период грудного вскармливания (см. раздел 4.6).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

Препарат следует применять с осторожностью у женщин, пациентов с гиперчувствительностью к лидокаину и/или другим препаратам или с аллергией в анамнезе, у пациентов с почечной и печеночной недостаточностью (см. раздел 4.2.).

Если у Вас имеется какое - либо из вышеперечисленных состояний/заболеваний перед приемом препарата обязательно проконсультируйтесь с врачом.

Особые указания

Реакции гиперчувствительности

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.

Вспомогательные вещества

Препарат Толперизон Органика содержит лактозы моногидрат. Пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактозы лопарей или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот препарат.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

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).

4.6. Фертильность, беременность и лактация

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.

Лактация

Поскольку данные о выделении толперизона с грудным молоком отсутствуют, то его применение в период кормления грудью противопоказано.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Толперизон не оказывает влияния на способность к управлению транспортными средствами и механизмами. Пациентам, у которых есть головокружение, сонливость, нарушение внимания, эпилепсия, нечеткость зрения или мышечная слабость во время приема толперизона, следует проконсультироваться с врачом.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

Профиль безопасности толперизона оценивался по данным постмаркетингового исследования 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 нежелательных реакций. Большинство нежелательных реакций не были серьезными и проходили самостоятельно. Жизнеугрожающие реакции гиперчувствительности регистрировались очень редко.

Резюме нежелательных реакций

Нежелательные реакции приведены в соответствие с системно-органной классификацией и распределением по частоте возникновения. В каждой частотной группе побочные действия представлены в порядке уменьшения их серьезности.

Частота побочных эффектов определена следующим образом:

очень часто: $\geq 1/10$; часто: $\geq 1/100$, $< 1/10$; нечасто: $\geq 1/1000$, $< 1/100$; редко: $\geq 1/10\ 000$, $< 1/1000$; очень редко: $< 1/10\ 000$; частота неизвестна (не может быть определена 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).

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непосредственного мониторинга соотношения «польза/риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств - членов Евразийского экономического союза.

· Российская Федерация

Адрес: 109012, Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Телефон: +78005509903

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт: www.roszdravnadzor.gov.ru

4.9 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.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: Миорелаксанты; миорелаксанты центрального действия; другие миорелаксанты центрального действия.

Код АТХ: M03BX04

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

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, 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 α -адренергических антагонистов и антиму斯卡риновым действием.

5.2 Фармакокинетические свойства

Абсорбция

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.

Биотрансформация

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

Элиминация

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.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Лактозы моногидрат,

Крахмал кукурузный,

Целлюлоза микрокристаллическая тип 101,

Тальк,

Стеариновая кислота,

Гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза) 2910 тип 606,

Кремния диоксид коллоидный (аэросил),

Лимонной кислоты моногидрат.

Состав оболочки:

Опадрай II белый (серия 30F28359) или другая пленкообразующая система с указанным составом: гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза) 2910, титана диоксид, полиэтиленгликоль (макрогол), лактозы моногидрат, триацетин.

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

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 (листком-вкладышем) помещают в пачку из картона.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

Акционерное общество «Органика» (АО «Органика»)

654034, Кемеровская область - Кузбасс, г.о. Новокузнецкий, г. Новокузнецк, район Кузнецкий, шоссе Кузнецкое, д. 3

тел. (3843) 994-222

root@organica.su.

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

Акционерное общество «Органика» (АО «Органика»)

654034, Кемеровская область - Кузбасс, г.о. Новокузнецкий, г. Новокузнецк, район
Кузнецкий, шоссе Кузнецкое, д. 3

тел. (3843) 994-222

root@organica.su.

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первичной регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Толперизон Органика доступна на
информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-
коммуникационной сети «Интернет» <http://www.eec.eaeunion.org/>.