

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
ТОЛПИРИЛИД®

Регистрационный номер:

Торговое наименование: ТОЛПИРИЛИД®

Международное непатентованное или группировочное наименование:

Толперизон + [Лидокаин]

Лекарственная форма: раствор для внутримышечного введения

Состав

Состав (на 1 мл):

Действующие вещества:

Толперизона гидрохлорид - 100,0 мг

(в пересчете на сухое вещество)

Лидокаина гидрохлорид - 2,5 мг

(в пересчете на безводное вещество)

Вспомогательные вещества:

Метилпарагидроксибензоат - 0,6 мг

Диэтиленгликоля моноэтиловый эфир - 0,3 мл

Вода для инъекций - до 1,0 мл

Описание: прозрачный бесцветный или слегка зеленоватый раствор со специфическим запахом.

Фармакотерапевтическая группа: миорелаксант центрального действия.

Код АТХ: M03BX04

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Толперизона гидрохлорид – миорелаксант центрального действия. Оказывает мембраностабилизирующее, местноанестезирующее действие, тормозит проведение нервных импульсов в первичных афферентных волокнах и двигательных нейронах, что приводит к блокированию спинномозговых моно- и полисинаптических рефлексов. Вероятно, опосредует блокирование выделения медиаторов путем торможения поступления ионов кальция в синапсы. Тормозит проведение возбуждения по ретикулоспинальному пути в стволе головного мозга.

Независимо от влияния на центральную нервную систему (ЦНС), усиливает периферический кровоток. Это действие не связано с воздействием препарата на ЦНС и может быть обусловлено слабым спазмолитическим и антиадренергическим действием толперизона.

Лидокаина гидрохлорид обладает местноанестезирующим действием и, при дозировании согласно инструкции, системного действия не оказывает.

Фармакокинетика

Всасывание

Лидокаин: абсорбция – полная (скорость абсорбции зависит от места введения и дозы).

$T_{C_{max}}$ при в/м введении – 30-45 мин.

Распределение

Лидокаин: Связь с белками плазмы – 50-80 %.

Быстро распределяется в тканях и органах. Проникает через гематоэнцефалический барьер (ГЭБ) и плацентарный барьер, секретируется с материнским молоком (40 % от концентрации в плазме матери).

Метаболизм

Толперизон: подвергается интенсивному метаболизму в печени и почках.

Лидокаин: метаболизируется в печени (на 90-95 %) с участием микросомальных ферментов путем дезалкилирования аминогруппы и разрыва амидной связи с образованием активных метаболитов.

Выведение

Толперизон: выводится почками, практически полностью (более 99 %) в виде метаболитов, фармакологическая активность которых неизвестна.

Лидокаин: выводится с желчью (часть дозы подвергается реабсорбции в желудочно-кишечном тракте) и почками (до 10 % в неизменном виде).

Показания к применению

- Симптоматическое лечение спастичности, обусловленной инсультом, у взрослых;
- миофасциальный болевой синдром средней и тяжелой степени (в том числе мышечный спазм при дорсопатиях) у взрослых.

Противопоказания

- Гиперчувствительность к толперизону или химически сходному эперизону, или лидокаину, или к любому из вспомогательных веществ;
- миастения gravis;
- беременность и период грудного вскармливания;
- дети и подростки до 18 лет.

С осторожностью

Препарат следует применять с осторожностью у женщин, пациентов с повышенной чувствительностью к другим препаратам или с аллергией в анамнезе (см. раздел «Особые ука-

зания»), у пациентов с почечной и печеночной недостаточностью (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

В экспериментальных исследованиях на животных не выявлено тератогенного действия толперизона. По причине отсутствия значимых клинических данных толперизон не следует применять при беременности, за исключением случаев, когда ожидаемая польза определено оправдывает потенциальный риск для плода.

Период грудного вскармливания

Поскольку данные о выведении толперизона с грудным молоком отсутствуют, то его применение в период грудного вскармливания противопоказано.

Способ применения и дозы

Режим дозирования

Взрослым назначают ежедневно по 1 мл (100 мг толперизона) 2 раза в сутки, внутримышечно.

Особые группы пациентов

Пациенты с почечной недостаточностью

Опыт применения толперизона у пациентов с почечной недостаточностью ограничен, у данной категории пациентов чаще возникали нежелательные реакции. Поэтому у пациентов с нарушениями функции почек средней степени необходимо проводить подбор дозы толперизона с тщательным наблюдением за состоянием здоровья пациента и контролем функции почек. При тяжелом поражении почек назначение толперизона не рекомендуется.

Пациенты с печеночной недостаточностью

Опыт применения толперизона у пациентов с печеночной недостаточностью ограничен, у данной категории пациентов чаще возникали нежелательные реакции. Поэтому у пациентов с нарушениями функции печени средней степени необходимо проводить подбор дозы толперизона с тщательным наблюдением за состоянием здоровья пациента и контролем функции печени. При тяжелом поражении печени назначение толперизона не рекомендуется.

Дети

Препарат не предназначен для применения у детей и подростков в возрасте до 18 лет.

Способ применения

Препарат вводится только внутримышечно.

Побочное действие

Побочные реакции сгруппированы по системно-органной классификации с указанием частоты их развития в соответствии с рекомендациями Всемирной Организацией Здравоохранения (ВОЗ): *очень часто* ($\geq 1/10$); *часто* ($\geq 1/100$; $< 1/10$); *нечасто* ($\geq 1/1000$; $< 1/100$); *редко* ($\geq 1/10000$; $< 1/1000$); *очень редко* ($< 1/10000$); *частота неизвестна* (частота не может быть определена на основе имеющихся данных).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: *очень редко:* анемия, лимфаденопатия.

Нарушения со стороны иммунной системы: *редко:* реакция повышенной чувствительности, анафилактическая реакция; *очень редко:* анафилактический шок; *частота неизвестна:* ангионевротический отек, включая отек лица, губ.

Нарушения метаболизма и питания: *нечасто:* анорексия; *очень редко:* полидипсия.

Психические нарушения: *нечасто:* бессонница, нарушения сна; *редко:* снижение активности, депрессия; *очень редко:* спутанность сознания.

Нарушения со стороны нервной системы: *нечасто:* головная боль, головокружение, сонливость; *редко:* нарушение внимания, тремор, эпилепсия, гипестезия, парестезия, летаргия.

Нарушения со стороны органа зрения: *редко:* нечеткость зрения.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта: *редко:* шум в ушах, вертиго.

Нарушения со стороны сердца: *редко:* стенокардия, тахикардия, ощущение сердцебиения; *очень редко:* брадикардия.

Нарушения со стороны сосудов: *нечасто:* артериальная гипотензия; *редко:* «приливы».

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: *редко:* одышка, носовое кровотечение, учащенное дыхание.

Желудочно-кишечные нарушения: *нечасто:* дискомфорт в животе, диарея, сухость во рту, диспепсия, тошнота; *редко:* боль в эпигастральной области, запор, метеоризм, рвота.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: *редко:* печеночная недостаточность легкой степени.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: *редко:* аллергический дерматит, повышенная потливость, зуд, крапивница, сыпь.

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани: *нечасто:* мышечная слабость, миалгия, боль в конечностях; *редко:* дискомфорт в конечностях; *очень редко:* остеопения.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: *редко:* энурез, протеинурия.

Общие нарушения и реакции в месте введения: *нечасто:* астения, дискомфорт, усталость; *редко:* чувство опьянения, чувство жара, раздражительность, жажда; *очень редко:* дискомфорт в грудной клетке.

Лабораторные и инструментальные данные: *редко:* снижение артериального давления, гипербилирубинемия, изменение активности печеночных ферментов, тромбоцитопения, лейкоцитоз; *очень редко:* увеличение концентрации креатинина в плазме крови.

Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются или были замечены любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, следует сообщить об этом врачу.

Передозировка

Симптомы передозировки чаще всего включают: сонливость, желудочно-кишечные расстройства (тошнота, рвота, боль в эпигастрии), тахикардия, артериальная гипертензия, брадикардия и вертиго. В тяжелых случаях сообщалось о развитии судорог, угнетении дыхания, апноэ и коме.

Лечение: специфического антидота нет. Рекомендуется проведение симптоматической терапии.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Исследования фармакокинетического лекарственного взаимодействия с маркерным субстратом изофермента CYP2D6 декстрометорфаном показали, что одновременное применение толперизона может повысить содержание в крови лекарственных средств, которые метаболизируются преимущественно изоферментом CYP2D6 (тиоридазин, толтеродин, венлафаксин, атомoksetин, дезипрамин, декстрометорфан, метопролол, небиволол, перфеназин).

В лабораторных экспериментах на микросомах печени человека и гепатоцитах человека значительного ингибирования или индукции других изоферментов CYP (CYP2B6, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP1A2, CYP3A4) не обнаружено.

В связи с разнообразием метаболических путей толперизона повышение экспозиции толперизона при одновременном применении субстратов изофермента CYP2D6 и/или других препаратов не ожидается.

Несмотря на то что толперизон является препаратом центрального действия, седативный эффект его очень низкий. При одновременном применении с другими миорелаксантами центрального действия дозу толперизона следует уменьшить.

Толперизон усиливает действие нифлумовой кислоты, поэтому при одновременном применении следует рассмотреть возможность снижения дозы нифлумовой кислоты или других нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП).

Особые указания

Наиболее частыми нежелательными реакциями при применении толперизона в пострегиональном периоде были реакции повышенной чувствительности. Их выраженность варьируется от легких кожных реакций до тяжелых системных реакций, включая анафилактический шок. Симптомами реакций повышенной чувствительности могут быть эритема, сыпь, крапивница, зуд, ангионевротический отек, тахикардия, артериальная гипотензия или одышка.

Женщины и пациенты с повышенной чувствительностью к другим препаратам или с аллергией в анамнезе могут быть подвержены более высокому риску повышенной чувствительности к толперизону.

Пациентам следует быть внимательными в отношении любых симптомов повышенной чувствительности. При возникновении симптомов следует немедленно прекратить прием препарата и незамедлительно обратиться к врачу. Не следует повторно назначать ТОЛПИРИЛИД® после эпизода повышенной чувствительности к лекарственному препарату, содержащему толперизон или лидокаин.

Вспомогательные вещества

Метилпарагидроксибензоат

Препарат содержит метилпарагидроксибензоат, который может вызывать аллергические реакции (в том числе, отсроченные) и в исключительных случаях бронхоспазм.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

Толперизон не оказывает влияния на способность управлять транспортными средствами и механизмами. Пациентам, у которых есть головокружение, сонливость, нарушение внимания, эпилепсия, нечеткость зрения или мышечная слабость во время применения толперизона, следует проконсультироваться с врачом.

Форма выпуска

Раствор для внутримышечного введения, 100 мг/мл + 2,5 мг/мл.

По 1 мл в ампулы с точкой или кольцом излома светозащитного нейтрального стекла с классом сопротивления гидролизу HGA1 (первый гидролитический).

По 5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной (ПВХ).

1, 2, 4 или 5 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона для потребительской тары.

По 5 или 10 ампул вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона для потребительской тары с гофрированным вкладышем.

Упаковка для стационаров

По 10 контурных ячеековых упаковок вместе с 10 инструкциями по применению помещают в пачку из картона для потребительской тары.

По 50 или 100 контурных ячеековых упаковок вместе с инструкциями по применению в количестве, равном количеству контурных ячеековых упаковок, помещают в коробку из картона гофрированного.

Срок годности

3 года.

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

Хранить в защищенном от света месте, при температуре от 8 до 15 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Наименование и адрес производителя

Российская Федерация

ООО «Эллара»

601122, Владимирская обл., Петушинский район, г. Покров, ул. Франца Штольверка, д. 20,
стр. 2

Владелец регистрационного удостоверения и организация, принимающая претензии потребителей

Российская Федерация

ООО «Эллара»

601122, Владимирская обл., Петушинский район, г. Покров, ул. Франца Штольверка, д. 20

Тел./факс: (49243) 6-42-22, (49243) 6-42-24

Адрес электронной почты: info@ellara.ru