

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения
ТИЗАЛУД

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Тизалуд

Международное непатентованное название: тизанидин

Лекарственная форма: таблетки

Состав на одну таблетку

Активное вещество: Тизанидина гидрохлорид – 2,288 мг и 4,576 мг в пересчете на тизанидин – 2,0 мг и 4,0 мг;

Вспомогательные вещества: [Лактоза безводная (лактопресс) 117,012 мг и 234,024 мг, Целлюлоза микрокристаллическая 14,0 мг и 28,0 мг, Карбоксиметилкрахмал натрия (примогель) 4,2 мг и 8,4 мг, Магния стеарат 2,5 мг и 5,0 мг].

Масса таблетки 140,0 мг и 280,0 мг.

Описание

Таблетки белого или белого с желтоватым оттенком цвета, круглые, двояковыпуклые с риской.

Фармакотерапевтическая группа: миорелаксант центрального действия.

Код АТХ: M03BX02

Фармакологические свойства

Фармакологическое действие:

Миорелаксант центрального действия. Основная точка приложения находится в спинном мозге. Стимулируя пресинаптические альфа₂-адренорецепторы, тизанидин подавляет выделение возбуждающих аминокислот из промежуточных нейронов спинного мозга, что приводит к угнетению полисинаптической передачи возбуждения в спинном мозге. Вследствие этого происходит снижение мышечного тонуса. В дополнение к миорелаксирующим свойствам тизанидин оказывает также центральный умеренно выраженный анальгезирующий эффект.

Эффективен в отношении острых болезненных мышечных спазмов и хронических спазмов спинального и церебрального происхождения. Уменьшает спастичность и клонические судороги, вследствие чего снижает сопротивление пассивным движениям и увеличивается объем активных движений.

Фармакокинетика:

Абсорбция – высокая; время достижения максимальной плазменной концентрации ($T_{C_{max}}$) – 1-2 ч. Биодоступность – 34 %. Прием пищи не влияет на фармакокинетику. Объем распределения – 2.6 л/кг. Связь с белками плазмы – 30 %. В диапазоне доз от 4 до 20 мг фармакокинетика имеет линейный характер. Метаболизируется быстро и в значительной степени в печени (95 %) с образованием неактивных метаболитов. Период полувыведения ($T_{1/2}$) – 2-4 ч. Выводится преимущественно почками (70 % дозы в виде метаболитов, 2.7 % – в неизменном виде). У больных с почечной недостаточностью (КК менее 25 мл/мин) максимальная концентрация в плазме крови (C_{max}) возрастает в 2 раза, $T_{1/2}$ – 14 ч, площадь под фармакокинетической кривой «концентрация-время» (AUC) возрастает в 6 раз.

Показания

- Болезненный мышечный спазм, связанный со статическими и функциональными заболеваниями позвоночника (шейный и поясничный синдромы), а также после хирургических вмешательств (например, по поводу грыжи межпозвоночного диска или остеоартроза тазобедренного сустава);
- Спастичность скелетных мышц при неврологических заболеваниях (например, при рассеянном склерозе, хронической миелопатии, дегенеративных заболеваниях спинного мозга, последствиях нарушения мозгового кровообращения, а также при детском церебральном параличе/пациенты старше 18 лет/).

Противопоказания

- выраженное нарушение функции печени;
- одновременное применение с сильными ингибиторами изоферментов CYP1A2 (в т.ч. флувоксамин, ципрофлоксацин);
- повышенная чувствительность к тизанидину, другим компонентам препарата;
- редкая наследственная непереносимость лактозы, тяжелая недостаточность лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (для данной лекарственной формы, содержащей лактозу);

Применение тизанидина у детей (до 18 лет) не рекомендуется, т.к. опыт применения препарата у данной категории пациентов ограничен.

С осторожностью: почечная недостаточность, артериальная гипотензия, брадикардия, одновременный прием пероральных контрацептивов, возраст старше 65 лет.

Беременность и лактация

Поскольку контролируемые исследования применения тизанидина у беременных женщин не проводились, его не следует применять при беременности, за исключением тех случаев, когда ожидаемая польза для матери превышает возможный риск для плода.

Тизанидин выделяется с грудным молоком в незначительных количествах. Тем не менее, при необходимости применения тизанидина в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Способ применения и дозы

Купирование болезненного мышечного спазма: внутрь, по 2-4 мг 3 раза в день, в тяжелых случаях – дополнительно на ночь 2-4 мг.

Лечение спастичности, обусловленной неврологическими заболеваниями: начальная доза – 2 мг 3 раза в день, затем дозу постепенно увеличивают на 2-4 мг с интервалами в

3-7 дней. Оптимальная суточная доза – 12-24 мг в 3-4 приема; максимальная суточная доза – 36 мг.

Пациентам с почечной недостаточностью (при КК менее 25 мл/мин) рекомендуемая начальная доза - 2 мг 1 раз в сутки. Повышение дозы проводят постепенно, медленно, с учетом переносимости и эффективности. Если необходимо получить более выраженный эффект, рекомендуется сначала увеличить дозу, назначаемую 1 раз в сутки, затем увеличивают кратность назначения.

Побочные эффекты:

Со стороны нервной системы: сонливость, головокружение, галлюцинации, бессонница, нарушение сна.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: брадикардия, снижение артериального давления (в отдельных случаях выраженное, вплоть до коллапса и потери сознания).

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, тошнота, диспепсия, повышение активности «печеночных» трансаминаз, гепатит, печеночная недостаточность.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: мышечная слабость.

Прочие: повышенная утомляемость, гиперкреатининемия.

При резкой отмене после продолжительного лечения и/или приема высоких доз препарата (а также после одновременного применения вместе с гипотензивными Лекарственными средствами): тахикардия, повышение артериального давления, в отдельных случаях – острое нарушение мозгового кровообращения.

Передозировка

Симптомы: тошнота, рвота, выраженное снижение АД, головокружение, сонливость, миоз, тревожность, нарушение дыхания, кома.

Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля, проведение форсированного диуреза, симптоматическая терапия.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Одновременное применение тизанидина с флувоксамином или ципрофлоксацином, ингибиторами изофермента 1A2 цитохрома P450, приводит к 33-кратному увеличению АУС тизанидина. Результатом сочетанного применения может оказаться клинически значимое и продолжительное снижение АД, приводящее к сонливости, слабости, заторможенным психомоторным реакциям (в отдельных случаях вплоть до коллапса и потери сознания).

Не рекомендуется одновременное применение тизанидина с другими ингибиторами изофермента CYP1A2 – антиаритмическими препаратами (амиодарон, мексилетин, пропafenон), циметидином, фторхинолонами (эноксацин, пefлоксацин, норфлоксацин), рофекоксибом, пероральными контрацептивами, тиклопидином.

Антигипертензивные лекарственные средства (ЛС) повышают риск выраженного снижения АД и брадикардии.

Этанол, седативные ЛС могут усилить седативное действие тизанидина, поэтому не рекомендуется одновременное применение с другими седативными препаратами и/или алкоголем.

Особые указания

Рекомендуется контролировать функцию печени 1 раз в месяц первые 4 месяца лечения, у тех пациентов, которым назначается тизанидин в суточной дозе 12 мг и выше, а также в тех случаях, когда наблюдаются клинические признаки, позволяющие предположить нарушение функции печени, такие как необъяснимая тошнота, анорексия, чувство усталости. В случае, когда активность аспартатаминотрансферазы (АСТ) и аланинаминотрансферазы (АЛТ) стойко превышает верхнюю границу нормы в 3 раза и более, прием тизанидина прекращают.

Пациентам с синдромом врожденного удлинения интервала Q-T тизанидин следует назначать с осторожностью, т.к. в доклинических исследованиях хронической токсичности у животных (собаки) отмечено удлинение интервала Q-T при применении препарата в дозе, эквивалентной максимальной дозе для человека.

Из-за угрозы синдрома «отмены» дозу тизанидина снижают постепенно.

Во время лечения следует соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки по 2 мг и 4 мг. По 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 30 таблеток в банке из полимерных материалов с винтовой горловиной и крышкой навинчиваемой из полипропилена и полиэтилена низкого давления.

Каждая банка или 3 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению в пачке из картона.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель: АО «ВЕРОФАРМ»

Юридический адрес: Россия, 107023, г. Москва, Барабанный пер., д. 3.

Адрес производства и принятия претензий: Россия, 308013, г. Белгород, ул. Рабочая, д. 14.

Тел.: (4722) 21-32-26; факс: (4722) 21-34-71.