

# ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ПРЕПАРАТА ТИЗАЛУД

## Общая характеристика:

**международное и химическое названия:** tizanidine;  
5-хлоро-4-(2-имидазолин-2-иламино)-2,1,3-бензотиазол гидрохлорид;

**основные физико-химические свойства:** таблетки круглой формы с плоской поверхностью со скошенными краями и риской, белого или почти белого цвета;

**состав:** 1 таблетка содержит тизанидина (в форме гидрохлорида) — 2 мг или 4 мг;

**вспомогательные вещества:** целлюлоза микрокристаллическая, лактоза безводная, аэросил, стеариновая кислота.

**Форма выпуска.** Таблетки.

**Фармакотерапевтическая группа.** Миорелаксанты с центральным механизмом действия.

Тизанидин. Код АТС М03В Х02.

**Фармакологические свойства. Фармакодинамика.** Миорелаксант центрального действия. Механизм действия связан со стимуляцией пресинаптических  $\alpha_2$ -рецепторов, что приводит к подавлению высвобождения «возбуждающих» аминокислот (кислота глутаминовая, кислота аспарагиновая), которые стимулируют рецепторы к N-метил-D-аспартату. Вследствие этого на уровне промежуточных нейронов спинного мозга происходит подавление полисинаптической передачи возбуждения. Оказывает также умеренный центральный анальгезирующий эффект, обусловленный угнетением функции вставочных нейронов задних рогов спинного мозга. Снижает сопротивление пассивным движениям, уменьшает спазмы и клонические судороги, повышает силу произвольных сокращений. Не оказывает влияния на нервно-мышечную передачу.

**Фармакокинетика.** После приема тизанидин быстро и почти полностью всасывается в желудочно-кишечном тракте. Одновременный прием пищи не влияет на фармакокинетику тизанидина. В диапазоне доз от 4 до 20 мг фармакокинетика препарата имеет линейный характер. Препарат характеризуется низкой индивидуальной шириной фармакокинетических параметров. Максимальная концентрация в плазме достигается через 1–2 часа после приема. В связи с выраженным эффектом «первого прохождения» через печень биодоступность составляет около 34%. Связывание с белками плазмы составляет 30%. Тизанидин быстро и в большом количестве метаболизируется в печени с образованием неактивных метаболитов. Проникает через гематоэнцефалический барьер, в незначительном количестве поступает в

грудное молоко. Период полувыведения из системного кровотока составляет 2–4 часа. Выведение происходит преимущественно почками (60–70%) и кишечником (20–25%) главным образом в виде метаболитов, а также в неизменном виде (около 5%).

У больных с почечной недостаточностью (клиренс креатинина менее 25 мл/мин) максимальная концентрация в плазме крови превышает данный показатель у здоровых добровольцев в 2 раза, период полувыведения удлиняется до 14 часов.

При приеме внутрь действие препарата проявляется через 30–45 минут, максимальный эффект наступает в течение 1–2 часов.

**Показания к применению.** Болезненный мышечный спазм, связанный со статическими и функциональными заболеваниями позвоночника (шейный и поясничный синдромы), а также после хирургических вмешательств (по поводу грыжи межпозвонкового диска, остеоартроза тазобедренного сустава); спастичность скелетных мышц при неврологических заболеваниях (рассеянном склерозе, хронической миелопатии, дегенеративных заболеваниях спинного мозга, нарушениях мозгового кровообращения, церебральном параличе).

**Способ применения и дозы.** Взрослым назначают внутрь, независимо от приема пищи, запивая небольшим количеством жидкости. Режим дозирования устанавливают индивидуально, с учетом показаний, эффективности и переносимости терапии.

При *болезненном мышечном спазме* назначают по 2 мг или 4 мг 3 раза в сутки. В тяжелых случаях на ночь дополнительно назначают 2 мг или 4 мг тизанидина.

При *спастичности скелетных мышц, обусловленной неврологическими заболеваниями*, начальная суточная доза не должна превышать 6 мг (по 2 мг 3 раза в сутки). Суточную дозу можно повышать постепенно, на 2–4 мг в сутки, с интервалами от 3–4 до 7 дней. Обычно оптимальный терапевтический эффект достигается при суточной дозе от 12 до 24 мг, распределенной на 3 или 4 приема через равные промежутки времени.

Высшая суточная доза тизанидина для взрослых — 36 мг в сутки.

У пациентов с почечной недостаточностью (клиренс креатинина меньше 25 мл/мин) начальная доза составляет 2 мг 1 раз в сутки. Повышение дозы следует проводить постепенно, с учетом эффективности и переносимости терапии. При необходимости более выраженного эффекта, рекомендуется сначала увеличить дозу, назначаемую 1 раз в сутки, после чего увеличивают кратность назначения.

Длительность курса терапии определяется в зависимости от динамики мышечно-тонических и болевых проявлений. При острой боли мышечного генеза длительность приема препарата составляет от 1 до 2–3 недель. При хронических болевых синдромах может потребоваться более длительный курс, который определяется индивидуально и в среднем составляет от 3–6 недель до 1 года.

**Побочное действие.** *Со стороны центральной нервной системы:* сонливость,

слабость, головокружение, сухость во рту; редко — расстройства сна, галлюцинации.

*Со стороны опорно-двигательного аппарата:* редко — мышечная слабость.

*Со стороны пищеварительной системы:* редко — тошнота, желудочно-кишечные расстройства, преходящее повышение активности печеночных трансаминаз; очень редко — острый гепатит.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* часто — снижение артериального давления, брадикардия.

*Прочие:* утомляемость, редко — аллергические реакции (кожный зуд, сыпь, крапивница).

**Противопоказания.** Выраженные нарушения функции печени, одновременный прием флувоксамина, повышенная индивидуальная чувствительность к компонентам препарата, беременность, период кормления грудью, возраст до 18 лет.

**Передозировка.** При превышении рекомендованных доз возможны тошнота, рвота, артериальная гипотензия, головокружение, сонливость, миоз, беспокойство, нарушение дыхания, кома. *Лечение:* отмена препарата, промывание желудочно-кишечного тракта, многократный прием активированного угля, симптоматическая терапия. Показано проведение форсированного диуреза. Специфического антидота нет.

**Особенности применения.** Применяют с осторожностью у пациентов пожилого возраста в связи с вероятностью значительного снижения почечного клиренса.

При возникновении побочных явлений, возможно, связанных с нарушением функции печени (необъяснимая тошнота, анорексия, усталость), а также у пациентов, которые применяют тизанидин в суточной дозе более 12 мг, необходимо контролировать функциональные печеночные пробы 1 раз в месяц в первые 4 месяца лечения. В случае, когда уровни печеночных трансаминаз в сыворотке стойко превышают верхнюю границу нормы в 3 раза и более, применение препарата следует прекратить.

Поскольку в состав таблеток входит лактоза, не рекомендуется применять препарат у пациентов с наследственной непереносимостью галактозы, тяжелой лактазной недостаточностью и мальабсорбцией глюкозы (галактозы).

*Применение во время беременности и в период грудного вскармливания.* Прием препарата во время беременности противопоказан. При необходимости лечения тизанидином грудное вскармливание необходимо прекратить.

*Влияние на способность к управлению автотранспортом и механизмами.* При возникновении побочных явлений со стороны центральной нервной системы (сонливости и др.) пациентам следует воздержаться от видов работ, требующих высокой концентрации внимания и быстрой реакции, например, вождения транспортных средств или работы с машинами и механизмами.

**Взаимодействие с другими лекарственными средствами.** Противопоказано одновременное применение тизанидина с ингибитором CYP450 1A2 флувоксамином.

Необходимо соблюдать осторожность при одновременном применении тизанидина с другими ингибиторами CYP450 1A2, а именно: антиаритмиками (амиодароном, мексилетином, пропафеноном), циметидином, фторхинолонами (эноксацином, пефлоксацином, ципрофлоксацином, норфлоксацином), рофекоксибом, пероральными контрацептивами и тиклопидином.

При одновременном применении тизанидина и антигипертензивных препаратов, включая мочегонные, возможно развитие артериальной гипотензии и брадикардии.

При одновременном применении седативные препараты и алкоголь могут усиливать седативное действие тизанидина.

**Условия и сроки хранения.** В оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

*Хранить в недоступном для детей месте.*

Срок годности — 3 года.

**Условия отпуска.** По рецепту.

**Упаковка.** По 10 таблеток в блистере; по 3 блистера в пачке.

