

# МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ

## ИНСТРУКЦИЯ

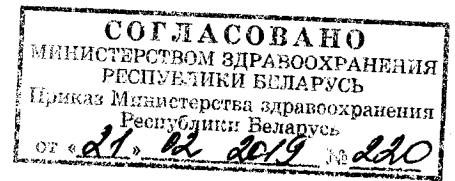
по медицинскому применению лекарственного средства  
**ТОЛПЕРИЗОН-ЛФ**

### Торговое название

Толперизон-ЛФ

### Международное непатентованное название

Tolperisone



### Описание

Круглые таблетки двояковыпуклой формы, покрытые оболочкой белого цвета.

### Состав

1 таблетка содержит:

*Активное вещество:* толперизона гидрохлорид – 50 мг или 150 мг.

*Вспомогательные вещества:* лактоза моногидрат, натрия крахмалгликолят (тип А), кислота лимонная безводная, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат, целлюлоза микрокристаллическая, опадрай II белый (спирт поливиниловый частично гидролизованный, титана диоксид, макрогол/ПЭГ, тальк).

**Форма выпуска:** таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

### Фармакотерапевтическая группа

Прочие миорелаксанты центрального действия.

### Код АТХ

M03BX04.

### Фармакологическое действие

#### *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.

Основной эффект толперизона связан с 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. Как и лидокаин, он обладает мембраностабилизирующим действием и снижает электрическую возбудимость двигательных нейронов и первичных афферентных волокон. Толперизон дозозависимо тормозит активность потенциал-зависимых натриевых каналов. Соответственно, снижается амплитуда и частота потенциала действия. Был доказан угнетающий эффект на потенциал-зависимые кальциевые каналы. Предполагается, что в дополнение к его мембраностабилизирующему действию толперизон может также тормозить выброс медиатора.

В довершение ко всему, толперизон обладает некоторыми слабыми свойствами альфа-адренергических антагонистов и антиму斯卡риновым действием.

#### *Фармакокинетика*

#### *Всасывание и распределение*

После приема внутрь толперизон хорошо всасывается в тонком кишечнике. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 0,5-1,5 часа после приема. По причине выраженного пресистемного метаболизма биодоступность составляет около 20%. Пища с высоким содержанием жиров увеличивает биодоступность перорально назначаемого толперизона примерно до 100 % и увеличивает пиковую плазменную концентрацию примерно на 45 % по сравнению с приемом лекарственного средства натощак, задерживая время

достижения пиковой концентрации примерно на 30 минут.

#### *Метаболизм и выведение*

Толперизон интенсивно метаболизируется в печени и почках. Соединение практически полностью (более 99 %) выводится почками в форме метаболитов. Фармакологическая активность метаболитов неизвестна. Период полувыведения после применения внутрь – около 2,5 ч.

#### **Показания к применению**

- Неотложное или длительное лечение патологически повышенного тонуса скелетных мышц при органических неврологических заболеваниях (повреждении пирамидных путей, рассеянном склерозе, цереброваскулярных нарушениях, миелопатии, энцефаломиелите и т.д.).
- Лечение мышечного гипертонуса и мышечных спазмов, сопровождающих заболевания опорно-двигательного аппарата (напр. спондилёз, спондилоартрит, цервикальные и люмбальные синдромы, артрозы крупных суставов).
- Восстановительное лечение после оперативных вмешательств в ортопедии и травматологии.
- Лечение облитерирующих заболеваний сосудов, а также синдромов, возникающих вследствие нарушения иннервации сосудов (например, акроцианоз, интермиттирующая ангионевротическая дисбазия).
- Специфическими показаниями в педиатрической практике являются болезнь Литтла и другие энцефалопатии, сопровождающиеся мышечной дистонией.

#### **Способ применения и дозы**

Лекарственное средство следует применять после еды, запивая стаканом воды. Не рекомендуется принимать лекарственное средство натощак, так как недостаточное количество пищи может снижать биодоступность толперизона.

*Взрослые:* средняя суточная доза в зависимости от индивидуальной потребности и переносимости лекарственного средства пациентом составляет 150-450 мг, разделенная на 3 приема.

#### *Дети*

Лекарственное средство назначается детям с массой тела более 30 кг (старше 10 лет) в суточной дозе 2-4 мг/кг массы тела, в три приёма.

Учитывая невысокие суточные дозы, при лечении детей рекомендуется применять таблетки Толперизон-ЛФ 50 мг, покрытые оболочкой. Т.к. таблетки не предназначены для деления на части, лекарственное средство следует назначать детям с массой тела 30 кг и более.

#### *Особые группы пациентов*

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

Данные о применении у пациентов с нарушением функции почек ограничены. Наблюдалась более высокая частота развития побочных реакций в данной группе пациентов. Пациентам с умеренным нарушением функции почек необходимо титровать дозу и тщательно наблюдать. Не рекомендуют применение толперизона у пациентов с тяжелым нарушением функции почек.

##### *Пациенты с нарушением функции печени*

Данные применения у пациентов с нарушением функции печени ограничены. Наблюдалась более высокая частота развития побочных реакций в данной группе пациентов. Пациентам с умеренным нарушением функции печени необходимо титровать дозу и тщательно наблюдать. Не рекомендуют применение толперизона у пациентов с тяжелым нарушением функции печени.

#### *Дети*

Данные по безопасности и эффективности применения толперизона у детей ограничены.

#### **Побочное действие**

Профиль безопасности толперизон содержащих лекарственных средств, подтверждается данными применения более, чем 12000 пациентами. Согласно этим данным, наиболее часто описаны нарушения со стороны кожи и подкожных тканей, общие неврологические и желудочно-кишечные расстройства.

В пострегистрационном периоде количество полученных сообщений о развитии реакций

гиперчувствительности, связанных с применением толперизона, составляло около 50-60 % от числа всех полученных сообщений. В большинстве случаев это были несерьезные побочные реакции. Об угрожающих жизни аллергических реакциях сообщалось очень редко.

Указанную ниже частоту нежелательных реакций определяли, используя следующее примечание: нечасто ( $\geq 1/1000$  -  $< 1/100$ ), редко ( $\geq 1/10000$  -  $< 1/1000$ ), очень редко ( $< 1/10000$ ).

*Нарушения со стороны крови и лимфатической системы:* очень редко – анемия, лимфаденопатия.

*Нарушения со стороны иммунной системы:* редко – реакция гиперчувствительности\*, анафилактическая реакция; очень редко – анафилактический шок.

*Нарушения питания и обмена веществ:* 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, судороги, гипестезия, парестезия, летаргия (повышенная сонливость).

*Нарушения со стороны органа зрения:* редко – нарушения зрения.

*Нарушения со стороны органов слуха и равновесия:* редко – шум в ушах, головокружение.

*Нарушения со стороны сердца:* редко – стенокардия, тахикардия, ощущение сердцебиения; очень редко – брадикардия.

*Нарушения со стороны сосудов:* нечасто – артериальная гипотензия; редко – гиперемия кожи.

*Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:* редко – диспноэ, носовое кровотечение, тахипноэ.

*Нарушения со стороны пищеварительной системы:* нечасто – дискомфорт в животе, диарея, сухость во рту, диспепсия, тошнота; редко – боль в эпигастрии, запор, метеоризм, рвота.

*Нарушения со стороны гепатобилиарной системы:* редко – легкие нарушения со стороны печени.

*Нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки:* редко – аллергический дерматит, усиленная потливость, зуд, крапивница, высыпания.

*Нарушения со стороны мочевыделительной системы:* редко – энурез, протеинурия.

*Нарушения со стороны костно-мышечной системы и соединительной ткани:* нечасто – мышечная слабость, миалгия, боль в конечностях; редко – дискомфорт в конечностях; очень редко – остеопения.

*Системные нарушения и осложнения в месте введения:* нечасто – астения, недомогание, утомляемость; редко – ощущение опьянения, ощущение жара, раздражительность, жажда; очень редко – дискомфорт в грудной клетке.

*Отклонения от нормы, выявленные в лабораторных исследованиях:* редко – снижение артериального давления, повышение концентрации билирубина крови, изменение активности печеночных ферментов, снижение числа тромбоцитов, повышение числа лейкоцитов; очень редко – повышение содержания креатинина в крови.

\*По данным постмаркетингового применения лекарственных средств, содержащих толперизон, получены сообщения о случаях развития ангионевротического отека (включая отек лица и губ).

В случае возникновения нежелательных реакций, в том числе не указанных в данной инструкции, необходимо немедленно обратиться к врачу.

### **Противопоказания**

– Повышенная чувствительность к толперизону или другим аналогичным химическим веществам (эперизон), а также к вспомогательным веществам.

– Миастения.

– Период грудного вскармливания.

### **Передозировка**

Симптомы передозировки включают сонливость, нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта (тошнота, рвота, боль в эпигастриальной области), тахикардию, гипертонию, брадикардию и головокружение. Были зарегистрированы тяжелые случаи судорог и комы.

Толперизон не имеет специфического антидота. В случае передозировки рекомендуется

симптоматическое и поддерживающее лечение.

### **Меры предосторожности**

Это лекарственное средство содержит лактозы моногидрат. Пациентам с редкой наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы Лаппа или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать данное лекарственное средство.

#### *Реакции гиперчувствительности*

В пострегистрационный период при применении лекарственных средств, содержащих толперизон, наиболее часто сообщалось о развитии реакций гиперчувствительности.

Аллергические реакции варьировали от легких кожных реакций до тяжелых системных реакций, включая анафилактический шок. Симптомы аллергической реакции: покраснение кожи, сыпь, крапивница, зуд, ангионевротический отек (отёк Квинке), тахикардия, гипотензия и одышка.

Пациенты женского пола с реакциями гиперчувствительности к другим лекарственным средствам или аллергическими реакциями в анамнезе подвержены более высокому риску.

В случае известной гиперчувствительности к лидокаину следует соблюдать повышенную осторожность во время применения толперизона из-за возможных перекрестных реакций.

Пациентам следует рекомендовать быть внимательными в отношении любых симптомов повышенной чувствительности. Если симптомы развились, следует немедленно прекратить приём толперизона и немедленно обратиться к врачу. Не следует повторно назначать толперизон после эпизода гиперчувствительности к толперизону.

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

Исследования фармакокинетического взаимодействия лекарственных средств с маркерным субстратом CYP2D6 декстрометорфаном показали, что одновременное применение толперизона может повысить уровень содержания в крови лекарственных средств, которые метаболизируются преимущественно CYP2D6 (тиоридазин, толтеродин, венлафаксин, атомоксетин, дезипрамин, декстрометорфан, метопролол, небиволол, перфеназин).

Лабораторные эксперименты на микросомах печени человека и человеческих гепатоцитах не вызвали значительного ингибирования или индукции других изоферментов CYP (CYP2B6, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP1A2, CYP3A4).

Не предполагают повышение воздействия толперизона при одновременном применении субстратов CYP2D6 и/или других лекарственных средств в связи с разнообразием метаболических путей толперизона.

Биодоступность толперизона понижается, если принимать его натощак.

Хотя толперизон является лекарственным средством центрального действия, седативный эффект его очень низкий. В случае одновременного назначения с другими миорелаксантами центрального действия, дозу толперизона следует снижать.

Толперизон усиливает действие нифлумовой кислоты, поэтому при одновременном применении следует рассматривать снижение дозы нифлумовой кислоты или других нестероидных противовоспалительных средств.

В случае одновременного приема других лекарственных средств необходимо проконсультироваться с врачом.

### **Применение во время беременности и в период кормления грудью**

#### *Беременность*

В экспериментальных исследованиях на животных не выявлено тератогенного действия толперизона. По причине отсутствия значимых клинических данных, лекарственное средство Толперизон-ЛФ не следует применять при беременности (особенно в первом триместре) за исключением случаев, когда ожидаемая польза определенно оправдывает потенциальный риск для плода.

#### *Период кормления грудью*

Поскольку данных о выделении толперизона с грудным молоком нет, то применение лекарственного средства Толперизон-ЛФ противопоказано при кормлении грудью.

**Влияние на способность к управлению транспортными средствами или потенциально**

**опасными механизмами**

Возможно развитие таких симптомов, как головокружение, сонливость, нарушение внимания, судороги, нарушение зрения или мышечная слабость.

Пациенты, у которых наблюдались головокружение, сонливость, нарушение внимания, судороги, нарушения зрения или мышечная слабость во время приема лекарственного средства, должны обратиться к врачу!

**Условия хранения**

В защищенном от влаги и света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

**Срок годности**

2 года.

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

**Упаковка**

По 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой. По три контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению в пачке из картона.

**Условия отпуска**

По рецепту.

**Информация о производителе**

СООО "Лекфарм", Республика Беларусь, ул. Минская, д. 2а, 223141, г. Логойск,  
тел/факс: +375 1774 53 801, [www.lekpharm.by](http://www.lekpharm.by)