Инструкция по применению
Сирдалуд Таблетки 4 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: 4 мг
Срок годности: 36.0

Действующее вещество

Тизанидин

Состав

1 таблетка содержит: действующее вещество: тизанидина гидрохлорид (в пересчете на основание) - 4,576 мг (4,000 мг); вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный, стеариновая кислота, целлюлоза микрокристаллическая, лактоза

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Всасывание Тизанидин всасывается быстро и почти полностью. Максимальная концентрация в плазме крови (Cmax) достигается примерно через 1 час после приема препарата. По причине выраженного метаболизма при «первом прохождении» через печень среднее значение биодоступности составляет около 34% (коэффициент изменчивости - 38%). Cmax тизанидина равно 12,3 нг/мл и 15,6 нг/мл после однократного и многократного приема тизанидина в дозе 4 мг соответственно. Распределение Средний объем распределения в равновесном состоянии при внутривенном введении составляет 2,6 л/кг. Связывание с белками плазмы крови составляет 30%. Метаболизм Тизанидин быстро и в значительной степени (около 95%) метаболизируется в печени. In vitro тизанидин метаболизируется в основном изоферментом CYP1A2 системы цитохрома P450. Метаболиты неактивны. Выведение Средний период полувыведения тизанидина из системного кровотока составляет 2-4 ч, выведение осуществляется преимущественно почками (приблизительно 70% дозы) в виде метаболитов; на долю неизмененного вещества приходится около 4,5% Влияние пищи Одновременный прием пищи не влияет на фармакокинетику тизанидина (при применении 4 мг в виде таблеток или 12 мг в виде капсул с модифицированным высвобождением). Несмотря на то, что значение Cmax возрастает на 1/3 при приеме после еды, это не является клинически значимым. Существенного влияния на всасывание (AUC, площадь под фармакокинетической кривой «концентрация-время») не отмечается. Тизанидин в диапазоне доз от 1 мг до 20 мг обладает линейной фармакокинетикой. Особенности фармакокинетики у отдельных групп пациентов Пациенты с нарушением функции почек У пациентов с нарушением функции почек (клиренс креатинина (КК) ? 25 мл/мин) Cmax тизанидина в плазме крови в 2 раза выше, чем у здоровых добровольцев, конечный период полувыведения достигает 14 часов, что приводит к увеличенной (примерно в 6 раз) системной биодоступности тизанидина (измеренной по AUC). Пациенты с нарушением функции печени Специальных исследований у пациентов данной категории не проводилось. Поскольку тизанидин преимущественно метаболизируется в печени изоферментом CYP1A2 системы цитохрома, нарушение функции печени может приводить к увеличению системного воздействия препарата. Пациенты старше 65 лет и старше Данные по фармакокинетике у пациентов данной группы ограничены. Зависимость от пола и расовой принадлежности 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); - 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

Препарат Сирдалуд® обладает узким терапевтическим индексом и высокой вариабельностью концентрации тизанидина в плазме крови, поэтому необходим тщательный подбор дозы. Дозу и режим дозирования следует подбирать индивидуально в зависимости от потребностей пациента. Применение препарата в начальной дозе 2 мг 3 раза в день снижает риск развития побочных эффектов. Препарат принимают внутрь. Можно принимать с едой или без. Таблетки 2 мг и 4 мг могут быть разделены на две равные части. При болезненном мышечном спазме препарат Сирдалуд® применяют, как правило, в дозе 2 мг или 4 мг 3 раза в сутки. В тяжелых случаях возможно дополнительное применение 2 мг или 4 мг (предпочтительно перед сном из-за возможного усиления сонливости). При спастичности скелетных мышц, обусловленной неврологическими заболеваниями, начальная суточная доза не должна превышать 6 мг, разделенных на 3 приема. Дозу можно повышать постепенно, на 2-4 мг, с интервалами от 3-4 до 7 дней. Как правило, 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 в сутки. Применение у пациентов 65 лет и старше 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. Применение у пациентов с нарушениями функции почек Лечение пациентов с почечной недостаточностью (КК менее 25 мл/мин) рекомендуется начинать с дозы 2 мг 1 раз в день. Повышение дозы проводят малыми «шагами» с учетом переносимости и эффективности. При необходимости достижения более выраженного эффекта, рекомендуется сначала увеличить дозу, применяемую 1 раз в сутки, после чего увеличивают кратность применения. Применение у пациентов с нарушениями функции печени Применение препарата Сирдалуд® у пациентов с нарушением функции печени тяжелой степени противопоказано У пациентов с нарушением функции печени средней степени тяжести препарат следует применять с осторожностью; рекомендовано начинать терапию с минимальной дозы, с постепенным повышением до достижения оптимального соотношения переносимости и эффективности терапии. Рекомендации по контролю показателей функции печени указаны в разделе «Особые указания». Прерывание лечения При прекращении терапии препаратом Сирдалуд® с целью уменьшения риска развития рикошетной гипертензии и тахикардии следует медленно снижать дозу до полной отмены препарата, в особенности у пациентов, получающих высокие дозы препарата в течение длительного времени.

Противопоказания

• Повышенная чувствительность к тизанидину или к любому другому компоненту препарата. • Нарушение функции печени тяжелой степени • Одновременное применение с мощными ингибиторами изофермента CYP1A2, такими как флувоксамин или ципрофлоксацин. • Не рекомендовано пациентам с редкими наследственными заболеваниями, такими как дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция, так как лекарственная форма содержит лактозу. • Опыт применения препарата у пациентов младше 18 лет ограничен. Применение препарата Сирдалуд® у пациентов данной популяции не рекомендовано. С ОСТОРОЖНОСТЬЮ Рекомендуется соблюдать осторожность при применении препарата у пациентов старше 65 лет, пациентов с нарушением функции почек, пациентов с нарушениями функции печени средней степени тяжести. Необходимо соблюдать осторожность при одновременном применении препарата Сирдалуд® с препаратами, удлиняющими интервал QT (например, цисаприд, амитриптилин, азитромицин). ПРИМЕНЕНИЕ ПРИ БЕРЕМЕННОСТИ И В ПЕРИОД ГРУДНОГО ВСКАРМЛИВАНИЯ Беременность Поскольку контролируемые исследования применения тизанидина у беременных женщин не проводились, его не следует применять в период беременности, за исключением тех случаев, когда потенциальная польза превышает возможный риск. Были проведены исследования репродуктивной функции у крыс в дозах 3 мг/кг в сутки и у кроликов в дозах 30 мг/кг в сутки, которые не выявили явления тератогенности. При применении в дозах 10 и 30 мг/кг в сутки у животных (крысы) отмечено увеличение срока гестации, зарегистрированы случаи пренатальной и постнатальной потери плода, а также задержка развития плода. При применении вышеуказанных доз у самок отмечались выраженные признаки миорелаксации и седации. Исходя из площади поверхности тела, указанные дозы превышали максимальную рекомендуемую дозу для человека (0,72 мг/кг в сутки) в 2,2 и 6,7 раз. Грудное вскармливание В исследованиях у животных тизанидин выделялся в небольших количествах с молоком лактирующих самок. Не следует применять препарат в период грудного вскармливания, так как нет данных о проникновении тизанидина в грудное молоко у человека. Тест на беременность Перед началом применения препарата Сирдалуд® у пациенток с сохраненным репродуктивным потенциалом рекомендовано получить результат теста на беременность. Влияние на фертильность В исследованиях у животных не отмечалось неблагоприятного влияния на фертильность особей мужского и женского пола при применении тизанидина в дозе 10 мг/кг в сутки и 3 мг/кг/ сутки соответственно. Отмечалось уменьшение фертильности у особей мужского пола, получавших тизанидин в дозе, превышающей 30 мг/кг в сутки, и у особей женского пола - в дозе, превышающей 10 мг/кг сутки. Исходя из площади поверхности тела, указанные дозы превышали максимальную рекомендуемую дозу для человека (0,72 мг/кг в сутки) в 2,2 и 6,7 раз. При

применении указанных доз у крыс отмечались поведенческие эффекты и клинические признаки, включающие выраженную седацию, уменьшение массы тела и атаксию. Контрацепция Следует информировать пациенток с сохраненным репродуктивным потенциалом о неблагоприятном влиянии препарата на развивающийся плод, выявленном в исследованиях у животных. Во время применения препарата, а также в течение 1 суток после прекращения приема препарата пациенткам с сохраненным репродуктивным потенциалом следует использовать надежные способы контрацепции (при правильном и длительном использовании которых частота наступления беременности составляет <1%).

Применение при беременности и кормлении грудью

Противопоказано

Побочные действия

При приеме малых доз, 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 побочные реакции умеренно выражены и преходящи. При приеме более высоких доз, рекомендуемых для лечения спастичности, вышеперечисленные НР возникают чаще и более выражены, однако они редко требуют прекращения отмены препарата в связи с тяжестью НР. Кроме того, могут возникать следующие явления: брадикардия, мышечная слабость, бессонница, нарушения сна, галлюцинации, гепатит. Нежелательные реакции (НР) сгруппированы в соответствии с классификацией органов и систем органов MedDRA, в пределах каждой группы перечислены в порядке уменьшения частоты встречаемости. Для оценки частоты развития НР использованы следующие критерии: очень часто (больше или равно 1/10); часто (от больше или равно 1/100, < 1/10); нечасто (больше или равно 1/1000, < 1/1000); очень редко (< 1/10000), включая отдельные сообщения. Нарушения со стороны нервной системы: очень часто - сонливость, головокружение. Нарушения психики: часто - бессонница, нарушения сна. Нарушения со стороны сердца: нечасто - брадикардия. Нарушения со стороны сосудов: часто - снижение АД (в отдельных случаях выраженное, вплоть до циркуляторного коллапса и потери сознания). Нарушения со стороны пищеварительной системы: очень часто - желудочно-кишечные расстройства, сухость во рту; часто - тошнота. Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани: очень часто - мышечная слабость. Общие расстройства и нарушения в месте введения: очень часто - повышенная утомляемость. Лабораторные и инструментальные данные: часто - повышение активности печеночных трансаминаз.

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 повышения АД, способное в отдельных случаях привести к острому нарушению мозгового кровообращения, в связи с чем дозу препарата Сирдалуд® следует снижать постепенно до полной отмены препарата. Отдельные сообщения о НР по данным применения в клинической практике Поскольку в пострегистрационном периоде сообщения о НР поступают в добровольном порядке из популяции неопределенного размера, достоверно оценить частоту их возникновения не представляется возможным (частота неизвестна). Нарушения со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности, включая анафилактические реакции, ангионевротический отек и крапивницу. Нарушения психики: галлюцинации, спутанность сознания. Нарушения со стороны нервной системы: головокружение. Нарушения со стороны органа зрения: затуманивание зрения. Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: гепатит, печеночная недостаточность. Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: кожная сыпь, эритема, кожный зуд, дерматит. Общие расстройства и нарушения в месте введения: астения, синдром отмены. Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются, или Вы заметили любые другие побочны эффекты не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

Передозировка

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

Взаимодействие с другими препаратами

При применении препарата Сирдалуд® с ингибиторами изофермента CYP1A2 возможно повышение концентрации тизанидина в плазме крови. В свою очередь, повышение концентрации тизанидина в плазме крови может приводить к симптомам передозировки препаратом, в том числе удлинению интервала QT(с). Одновременное применение препарата Сирдалуд® с индукторами изофермента CYP1A2 может приводить к снижению концентрации тизанидина в плазме крови, что может приводить к уменьшению терапевтического эффекта препарата. Противопоказанные

комбинации с тизанидином Одновременное применение тизанидина с флувоксамином или ципрофлоксацином, ингибиторами изофермента CYP1A2, противопоказано. При применении тизанидина с флувоксамином или ципрофлоксацином отмечается соответственно 33-кратное и 10-кратное увеличению AUC тизанидина. Результатом одновременного применения может оказаться значимая и длительная гипотензия сопровождающаяся сонливостью, головокружением, снижением скорости психомоторных реакций (в отдельных случаях вплоть до циркуляторного коллапса и потери сознания). Не рекомендуемые комбинации с тизанидином Не рекомендуется применять тизанидин одновременно с другими ингибиторами изофермента CYP1A2 - антиаритмическими препаратами (амиодарон, мексилетин, пропафенон), циметидином, некоторыми фторхинолонами (эноксацин, пефлоксацин, норфлоксацин), рофекоксибом, пероральными контрацептивами, тиклопидином. Комбинации с тизанидином, требующие соблюдения осторожности Необходимо соблюдать осторожность при одновременном применении препарата Сирдалуд® с препаратами, удлиняющими интервал QT (например, цизаприд, амитриптилин, азитромицин) Гипотензивные препараты Одновременное применение препарата Сирдалуд® с гипотензивными препаратами, включая диуретики, иногда может вызывать выраженное снижение АД (в отдельных случаях вплоть до циркуляторного коллапса и потери сознания) и брадикардию. При резкой отмене препарата Сирдалуд® после одновременного применения с гипотензивными препаратами отмечалось развитие тахикардии и повышение АД, которое в отдельных случаях может привести к острому нарушению мозгового кровообращения. Рифампицин Одновременный прием тизанидина и рифампицина приводит к 50% снижению концентрации тизанидина в плазме крови. Вследствие этого терапевтическое действие препарата может снижаться, что может иметь клиническую значимость для некоторых пациентов. Следует избегать длительного одновременного применения рифампицина и тизанидина, при невозможности рекомендуется тщательный подбор дозы тизанидина (увеличение). Курение табака Системная биодоступность тизанидина у курящих пациентов (более 10 сигарет в день) снижена примерно на 30%. Длительная терапия препаратом у пациентов данной категории может потребовать более высоких доз тизанидина, чем средние терапевтические. Алкоголь Во время терапии препаратом следует избегать приема алкоголя, так как он может повысить вероятность развития нежелательных явлений (например, снижения АД и заторможенности). Тизанидин может усиливать угнетающее действие алкоголя на центральную нервную систему. Другие лекарственные средства Седативные, снотворные препараты (бензодиазепин, баклофен) и другие препараты, такие как антигистаминные препараты, могут также усиливать седативный эффект тизанидина.

Следует избегать приема препарата с другими агонистами альфа2-адренорецепторов (например, клонидином) вследствие потенциального усиления гипотензивного эффекта.

Особые указания

Гипотензия может возникать на фоне применения препарата Сирдалуд® , а также как результат лекарственного взаимодействия с ингибиторами изофермента CYP1A2 и /или гипотензивными препаратами. Выраженное снижение АД может приводить к потере сознания и циркуляторному 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 пациентов, которые получают 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 аланинаминотрансферазы (АЛТ) и аспартатаминотрансферазы (АСТ) в сыворотке стойко превышают верхнюю границу нормы в 3 раза и более, применение препарата Сирдалуд® следует прекратить ВЛИЯНИЕ НА СПОСОБНОСТЬ УПРАВЛЯТЬ ТРАНСПОРТНЫМИ СРЕДСТВАМИ, МЕХАНИЗМАМИ Пациентам, у которых на фоне применения препарата отмечается сонливость, головокружение или какие-либо признаки артериальной гипотензии следует рекомендовать воздержаться от видов деятельности, требующих высокой концентрации внимания и быстрой реакции, например, управления транспортными средствами и механизмами.

Условия хранения

Беречь от детей