Инструкция по применению
Сирдалуд МР Капсулы 6 мг 30 шт

Характеристики

Форма выпуска: Капсулы
Страна: Турция
Производитель: Сандоз
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Тизанидин
Количество в упаковке: 30
Дозировка действующего вещества: 6 мг
Срок годности: 36.0



Действующее вещество

Тизанидин

Состав

1 капс. тизанидина гидрохлорид 6.864 мг, что соответствует содержанию тизанидина 6 мг. Вспомогательные вещества: этилцеллюлоза - 1 мг, шеллак - 4 мг, тальк - 18.

Форма выпуска

Капсулы

Фармакокинетика

Всасывание: При приеме внутрь тизанидин всасывается почти полностью. После однократного применения препарата Сирдалуд МР в дозе 12 мг среднее значение Cmax достигается в течение 8.5 ч и составляет 6.6 нг/мл, что соответствует приблизительно половине величины Cmax при приеме таблеток тизанидина в аналогичной суточной дозе, разделенной на 3 приема (по 4 мг 3 раза/сут), при этом суммарная суточная AUC остается неизмененной. Распределение: Длительное высвобождение тизанидина из лекарственной формы капсулы с модифицированным высвобождением обуславливает "смягченный" фармакокинетический профиль, что обеспечивает поддержание стабильной терапевтической концентрации тизанидина в плазме крови в течение 24 ч. Связывание с белками плазмы составляет 30%. Среднее значение Vd в равновесном состоянии после в/в введения составляет 2.6 л/кг. Метаболизм: Тизанидин быстро и в значительной степени (более 95%) метаболизируется в печени. In vitro было показано, что тизанидин в основном метаболизируется изоферментом CYP1A2. Метаболиты неактивны. Выведение: Тизанидин выводится преимущественно почками (приблизительно 70%) в виде метаболитов; на долю неизмененного вещества приходится около 4.5%. Фармакокинетика в особых клинических случаях У пациентов с нарушением функции почек (КК ≤ 25 мл/мин) среднее значение Cmax тизанидина в плазме в 2 раза выше, чем у здоровых добровольцев, T1/2 достигает 14 ч, что приводит к повышению (примерно в 6 раз) системной биодоступности тизанидина (измеренной по значению AUC). У пациентов с нарушениями функции печени специальных исследований не проводилось. Т.к. тизанидин интенсивно метаболизируется в печени изоферментом CYP1A2, нарушение функции печени может приводить к повышению системного воздействия тизанидина. Данные по фармакокинетике у пациентов в возрасте старше 65 лет ограничены. Пол не оказывает влияния на фармакокинетические свойства тизанидина. Влияние этнической и расовой принадлежности на фармакокинетику тизанидина не изучалось. Одновременный прием пищи не влияет на фармакокинетику тизанидина. Хотя Cmax возрастает на 1/3, когда прием таблетки происходит после еды, считается, что это не является клинически значимым. Существенного влияния на всасывание (AUC) не отмечается.

Показания

— спастичность скелетных мышц при неврологических заболеваниях (например, при рассеянном склерозе, хронической миелопатии, дегенеративных заболеваниях спинного мозга, последствиях нарушений мозгового кровообращения и детского церебрального паралича /пациенты старше 18 лет/).

Способ применения и дозы

Препарат назначают внутрь. Способ применения и дозы следует устанавливать индивидуально, поскольку тизанидин имеет узкий терапевтический диапазон и высокую вариабельность концентраций в плазме крови. Рекомендуемая начальная доза составляет 6 мг (1 капс.) в сут. При необходимости суточную дозу можно постепенно ("шагами") увеличивать - на 6 мг (1 капс.) с интервалами 3-7 дней. Обычно диапазон доз составляет от 6 мг до 24 мг 1 раз/сут. Клинический опыт показывает, что для большинства пациентов оптимальная доза составляет 12 мг/сут (2 капс.); в редких случаях может потребоваться увеличение суточной дозы до 24 мг. Опыт применения препарата Сирдалуд МР у пациентов в возрасте старше 65 лет ограничен. Рекомендуется начинать терапию с минимальной дозы с постепенным повышением до достижения оптимального соотношения переносимости и эффективности терапии. Лечение пациентов с почечной недостаточностью (КК меньше 25 мл/мин) возможно только в тех случаях, когда ранее была оттитрована оптимальная доза при применении других лекарственных форм тизанидина. Повышение дозы проводят малыми "шагами", с учетом переносимости и эффективности. Если необходимо получить более выраженный эффект, рекомендуется сначала увеличить дозу, назначаемую 1 раз/сут, после чего увеличивают кратность назначения. У пациентов с умеренно выраженным нарушением функции печени препарат следует применять с осторожностью. Рекомендуется начинать терапию с минимальной дозы, с постепенным повышением до достижения оптимального соотношения переносимости и эффективности терапии. Прерывание лечения При прекращении терапии препаратом Сирдалуд МР, с целью уменьшения риска развития рикошетного повышения АД и ЧСС следует медленно снижать дозу до полной отмены препарата, особенно у пациентов, получающих высокие дозы препарата в течение длительного времени.

Противопоказания

— тяжелые нарушения функции печени — одновременное применение с сильными ингибиторами изоферментов CYP1A2 (в т.ч. флувоксамин или ципрофлоксацин) — повышенная чувствительность к компонентам препарата. Применение Сирдалуда МР у детей и подростков в возрасте до 18 лет не рекомендуется, т.к. опыт применения препарата у этой категории пациентов ограничен. С осторожностью рекомендуется применять препарата у пациентов старше 65 лет, пациентов с нарушением функции почек, пациентов с умеренно выраженными нарушениями функции печени, с синдромом врожденного удлинения интервала QT, одновременно с пероральными контрацептивными препаратами, у пациентов пожилого возраста.

Применение при беременности и кормлении грудью

Поскольку контролируемые исследования применения тизанидина у беременных женщин не проводились, его не следует применять при беременности, за исключением тех случаев, когда потенциальная польза превышает возможный риск. Неизвестно, выделяется ли тизанидин с грудным молоком у женщин. Поэтому при необходимости применения препарата в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Побочные действия

Нежелательные реакции распределены в соответствии с частотой возникновения. Для оценки частоты развития нежелательных реакций использованы следующие критерии: очень часто (1/10), часто (1/100, меньше 1/10), нечасто (1/1000, меньше1/100), редко (1/10 000, меньше1/1000), очень редко (меньше 1/10 000). Со стороны нервной системы: очень часто - сонливость, головокружение. Со стороны психики: часто - бессонница, нарушения сна. Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - снижение АД; нечасто - брадикардия; в отдельных случаях - выраженное снижение АД вплоть до коллапса и потери сознания. Со стороны пищеварительной системы: очень часто - желудочно-кишечные расстройства, сухость во рту; часто - повышение активности печеночных трансаминаз; редко - тошнота. Со стороны костно-мышечной системы: очень часто - мышечная слабость. Прочие: часто - повышенная утомляемость. При приеме в малых дозах, рекомендуемых для купирования болезненного мышечного спазма, отмечались сонливость, повышенная утомляемость, головокружение, сухость во рту, снижение АД, тошнота, желудочно-кишечные расстройства, повышение активности печеночных трансаминаз. Обычно вышеописанные реакции умеренно выражены и преходящи. При приеме в более высоких дозах, рекомендуемых для лечения спастичности, вышеперечисленные побочные реакции возникают чаще и более выражены, однако они редко бывают настолько тяжелыми, чтобы лечение пришлось прервать. Кроме того могут возникать следующие явления: снижение АД, брадикардия, мышечная слабость, бессонница, нарушение сна, галлюцинации, гепатит. При резкой отмене препарата Сирдалуд МР после продолжительного лечения и/или приема препарата в высоких дозах (а также после одновременного применения вместе с гипотензивными препаратами) отмечалось развитие тахикардии и повышения АД, что в отдельных случаях приводит к острому нарушению мозгового кровообращения, поэтому дозу препарата Сирдалуд МР следует снижать постепенно до полной отмены препарата. Отдельные сообщения о побочных реакциях по данным постмаркетингового применения На фоне терапии препаратом Сирдалуд МР в клинической практике отмечались следующие побочные реакции без указаний на причинно-следственную связь с применением препарата (частота побочных реакций не установлена): Со стороны психики: частота неизвестна - галлюцинации, спутанность сознания. Со стороны нервной системы: частота неизвестна - вертиго. Со стороны органа зрения: частота неизвестна - затуманивание зрения. Со стороны печени и желчевыводящих путей: частота неизвестна - гепатит, печеночная недостаточность. Общие нарушения: частота неизвестна - астения, синдром "отмены". При резкой отмене препарата Сирдалуд МР были отмечены случаи рикошетного повышения АД и тахикардии, в отдельных случаях рикошетное повышение АД приводило к острому нарушению мозгового кровообращения. Если любые из указанных выше побочных эффектов усугубляются, или пациент заметил любые другие побочные эффекты, он должен сообщить об этом врачу.

Передозировка

К настоящему времени получено несколько сообщений о передозировке тизанидина, включая случай, когда принятая доза составила 400 мг. Симптомы: тошнота, рвота, снижение АД, удлинение интервала QTc, головокружение, сонливость, миоз, беспокойство, нарушение дыхания, кома. Лечение: для выведения препарата из организма рекомендуется многократное промывание желудка и назначение активированного угля. Форсированный диурез также, возможно, ускорит выведение тизанидина. В дальнейшем проводят симптоматическую терапию.

Взаимодействие с другими препаратами

При применении Сирдалуда МР вместе с ингибиторами изофермента CYP1A2 возможно повышение концентрации тизанидина в плазме крови. В свою очередь, повышение концентрации тизанидина в плазме может приводить к симптомам передозировки, в т.ч. к удлинению интервала QTc. Совместное применение препарата Сирдалуд МР с индукторами изофермента CYP1A2 может приводить к снижению концентрации тизанидина в плазме. Сниженная концентрация тизанидина в плазме может приводить к снижению терапевтического эффекта препарата Сирдалуд МР. Противопоказанные комбинации препарата Сирдалуд МР Одновременное применение тизанидина с флувоксамином или ципрофлоксацином, ингибиторами изофермента CYP1A2, противопоказано. При применении препарата Сирдалуд МР с флувоксамином или ципрофлоксацином отмечается соответственно 33-кратное и 10-кратное увеличение AUC тизанидина соответственно. Результатом сочетанного применения может оказаться клинически значимое и продолжительное снижение АД, сопровождающееся сонливостью, головокружением, снижением скорости психомоторных реакций (в отдельных случаях вплоть до коллапса и потери сознания). Нерекомендованные комбинации Не рекомендуется назначать тизанидин совместно с другими ингибиторами изофермента CYP1A2 - антиаритмическими средствами (амиодарон, мексилетин, пропафенон), циметидином, некоторыми фторхинолонами (эноксацин, пефлоксацин, норфлоксацин), рофекоксибом, пероральными контрацептивными средствами, тиклонидином. Комбинации, требующие соблюдения осторожности Необходимо соблюдать осторожность при совместном применении препарата Сирдалуд МР с препаратами, удлиняющими интервал QT (например, цизаприд, амитриптилин, азитромицин). Одновременное применение препарата Сирдалуд МР с гипотензивными препаратами, включая диуретические средства, иногда может вызывать снижение АД (в отдельных случаях вплоть до коллапса и потери сознания) и брадикардию. При резкой отмене препарата Сирдалуд МР после применения вместе с гипотензивными препаратами отмечалось развитие тахикардии и повышение АД, в отдельных случаях приводящее к острому нарушению мозгового

кровообращения. Одновременный прием препарата Сирдалуд МР и рифампицина приводит к снижению концентрации тизаиидина в плазме крови на 50%. Вследствие этого возможно уменьшение терапевтического действия препарата Сирдалуд МР, что может иметь клиническое значение для некоторых больных. Следует избегать длительного совместного применения рифампицина и тизанидина; если данная комбинация является необходимой, то рекомендуется тщательный подбор дозы тизанидина (в сторону увеличения). Другие лекарственные средства. Седативные, снотворные препараты (бензодиазепин, баклофен), а также блокаторы гистаминовых Н1-рецепторов, могут также усиливать седативный эффект тизанидина. Следует избегать приема препарата Сирдалуд МР с другими альфа2-адреномиметиками (например, с клонидином) вследствие потенциального усиления гипотензивного эффекта. Курение. Системная биодоступность препарата Сирдалуд МР у курящих мужчин (более 10 сигарет в день) снижена примерно на 30%. Длительная терапия препаратом Сирдалуд МР курящих мужчин может требовать более высоких доз, чем средние терапевтические. Алкоголь. Во время терапии препаратом Сирдалуд МР пациенты должны избегать употребления алкоголя, т.к. он может повышать вероятность развития нежелательных явлений (например, снижения АД и заторможенности). Сирдалуд МР может усиливать угнетающее действие алкоголя на ЦНС.

Особые указания

При применении препарата Сирдалуд МР возможно снижение АД, а также как результат лекарственного взаимодействия с ингибиторами изофермента CYP1A2 и /или антигипертензивными препаратами. Выраженное снижение АД может приводить к потере сознания и коллапсу. Сирдалуд МР обладает седативным эффектом, может вызывать галлюцинации. Сообщалось о случаях нарушений функции печени, связанных с тизанидином, однако при применении суточной дозы до 12 мг эти случаи отмечались редко. В связи с этим рекомендуется контролировать функциональные печеночные пробы 1 раз в месяц в 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 тошнота, анорексия, чувство усталости. В случае, когда уровни АЛТ и АСТ в сыворотке стойко превышают ВГН в 3 раза и более, применение Сирдалуда МР следует прекратить. Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами Пациентам, у которых на фоне применения препарата отмечается сонливость, следует рекомендовать воздержаться от видов деятельности, требующих высокой концентрации внимания и быстрой реакции, например, вождения транспортных средств или работы с машинами и механизмами.

Условия хранения

В сухом месте