

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Стезиум, 75 мг, таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые пленочной оболочкой.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: эперизон.

Каждая таблетка содержит 75,0 мг эперизона (в виде гидрохлорида).

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: натрий - от 0,224 мг до 0,336 мг (см. раздел 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые пленочной оболочкой.

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета. На разрезе белого или почти белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

Препарат Стезиум показан для лечения взрослых от 18 лет.

Показания к применению

Заболевания опорно-двигательного аппарата, сопровождаемые болезненными мышечными спазмами.

4.2. Режим дозирования и способ примененияРежим дозирования

Обычная доза для взрослых – 1 таблетка два раза в сутки после еды. Доза может быть скорректирована в зависимости от возраста и симптомов пациента.

Продолжительность терапии определяется врачом и зависит от выраженности расстройств и терапевтического эффекта.

Особые группы пациентов*Пациенты пожилого возраста*

Так как у пожилых людей часто наблюдается физиологическая гипофункция, целесообразно принимать такие меры, как снижение дозы под тщательным наблюдением.

Пациенты с нарушением функции почек

Коррекции дозы не требуется.

Пациенты с нарушением функции печени

Коррекции дозы не требуется.

Дети

Безопасность и эффективность у детей в возрасте от 0 до 18 лет не установлена. Данные отсутствуют.

Способ применения

Внутрь. Принимать целиком, не разламывать и не разжевывать.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к эперизону или любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.;
- Миастения.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

Пациентам с нарушением функции печени следует принимать препарат с осторожностью ввиду возможного ухудшения функции печени.

Особые указания

При приеме эперизона могут возникать: астения, потеря равновесия, сонливость. При возникновении подобных симптомов следует снизить дозу или прекратить лечение.

При приеме эперизона могут возникать анафилактикоидные реакции (см. раздел 4.8.). При возникновении таких симптомов, как покраснение, зуд, крапивница, отек, одышка следует прекратить лечение и принять необходимые меры.

При приеме эперизона могут возникать серьезные дерматологические патологии, такие как синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла) (см. раздел 4.8.). При возникновении таких синдромов, как лихорадка, эритема, везикулярная сыпь, зуд, гиперемия, стоматит следует прекратить лечение и принять необходимые меры.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата

Натрий в препарате Стезиум содержится во вспомогательном веществе карбоксиметилкрахмал натрия (см. раздел 6.1.). Препарат содержит менее 1 миллимоль (23 мг) натрия на одну таблетку (см. раздел 2.), то есть по сути не содержит натрия.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

При одновременном применении с метокарбамолом или толперизона гидрохлоридом было зарегистрировано нарушение зрительной аккомодации.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Безопасность использования эперизона во время беременности не установлена. Препарат применяют во время фактической или возможной беременности только в случае, если польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Лактация

Исследований у женщин в период грудного вскармливания не проводилось. При необходимости применения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Фертильность

Данные у человека отсутствуют.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Препарат Стезиум оказывает выраженное влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами. Пациентов следует предупредить о возможности возникновения нежелательных реакций, которые оказывают влияние на эти способности (см. раздел 4.8.). В период лечения необходимо воздержаться от управления транспортными средствами и работы с механизмами.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

Анафилактический шок и анафилактикоидные реакции

В редких случаях возможно развитие анафилактического шока и анафилактикоидных реакций (частота неизвестна), пациенты должны находиться под тщательным наблюдением (см. раздел 4.4.).

Синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла)
 Могут возникать тяжелые аллергические реакции, такие как синдром Стивенса-Джонсона и токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла) (частота неизвестна) (см. раздел 4.4.).

Табличное резюме нежелательных реакций

Определение частоты нежелательных реакций проводится в соответствии со следующими критериями: очень часто ($\geq 1/10$), часто (от $\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечасто (от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$), редко (от $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (невозможно оценить на основании имеющихся данных).

Нежелательные реакции о которых сообщалось при приеме эперизона в таблетках с пролонгированным высвобождением

В рандомизированном двойном слепом клиническом исследовании в параллельных группах с участием 238 пациентов с заболеванием опорно-двигательного аппарата, сопровождающимся болезненными мышечными спазмами и острой болью в пояснице, сообщалось о следующих нежелательных реакциях в основной и в контрольной группах:

Системно-органный класс/ нежелательные реакции	Основная группа (эперизон в таблетках с пролонгиро- ванным высвобождением) N=114	Контрольная группа (эпери- зон в таблетках с немедлен- ным высвобождением) N=124
Инфекции и инвазии		
Хронический ринит	–	Нечасто
Инфекция верхних дыхатель- ных путей	–	Нечасто
Нарушения со стороны нервной системы		
Головокружение	Часто	–
Головная боль	–	Нечасто
Сонливость	–	Нечасто
Желудочно-кишечные нарушения		
Расстройство пищеварения	Нечасто	Нечасто
Диарея	Нечасто	–
Общие нарушения и реакции в месте введения		
Местный отёк	Нечасто	–
Травмы, интоксикации и осложнения процедур		
Растяжение связок	–	Нечасто

В пострегистрационном наблюдении, проводившемся у 3247 пациентов в течение 4 лет, сообщалось о следующих нежелательных реакциях, причинно-следственная связь с которыми не может быть исключена:

Системно-органный класс	Нечасто	Редко
Психические нарушения	–	Нарушение сна
Нарушения со стороны нерв- ной системы	–	Парестезия, гипестезия, усиление головной боли, замедленная реакция
Желудочно-кишечные нару- шения	Изжога	Расстройства пищева- рения, боль в эпигастрии,

		сухость во рту, колит, гастроэнтерит
Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей	—	Зудящий дерматит, эритематозная сыпь
Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани	—	Артралгия
Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей	—	Затруднённое мочеиспускание
Общие нарушения и реакции в месте введения	—	Дискомфорт в области грудной клетки, боль в ногах, горечь во рту

Известные нежелательные реакции при приеме эперизона в таблетках с немедленным высвобождением

Системно-органный класс	Нечасто	Редко	Частота неизвестна
Нарушения со стороны крови и лимфатической системы	—	Анемия	—
Нарушения со стороны иммунной системы	—	—	Анафилактический шок, анафилактоидные реакции, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла
Психические нарушения	Астения, апатия	—	—
Нарушения со стороны нервной системы	Бессонница, сонливость, головная боль, квадриплегия, шатающаяся походка	Скованность и тремор в конечностях, головокружение, гипотония	—
Нарушения со стороны сердца	—	Пальпитация	—
Желудочно-кишечные нарушения	Тошнота, рвота, анорексия, дискомфорт в желудке, боль в животе, диарея, запор, жажда	Вздутие живота, стоматит	Икота
Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей	—	Повышение уровней аланинаминотрансферазы, аспартатаминотрансферазы и щелочной фосфатазы	—
Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей	Сыпь	Зуд, потливость, отеки	Многоформная экссудативная эритема

Нарушения функции почек и мочевыводящих путей	—	Протеинурия, повышение азота мочевины в крови, задержка мочи, недержание мочи, остаточная моча	—
Общие нарушения и реакции в месте введения	Приливы	—	—

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

109012, Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1.

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Телефон: +7 (499) 578-06-70; +7 (499) 578-02-20

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

<http://www.roszdravnadzor.gov.ru>

4.9. Передозировка

Симптомы

Передозировка может привести к отравлению или серьезным нежелательным реакциям.

Лечение

Симптоматическая терапия.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: миорелаксанты; миорелаксанты центрального действия; другие миорелаксанты центрального действия.

Код АТХ: M03BX09

Механизм действия

Эперизон ингибирует спинномозговые рефлексy на уровне спинного мозга и воздействует преимущественно на γ -систему за счет купирования чувствительности нервно-мышечного веретена, а также оказывает расслабляющее действие на скелетные мышцы. Подавляет активность афферентных нервных волокон (Ia-волокна) в нервно-мышечном веретене человека через 20 минут после применения. Подавляет спонтанный разряд γ -мотонейронов, но не оказывает непосредственного воздействия на нервно-мышечное веретено. В одинаковой степени подавляет моно- и полисинаптические рефлекторные потенциалы, вызванные стимуляцией эфферентных корешков спинномозгового нерва. Снижает чувствительность нервно-мышечного веретена, воздействуя на γ -мотонейроны. Расширяет кровеносные сосуды за счет антагонистического действия ионов Ca^{2+} на гладкую мускулатуру сосудов. Анальгетическое действие эперизона связано также с подавлением высвобождения болевой субстанции P - ключевого нейропептида многих тканей, реализующего процессы формирования и поддержания острой и хронической боли, а также нейрогенного воспаления через активацию лейкоцитов, увеличение проницаемости сосудов и сенситизацию ноцицепторов

при повреждении тканей благодаря вовлечению в механизмы продукции провоспалительных цитокинов, простагландинов, биогенных аминов.

Фармакодинамические эффекты

Эперизон купирует различные симптомы мышечного напряжения и проявляет многофакторное действие, направленное на выведение скелетных мышц из порочного круга «гипертонус → нарушение кровообращения → боль → гипертонус». Обладает обезболивающим действием на уровне спинного мозга. Снимает напряжение и подавляет ригидность скелетных мышц, обеспечивая возможность совершения произвольных движений, таких как разгибание и сгибание конечностей, без снижения мышечной силы. Увеличивает объем кровотока в коже, мышцах, наружных и внутренних сонных артериях, позвоночных артериях.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Эперизон всасывается в желудочно-кишечном тракте. Средняя максимальная концентрация (C_{max}) эперизона при приеме одной таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытой пленочной оболочкой составляет $1,82 \pm 2,93$ нг/мл, время ее достижения (T_{max}) - $6,20 \pm 4,95$ часа. Средняя площадь под фармакокинетической кривой «концентрация-время» ($AUC_{0-\infty}$) для эперизона составляет ($M \pm SD$) - $18,73 \pm 41,61$ ч*нг/мл.

Распределение

В доклинических исследованиях показано, что после перорального введения эперизона, его распределение в желудке, тонком кишечнике, печени и почках в 10–20 раз превышает его распределение в крови, а распределение в седалищном нерве, спинном мозге, головном мозге и мышцах аналогично распределению в крови.

Биотрансформация

Предполагается, что эперизон метаболизируется до метаболита карбоновой кислоты через диоловую форму после ω -1-гидроксилирования цитохромом P-450 печени.

Элиминация

Эперизон выводится преимущественно с мочой в виде метаболита; небольшое количество выводится в неизменном виде. Период полувыведения ($T_{1/2}$) для эперизона составляет $5,05 \pm 1,73$ часа.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Ядро таблетки:

Целлюлоза микрокристаллическая

Гипромеллоза 2208

Карбоксиметилкрахмал натрия

Лимонной кислоты моногидрат

Кремния диоксид коллоидный

Магния стеарат

Пленочная оболочка:

Гипромеллоза 2910

Титана диоксид

Макрогол 400

6.2. Несовместимость

Данные о физической или химической несовместимости отсутствуют.

6.3. Срок годности (срок хранения)

2 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 30 таблеток в пластиковые флаконы из полиэтилена высокой плотности, укупоренные пластиковыми крышками из полиэтилена низкой плотности с контролем первого вскрытия с защелкой.

Один флакон вместе с листком-вкладышем помещают в пачку из картона.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Нет особых требований к утилизации.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

Акционерное общество «Валента Фармацевтика» (АО «Валента Фарм»)

141108, Московская область, г. Щелково, ул. Фабричная, д. 2.

Телефон +7 (495) 933-48-62, факс +7 (495) 933-48-63.

Электронный адрес: info@valentapharm.com

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

Акционерное общество «Валента Фармацевтика» (АО «Валента Фарм»)

141108, Московская область, г. Щелково, ул. Фабричная, д. 2.

Телефон +7 (495) 933-48-62, факс +7 (495) 933-48-63.

Электронный адрес: info@valentapharm.com

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Стезиум доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://eec.eaeunion.org/>