Инструкция по применению
Сирдалуд Таблетки 2 мг 30 шт

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: Новартис Нева
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Тизанидин
Количество в упаковке: 30
Дозировка действующего вещества: 2 мг
Срок годности: 60

Действующее вещество

Тизанидин

Состав

Тизанидина гидрохлорид 2.288 мг, что соответствует содержанию тизанидина 2 мг
Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный безводный - 0.3 мг, стеариновая кислота - 3 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 74.412 мг, лактозы моногидрат - 80 мг.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Всасывание Тизанидин всасывается быстро и почти полностью. Cmax в плазме достигается примерно через 1 ч после приема препарата. По причине выраженного метаболизма при "первом прохождении" через печень среднее значение биодоступности составляет около 34%. Cmax тизанидина составляет 12.3 нг/мл и 15.6 нг/мл после однократного и многократного приема тизанидина в дозе 4 мг, соответственно. Одновременный прием пищи не влияет на фармакокинетику тизанидина. Хотя значение Cmax возрастает на 1/3, когда таблетку принимают после еды, считается, что это не является клинически значимым. Существенного влияния на всасывание (AUC) не отмечается. Тизанидин в диапазоне доз от 1 мг до 20 мг обладает линейной фармакокинетикой. Распределение Связывание с белками плазмы составляет 30%. Метаболизм Тизанидин быстро и в значительной степени (около 95%) метаболизируется в печени. In vitro было показано, что тизанидин в основном метаболизируется изоферментом 1A2 системы цитохрома P450. Метаболиты неактивны. Выведение Среднее значение T1/2 тизанидина из системного кровотока составляет 2-4 ч. Препарат выводится преимущественно почками (приблизительно 70% дозы) в виде метаболитов; на долю неизмененного вещества приходится лишь около 4.5%. Фармакокинетика в особых клинических случаях У больных с почечной недостаточностью (клиренс креатинина ⩽ 25 мл/мин) средняя Cmax препарата в плазме в 2 раза выше, чем у здоровых добровольцев, а конечный T1/2 достигает 14 ч, что приводит к увеличенной (примерно в 6 раз) системной биодоступности тизанидина (измеренной по AUC)/ Специфических исследований у пациентов с нарушением функции печени проведено не было. Тизанидин преимущественно метаболизируется в печени, цитохромом CYP1A2, следовательно, нарушение функции печени может приводить к повышению системного воздействия препарата. Данные по фармакокинетике у пациентов старше 65 лет ограничены. Пол не оказывает влияния на фармакокинетические свойства тизанидина. Влияние этнической и расовой принадлежности на фармакокинетику тизанидина не изучалось.

Показания

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

Способ применения и дозы

Сирдалуд обладает узким терапевтическим индексом и высокой вариабельностью концентрации тизанидина в плазме крови пациентов, поэтому необходим тщательный подбор дозы. Начальная доза 2 мг 3 раза/сут способна минимизировать риск развития побочных реакций. Дозу следует тщательно подбирать с учетом индивидуальных потребностей пациента. Препарат назначают внутрь. Режим дозирования следует подбирать индивидуально. При болезненном мышечном спазме обычно назначают по 2 мг или 4 мг 3 раза/сут. В тяжелых случаях можно дополнительно принять 2 мг или 4 мг (предпочтительно перед сном из-за возможного усиления сонливости). Таблетки 2 мг и 4 мг можно разделить на две равные части. При спастичности скелетных мышц, обусловленной неврологическими заболеваниями начальная суточная доза не должна превышать 6 мг, разделенных на 3 приема. Дозу следует повышать постепенно, на 2-4 мг, с интервалами от 3-4 до 7 дней. Обычно оптимальный терапевтический эффект достигается при суточной дозе от 12 до 24 мг, разделенной на 3 или 4 приема через равные промежутки времени. Не следует превышать дозу 36 мг/сут. Опыт применения препарата Сирдалуд у пациентов в возрасте 65 лет и старше ограничен. Рекомендуется начинать терапию с минимальной дозы с постепенным повышением до достижения оптимального соотношения переносимости и эффективности терапии. Лечение пациентов с почечной недостаточностью (КК менее 25 мл/мин) рекомендуется начинать с дозы 2 мг 1 раз/сут. 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 этого увеличивают кратность назначения. Применение препарата Сирдалуд у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени противопоказано. У пациентов с умеренно выраженным нарушением функции печени препарат следует применять с осторожностью; рекомендовано начинать терапию с минимальной дозы, с постепенным повышением до достижения оптимального соотношения переносимости и эффективности терапии. Прерывание лечения При прекращении терапии препаратом Сирдалуд с целью уменьшения риска развития рикошетного повышения АД и тахикардии следует медленно снижать дозу до полной отмены препарата, в особенности у пациентов, получающих высокие дозы препарата в течение длительного времени.

Противопоказания

— тяжелые нарушения функции печени; — одновременное применение с сильными ингибиторами цитохрома P450 1A2 (CYP1A2), такими как флувоксамин или ципрофлоксацин; — повышенная чувствительность к тизанидину или к любому другому компоненту препарата. Опыт применения препарата у пациентов младше 18 лет ограничен. Применение препарата Сирдалуд у данной категории пациентов не рекомендуется. С осторожностью рекомендуется применять препарат у пациентов старше 65 лет, пациентов с нарушением функции почек, пациентов с умеренно выраженными нарушениями функции печени.

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. Сирдалуд не следует применять в период лактации (грудного вскармливания), т.к. нет данных о проникновении тизанидина в грудное молоко.

Побочные действия

Побочные реакции распределены в соответствии с частотой возникновения: очень часто (1/10); часто (1/100, <1/10); нечасто (1/1000, <1/100); редко (1/10 000, <1/1000); очень редко (<1/10 000, включая отдельные сообщения). Со стороны нервной системы: очень часто - сонливость, головокружение. Со стороны психики: часто - бессонница, нарушения сна. Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - снижение АД (в отдельных случаях выраженное, вплоть до коллапса и потери сознания); нечасто - брадикардия. Со стороны пищеварительной системы: очень часто - сухость во рту, желудочно-кишечные расстройства; часто - тошнота. Со стороны костно-мышечной системы: очень часто - мышечная слабость. Общие расстройства: очень часто - повышенная утомляемость. Лабораторные показатели: часто - повышение активности печеночных трансаминаз. При приеме препарата в малых дозах, рекомендуемых для купирования болезненного мышечного спазма, отмечались сонливость, утомляемость, головокружение, сухость во рту, снижение АД, тошнота, желудочно-кишечные расстройства, повышение активности печеночных трансаминаз. Обычно вышеописанные побочные 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 следовало прервать. Кроме того, могут возникать следующие явления: снижение АД, брадикардия, мышечная слабость, бессонница, нарушения сна, галлюцинации, гепатит. При резкой отмене препарата Сирдалуд после продолжительного лечения и/или приема высоких доз препарата (а также после одновременного применения вместе с гипотензивными препаратами) отмечалось развитие тахикардии и повышение АД, способное в отдельных случаях привести к острому нарушению мозгового кровообращения, поэтому дозу препарата Сирдалуд следует снижать постепенно до полной отмены препарата. Отдельные сообщения о побочных реакциях по данным применения в клинической практике На фоне терапии препаратом Сирдалуд в клинической практике отмечались следующие побочные реакции без указаний на причинно-следственную связь с применением препарата (частота нежелательных 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 расстройства и нарушения в месте введения: частота неизвестна - астения, синдром отмены. При резкой отмене препарата Сирдалуд были отмечены случаи рикошетной гипертензии и тахикардии, в отдельных случаях рикошетное повышение АД приводило к острому нарушению мозгового кровообращения. Пациент должен сообщать врачу о случаях усугубления указанных в инструкции побочных эффектов или появлении любых других побочнов эффектов, не указанных в инструкции.

Передозировка

К настоящему времени получено несколько сообщений о передозировке препарата Сирдалуд, включая случай, когда принятая доза составила 400 мг. Во всех случаях выздоровление прошло без особенностей. Симптомы: тошнота, рвота, снижение АД, удлинение интервала QTc, головокружение, сонливость, миоз, беспокойство, нарушение дыхания, кома. Лечение: для выведения препарата из организма рекомендуется многократное назначение активированного угля. Форсированный диурез также, возможно, ускорит выведение препарата Сирдалуд. В дальнейшем проводят симптоматическое лечение.

Взаимодействие с другими препаратами

При применении препарата Сирдалуд вместе с ингибиторами цитохрома CYP1A2 возможно повышение концентрации тизанидина в плазме крови. В свою очередь, повышение концентрации тизанидина в плазме может приводить к симптомам передозировки препаратом, в т.ч. удлинению интервала QTc. Совместное применение препарата Сирдалуд с индукторами CYP1A2 может приводить к снижению концентрации тизанидина в плазме. Сниженный уровень тизанидина в плазме может приводить к снижению терапевтического эффекта препарата Сирдалуд. Противопоказанные комбинации препарата Сирдалуд Одновременное применение тизанидина с флувоксамином или ципрофлоксацином, которые являются ингибиторами цитохрома CYP1A2, противопоказано. При применении препарата Сирдалуд с флувоксамином или ципрофлоксацином отмечается соответственно 33-кратное и 10-кратное увеличению 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 препарата Сирдалуд Не рекомендуется назначать тизанидин совместно с другими ингибиторами CYP1A2 - антиаритмическими препаратами (амиодарон, мексилетин, пропафенон), циметидином, некоторыми фторхинолонами (эноксацин, пефлоксацин, норфлоксацин), рофекоксибом, пероральными контрацептивами, тиклопидином. Комбинации препарата Сирдалуд, требующие соблюдения осторожности Необходимо соблюдать осторожность при совместном применении препарата Сирдалуд с препаратами, удлиняющими интервал QT (например, цизаприд, амитриптилин, азитромицин). Гипотензивные препараты Одновременное назначение препарата Сирдалуд с гипотензивными препаратами, включая мочегонные, иногда может вызывать выраженное снижение АД (в отдельных случаях вплоть до коллапса и потери сознания) и брадикардию. При резкой отмене препарата Сирдалуд после

применения вместе с гипотензивными препаратами отмечалось развитие тахикардии и повышение АД, которое в отдельных случаях может привести к острому нарушению мозгового кровообращения. Рифампицин Одновременный прием препарата Сирдалуд и рифампицина приводит к 50% снижению концентрации тизанидина в плазме крови. Вследствие этого терапевтическое действие препарата Сирдалуд может снижаться, что может иметь клиническую значимость для некоторых больных. Следует избегать длительного совместного применения рифампицина и тизанидина, при невозможности рекомендуется тщательный подбор дозы тизанидина (увеличение). Курение Системная биодоступность препарата Сирдалуд у курящих мужчин (более 10 сигарет в день) снижена примерно на 30%. Длительная терапия препаратом Сирдалуд курящих мужчин может требовать более высоких доз, чем средние терапевтические. Алкоголь Во время терапии препаратом Сирдалуд следует избегать приема алкоголя, т. к. он может повысить вероятность развития нежелательных явлений (например, снижения АД и заторможенности). Сирдалуд может усиливать подавляющее действие этанола на ЦНС. Другие лекарственные средства Седативные, снотворные препараты (бензодиазепин, баклофен) и другие препараты, такие как антигистаминиые препараты могут также усиливать седативный эффект тизанидина. Следует избегать приема препарата Сирдалуд с другими агонистами #2-адренорецепторов (например, клонидином) вследствие потенциального усиления гипотензивного эффекта.

Особые указания

Артериальная гипотензия может возникать на фоне применения препарата Сирдалуд, а также как результат лекарственного взаимодействия с ингибиторами CYP1A2 и/или антигипертензивными препаратами. Выраженное снижение АД может приводить к потере сознания и коллапсу. 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 необъяснимая тошнота, анорексия, чувство усталости. В случае, когда уровни АЛТ и АСТ в сыворотке стойко превышают ВГН в 3 раза и более, применение препарата Сирдалуд следует прекратить. Поскольку в состав таблеток препарата Сирдалуд входит лактоза, не рекомендуется применять препарат у пациентов с редкой наследственной непереносимостью галактозы, с тяжелой лактазной недостаточностью или мальабсорбцией глюкозы/галактозы. 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