

KISA ÜRÜN BİLGİSİ

▼ Bu ilaç ek izlemeye tabidir. Bu üçgen yeni güvenlik bilgisinin hızlı olarak belirlenmesini sağlayacaktır. Sağlık mesleği mensuplarının şüpheli advers reaksiyonları TÜFAM’a bildirmeleri beklenmektedir. Bakınız Bölüm 4.8. Şüpheli advers reaksiyonların raporlanması.

1. BEŞERİ TIBBİ ÜRÜNÜN ADI

SPASTİLON 150 mg film kaplı tablet

2. KALİTATİF VE KANTİTATİF BİLEŞİM

Etkin madde:

Tolperison hidroklorür 150 mg

Yardımcı maddeler:

Laktoz monohidrat 132 mg (inek sütü kaynaklı)

Yardımcı maddeler için 6.1’e bakınız.

3. FARMASÖTİK FORM

Film kaplı tablet

Beyaz-beyazımsı renkte, tek yüzü “T150” baskılı yuvarlak film kaplı tablet

4. KLİNİK ÖZELLİKLER

4.1 Terapötik endikasyonlar

SPASTİLON 150 mg film kaplı tablet,

- İnme sonrası erişkinlerde spastisitenin semptomatik tedavisinde,
- Akut ağrılı kas spazmlarının tedavisinde endikedir.

4.2 Pozoloji ve uygulama şekli

Pozoloji/uygulama sıklığı ve süresi:

Erişkinlerde:

Ortalama günlük doz hastanın bireysel ihtiyaçları ve toleransına göre 150-450 mg (1-3 tablet)’dir.

Uygulama şekli:

Oral kullanım içindir. Tabletler çiğnenmeden bütün olarak 1 bardak su ile birlikte yemeklerden sonra alınmalıdır.

Yetersiz gıda alımı tolperisonun biyoyararlanımını azaltabilir.

Özel popülasyonlara ilişkin ek bilgiler:

Böbrek yetmezliği:

Böbrek yetmezliği olan hastalarda sınırlı deneyim mevcuttur. Bu hasta grubunda kullanıldığında, daha fazla sayıda advers olay gözlenmiştir. Bu nedenle, orta derecede böbrek fonksiyon bozukluğu olan hastalarda, hastanın durumu ve böbrek fonksiyonunun yakın takibi ile bireysel doz titrasyonu önerilmektedir. Şiddetli böbrek yetmezliği olan hastalarda tolperison kullanımı önerilmez.

Karaciğer yetmezliği:

Karaciğer yetmezliği olan hastalarda sınırlı deneyim mevcuttur. Bu hasta grubunda kullanıldığında, daha fazla sayıda advers olay gözlenmiştir. Bu nedenle, orta derecede karaciğer fonksiyon bozukluğu olan hastalarda, hastanın durumu ve karaciğer fonksiyonunun yakın takibi ile bireysel doz titrasyonu önerilmektedir. Şiddetli karaciğer yetmezliği olan hastalarda tolperison kullanımı önerilmez.

Pediyatrik popülasyon:

Pediyatrik popülasyonda ilacın güvenliliği ve etkililiği bilinmemektedir ve kullanılması önerilmez.

Geriatrik popülasyon:

Yaşlı hastalarda doz değişikliği veya azaltma gerekli değildir; önerilen dozlar iyi tolere edilir.

4.3 Kontrendikasyonlar

SPASTİLON,

- Etken madde tolperison hidroklorür, kimyasal olarak benzer maddelere veya yardımcı maddelerden herhangi birine karşı aşırı duyarlılığı olan hastalarda,
- Myastenia gravis hastalığı olanlarda,
- Laktasyonda,
- Gebeliğin ilk trimesterinde (Bakınız 4.6 Gebelik ve laktasyon),
- Çocuklar ve adolesanlarda kontrendikedir.

4.4 Özel kullanım uyarıları ve önlemleri

Aşırı duyarlılık reaksiyonu

Tolperison ile en sık bildirilen pazarlama sonrası advers ilaç reaksiyonları, aşırı duyarlılık reaksiyonları olmuştur. Bunlar, hafif cilt reaksiyonlarından, anafilaktik şok da dahil olmak üzere şiddetli sistemik reaksiyonlara kadar değişmektedir. Böyle bir reaksiyonun semptomları eritem, döküntü, ürtiker, kaşıntı, anjiyoödem, taşikardi, hipotansiyon veya dispneyi içerebilir.

Kadınlarda, diğer tıbbi ürünlere karşı aşırı duyarlılığı olan hastalarda veya alerji öyküsü olan hastalarda aşırı duyarlılık reaksiyon riski artabilir.

Lidokaine karşı bilinen aşırı duyarlılık durumunda, olası çapraz reaksiyonlar nedeniyle tolperison uygulaması sırasında daha dikkatli olunması gerekmektedir.

Hastalara, aşırı duyarlılıkla uyumlu herhangi bir semptoma karşı dikkatli olmaları ve bu semptomların ortaya çıkması durumunda tolperison almayı kesmeleri ve derhal tıbbi yardım almaları tavsiye edilmelidir.

Tolperison, bu ilaca karşı bir aşırı duyarlılık reaksiyonu sonrasında tekrar kullanılmamalıdır.

SPASTİLON laktoz monohidrat içermektedir. Nadir kalıtsal galaktoz intoleransı, Lapp laktoz yetmezliği ya da glikoz-galaktoz malabsorpsiyon problemi olan hastaların bu ilacı kullanmamaları gerekir.

4.5 Diğer tıbbi ürünler ile etkileşimler ve diğer etkileşim şekilleri

CYP2D6 substrat dekstrometorfan ile yapılan farmakokinetik ilaç etkileşimi çalışmaları, tolperisonun birlikte uygulanmasının, tioridazin, tolterodin, venlafaksin, atomoksetin, desipramin, dekstrometorfan, metoprolol, nebivolol, perfenazin gibi baskın olarak CYP2D6 tarafından metabolize edilen ilaçların kan seviyelerini arttırabileceğini göstermektedir.

İnsan karaciğeri mikrozomlarında ve insan hepatositlerinde yapılan *in vitro* deneyler, diğer CYP izoenzimlerinin (CYP2B6, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP1A2, CYP3A4) anlamlı inhibisyonunu veya indüksiyonunu önermemiştir.

Tolperisonun metabolik yollarının çeşitliliği nedeniyle, CYP2D6 substratları ve/veya diğer ilaçların eş zamanlı uygulanmasından sonra tolperison maruziyetinde artış beklenmemektedir.

Tolperisonun biyoyararlanımı yemeksiz alındığında azalır, bu nedenle öğünlerle birlikte tutarlı

uygulama önerilir.

Tolperison merkezi etkili bir bileşik olmasına rağmen sedasyona neden olma potansiyeli düşüktür. Diğer merkezi etkili kas gevşeticilerle birlikte uygulanması durumunda tolperizon dozunun azaltılması düşünülmelidir.

Tolperizon, niflumik asidin etkisini güçlendirir, bu nedenle, niflumik asit veya diğer NSAID'lerin birlikte uygulanması durumunda dozunun azaltılması düşünülmelidir.

Özel popülasyonlara ilişkin ek bilgiler

Pediyatrik popülasyon:

Veri yoktur.

Geriatrik popülasyon:

Veri yoktur.

4.6 Gebelik ve laktasyon

Genel tavsiye

Gebelik kategorisi: ilk trimesterde X, ikinci ve üçüncü trimesterde C

Çocuk doğurma potansiyeli bulunan kadınlar/Doğum kontrolü (Kontrasepsiyon)

Çocuk doğurma potansiyeli olan kadınlar tedavi süresince etkili doğum kontrolü uygulamak zorundadırlar.

Gebelik dönemi

SPASTİLON gebeliğin ilk trimesterinde kontrendikedir

SPASTİLON 'un gebeliğin ikinci ve üçüncü trimesterde kullanımına ilişkin yeterli veri mevcut değildir.

Hayvanlar üzerinde yapılan çalışmalar, gebelik /ve-veya/ embriyonal/fetal gelişim /ve-veya/ doğum /ve-veya/ doğum sonrası gelişim üzerindeki etkiler bakımından yetersizdir (Bkz. Bölüm 5.3.). Hayvanlar üzerinde yapılan çalışmalarda teratojenik etki görülmemiştir.

İlacın hamile kadınlarda kullanımına ilişkin klinik veri bulunmamaktadır. İlaç hamilelik sırasında kullanılmadan önce dikkatli bir risk/fayda değerlendirmesi yapmak gerekir.

SPASTİLON gerekli olmadıkça gebelik döneminde kullanılmamalıdır.

Laktasyon dönemi

Tolperisonun insan sütüne geçip geçmediği bilinmediğinden, emzirme sırasında SPASTİLON kullanımı kontrendikedir.

Üreme yeteneği/Fertilite

SPASTİLON'un etkin maddesi tolperisonun üreme yeteneği/fertilite üzerindeki etkisi bilinmemektedir.

4.7 Araç ve makine kullanımı üzerindeki etkiler

SPASTİLON kullanımı sırasında hastalarda baş dönmesi, uyuşukluk, dikkat bozukluğu, epilepsi, bulanık görme ve kas zayıflığı gibi belirtiler gelişebilir. Bu belirtiler gözlemlenirse araç ve makine kullanımı önerilmez. Bu belirtileri yaşayan hastalar doktora başvurmalıdır.

4.8 İstenmeyen etkiler

Tolperison etkin maddesinin film kaplı tablet formuyla yapılan 12.000'den daha fazla hastadan elde edilen verilere göre en yaygın yan etkiler deri ve deri altı doku, nörolojik, genel ve gastrointestinal sistemi organ sınıflarında görülmüştür.

Pazarlama sonrası verilerde tolperison uygulamasıyla ilişkili bildirilen vakaların yaklaşık %50-60'ını aşırı duyarlılık reaksiyonları oluşturmaktadır. Bunların çoğu ciddi olmayan vakalardır. Yaşamı tehdit eden aşırı duyarlılık reaksiyonları nadiren rapor edilmiştir.

Bu çalışma sonucunda görülen en yaygın yan etkiler MedDRA'da "Yaygın olmayan ($\geq 1 / 1000$)" olarak sınıflandırılabilir. Aşağıdaki özet klinik çalışmalarda raporlanan ve piyasaya sunulduktan sonra veya pazarlama sonrasında görülen ve raporlanan yan etkileri içermektedir.

Sıklıklar şöyle tanımlanabilir: Çok yaygın ($\geq 1/10$); yaygın ($\geq 1/100$ ila $<1/10$); yaygın olmayan ($\geq 1/1000$ ila $<1/100$); seyrek ($\geq 1/10.000$ ila $<1/1000$); çok seyrek ($<1/10.000$), bilinmiyor (eldeki verilerden hareketle tahmin edilemiyor).

Kan ve lenf sistemi hastalıkları

Çok seyrek: Anemi, lenfadenopati

Bağıışıklık sistemi hastalıkları

Seyrek: Hipersensitivite*, anafilaktik reaksiyon

Çok seyrek: Anafilaktik şok

Metabolizma ve beslenme hastalıkları

Yaygın olmayan: Anoreksi

Çok seyrek: Polidipsi

Psikiyatrik hastalıkları

Yaygın olmayan: İnsomnia, uyku bozukluğu

Seyrek: Depresyon, aktivitenin azalması

Çok seyrek: Konfüzyon

Sinir sistemi hastalıkları

Yaygın olmayan: Baş ağrısı, baş dönmesi, uyuklama

Seyrek: Dikkat bozuklukları, tremor, epilepsi, hipoastezi, parestezi, letarji

Göz hastalıkları:

Seyrek: Bulanık görme

Kulak ve iç kulak hastalıkları

Seyrek: Tinnitus, vertigo

Kardiyak hastalıkları

Seyrek: Taşikardi, angina, çarpıntı

Çok seyrek: Bradikardi

Vasküler hastalıkları

Yaygın olmayan: Hipotansiyon

Seyrek: Dermahemia

Solunum, göğüs bozuklukları ve mediastinal hastalıklar

Seyrek: Dispne, epiktaksis, takipne

Gastrointestinal hastalıkları

Yaygın olmayan: Karın ağrısı, diyare, ağız kuruluğu, dispepsi, mide bulantısı

Seyrek: Epigastrik ağrı, konstipasyon, flatulans, kusma

Hepato-bilier hastalıkları

Seyrek: Hafif karaciğer yetmezliği

Deri ve deri altı doku hastalıkları

Seyrek: Alerjik dermatit, hiperhidroz, kaşıntı, ürtiker, döküntü

Kas iskelet bozuklukları, bağ doku ve kemik hastalıkları

Yaygın olmayan: Kas güçsüzlüğü, kas ağrısı, uzuv ağrısı

Seyrek: Kol ve bacaklarda rahatsızlık

Çok seyrek: Osteopeni

Böbrek ve idrar yolu hastalıkları

Seyrek: Proteinüri, enürezis

Çok seyrek: Kan kreatininde artış.

Genel bozukluklar ve uygulama bölgesine ilişkin hastalıkları

Yaygın olmayan: Asteni, yorgunluk, rahatsızlık

Seyrek: Sarhoş hissetmek, sıcaklık hissetmek, iritabilite, susuzluk

Çok seyrek: Göğüs bölgesinde rahatsızlık

Araştırmalar

Seyrek: Kan basıncında azalma, kan bilirubin seviyesinde artış, karaciğer enzimlerinde değişiklik, trombosit sayısının azalması, beyaz kan hücrelerinin artması.

Çok seyrek: Kan kreatinin seviyesinde artış.

*Pazarlama sonrası anjiyoödem (yüz ve dudak şişmesi dahil) advers reaksiyonlar arasında bildirilmiştir. Ancak sıklığı bilinmemektedir.

Şüpheli advers reaksiyonların raporlanması

Ruhsatlandırma sonrası şüpheli ilaç advers reaksiyonlarının raporlanması büyük önem taşımaktadır. Raporlama yapılması, ilacın yarar / risk dengesinin sürekli olarak izlenmesine olanak sağlar. Sağlık mesleği mensuplarının herhangi bir şüpheli advers reaksiyonu Türkiye Farmakovijilans Merkezi (TÜFAM)'ne bildirmeleri gerekmektedir (www.titck.gov.tr; e- posta: tufam@titck.gov.tr; tel: 0 800 314 00 08; faks: 0 312 218 35 99).

4.9 Doz aşımı ve tedavisi

Doz aşımı belirtileri esas olarak uyku hali, mide-bağırsak belirtileri (bulantı, kusma, epigastrik ağrı), göğüs ağrısı, taşikardi, hipertansiyon, bradikinezi ve vertigodur. Ağır vakalarda nöbet ve koma bildirilmiştir.

Tolperisonun spesifik bir antidotu mevcut değildir. Doz aşımı durumunda semptomatik ve destekleyici tedavi önerilmektedir.

5. FARMAKOLOJİK ÖZELLİKLER

5.1 Farmakodinamik özellikler

Farmakoterapötik grup: Kas gevşeticiler, santral etkili ajanlar

ATC kodu : M03BX04

Etki mekanizması:

Tolperison santral etkili bir kas gevşeticidir. Tolperisonun etki mekanizması tam olarak bilinmemektedir. Tolperison nöral doku içinde yüksek afiniteye sahiptir; en yüksek konsantrasyonlarına beyin sapı, spinal kordu ve periferel sinir sisteminin içinde ulaşır. Tolperisonun en önemli etkisi spinal refleks yolu üzerindeki inhibitör etkidir. Bu etki ile birlikte azalan inhibitör yolun kontrolü tolperisonun terapötik etkisinin en iyi açıklaması olabilir. Tolperison molekülünün kimyasal yapısı lidokainin kimyasal yapısını anımsatır. Lidokain ile benzer olarak membran stabilize edici etkisi vardır ve motor nöronları ve primer afferent sinir liflerinin elektriksel uyarılabilirliğini azaltır. Tolperison konsantrasyona bağlı olarak izole sinir hücreleri zarlarından sodyum akışını azaltmaktadır ve böylece aksiyon potansiyellerinin şiddeti ve frekansını azaltmaktadır.

Gerilime baęlı kalsiyum kanalları üzerinde kesin inhibisyon etkisi tolperisonun membran stabilize edici aktivitesine ek olarak nörotransmitter salınımını azaltabileceęini göstermektedir. Ayrıca tolperison zayıf alfa adrenerjik antagonist ve antimuskarinik özellięe sahiptir.

5.2 Farmakokinetik özellikler

Emilim:

Oral uygulamayı takiben tolperison ince baęırsaktan iyi emilir. Maksimum plazma konsantrasyonlarına uygulandıktan 0.5-1 saat içinde ulaşılır.

Daęılım:

Geniş ilk geçiş metabolizmasından dolayı biyoyararlanımı yaklaşık %20'dir. Yüksek yağlı besinler , pike ulaşma süresi yaklaşık 30 dakika geciktięinde, boş bir mideye alınmasına kıyasla oral yoldan alınan tolperisonun biyoyararlanımını yaklaşık % 100 ve maksimum plazma konsantrasyonunu yaklaşık % 45 artırır.

Biyotransformasyon:

Tolperison karacięer ve böbrekler tarafından geniş ölçüde metabolize edilir. Metabolitlerin farmakolojik aktiviteleri bilinmemektedir.

Eliminasyon:

İlaç neredeyse tamamen böbrekler yoluyla atılır (%99'dan fazlası).

Oral uygulamanın ardından eliminasyon yarı ömrü yaklaşık 2.5 saattir.

Doęrusallık/Doęrusal olmayan durum:

Veri mevcut deęildir.

Hastalardaki karakteristik özellikler

Yaşlı hastalarda:

Veri mevcut deęildir.

Pediyatrik hastalarda:

Veri mevcut deęildir.

Böbrek/Karacięer yetmezliğinde:

Veri mevcut deęildir

5.3 Klinik öncesi güvenlik verileri

Güvenlilik farmakolojisi, tekrarlanan doz toksisitesi, genotoksisite, üreme toksikolojisine ilişkin klinik dışı veri insanlar için herhangi bir tehlike göstermemiştir.

Klinik dışı çalışmaların etkisi sadece maksimum insan dozunda maruziyet süresi aşıldığında gözlemlenmiştir. Bu durum klinik deneyimde bu etkinin küçük bir rol oynayacağını düşündürmektedir.

Tavşanlar ve sıçanlarda oral uygulama sonrası embriyotoksik etkiler vücut ağırlığı başına 250 mg/kg ve 500 mg/kg dozlarında gözlemlenmiştir. Bu dozlar önerilen terapötik dozlardan birkaç kat daha yüksektir.

6. FARMASÖTİK ÖZELLİKLER

6.1 Yardımcı maddelerin listesi

Sitrik asit monohidrat

Mikrokristalin selüloz

Laktoz monohidrat (inek sütü kaynaklı)

Mısır nişastası

Kolloidal silikon dioksit

Talk

Stearik Asit

Opadry 03F180011 Beyaz içeriği:

HPMC 2910/ Hiperelloz (E464)

Titanyum dioksit (E171)

Makrogol /PEG

6.2 Geçimsizlikler

Bilinen herhangi bir geçimsizliği bulunmamaktadır.

6.3 Raf ömrü

60 ay

6.4 Saklamaya yönelik özel tedbirler

25°C altındaki oda sıcaklığında saklayınız.

6.5 Ambalajın niteliği ve içeriği

Her karton kutu, şeffaf PVC/Alu blister içerisinde 30 film tablet olacak şekilde ambalajlanmıştır.

6.6 Beşeri tıbbi üründen arta kalan maddelerin imhası ve diğer özel önlemler

Kullanılmamış olan ürünler ya da atık materyaller “Tıbbi Atıkların Kontrolü Yönetmeliği” ve “Ambalaj Atıklarının Kontrolü Yönetmelik”lerine uygun olarak imha edilmelidir.

7. RUHSAT SAHİBİ

Tab İlaç Sanayi ve Tic. A.Ş.

Akçaburgaz Mah. Akçaburgaz Cad. No: 42

Esenyurt / İstanbul

Tel: +90 212 438 70 83

Faks: +90 212 438 70 84

8. RUHSAT NUMARASI

2025/423

9. İLK RUHSAT TARİHİ/RUHSAT YENİLEME TARİHİ

İlk ruhsat tarihi: 04.10.2025

Ruhsat yenileme tarihi:

10. KÜB'ÜN YENİLENME TARİHİ