

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата

ТОЛИЗОР® ИНЪЕКТ

Регистрационный номер: ЛП-№(006494)-(РГ-RU)
Торговое наименование: Толперизор® инъект
Международное непатентованное или групппировочное наименование: толперизон + [лидокаин]
Лекарственная форма: раствор для внутримышечного введения

Состав:
1 мл содержит:
Действующие вещества: толперизона гидрохлорид в пересчете на сухое вещество - 100,0 мг; лидокаина гидрохлорид в пересчете на сухое вещество - 2,5 мг.

Вспомогательные вещества: метилпарагидроксibenзоат - 0,6 мг; диэтиленгликоля моноэтиловый эфир - 0,3 мл; хлористоводородная кислота 0,1М до pH 3,0-4,5; вода для инъекций - до 1,0 мл.

Описание: прозрачная бесцветная или слегка зеленоватая жидкость с характерным запахом.

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

Код АТХ: M03BX04

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Толперизона гидрохлорид тормозит проведение нервных импульсов в первичных афферентных волокнах и двигательных нейронах, что приводит к блокированию спинномозговых моно- и полисинатических 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.

Толперизона гидрохлорид является миорелаксантом центрального действия, оказывает мембраностабилизирующее, местноанестезирующее действие. *Лидокаина гидрохлорид* обладает местноанестезирующим действием и, при дозировании согласно инструкции, системного действия не оказывает.

Фармакокинетика

Абсорбция

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

ТС_{max} при внутримышечном 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).

Биотрансформация

Толперизон: подвергается интенсивному метаболизму в печени и почках.

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

Элиминация

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 неизмененном виде).

Показания к применению

Препарат Толперизор® инъект показан к применению у взрослых в возрасте от 18 лет по показаниям:

- 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 другим компонентам препарата;
- миастения gravis;
- беременность и период грудного вскармливания (см. раздел «Применение при беременности и

в период грудного вскармливания»);

- дети и подростки до 18 лет.

С осторожностью

Препарат следует применять с осторожностью у женщин, пациентов с гиперчувствительностью к другим препаратам или с аллергией в анамнезе, 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 определенно оправдает потенциальный риск для плода.

Период грудного вскармливания

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

Фертильность

По результатам доклинических исследований при применении толперизона у крыс какого-либо воздействия на фертильность и спаривание не наблюдалось.

Способ применения и дозы

Препарат вводится внутримышечно.

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

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 Толперизор® инъект не предназначен для применения у детей и подростков в возрасте до 18 лет.

Побочное действие

Профиль безопасности толперизон-содержащих препаратов подтверждается данными применения большого количества пациентов. Согласно этим данным, наиболее часто описаны нарушения со стороны кожи и подкожных тканей, общие, неврологические и желудочно-кишечные расстройства. Наиболее важными серьезными нежелательными реакциями, связанными с применением препаратов, содержащих толперизона гидрохлорид и лидокаина гидрохлорид, являются анемия, лимфаденопатия, реакции гиперчувствительности, тремор, эпилепсия, стенокардия.

Ниже перечислены нежелательные реакции, сгруппированные по системно-органной классификации с указанием частоты их развития в соответствии с рекомендациями Всемирной Организацией Здравоохранения (ВОЗ): *очень часто* (≥ 1/10); *часто* (≥ 1/100 до < 1/10); *нечасто* (≥ 1/1000 до < 1/100); *редко* (≥ 1/10000 до < 1/1000); *очень редко* (< 1/10000); *частота неизвестна* (не может быть оценена на основе имеющихся данных).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Очень редко: анемия, лимфаденопатия.

Нарушения со стороны иммунной системы

Редко: реакция гиперчувствительности, 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 ерудной 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

Часто: ощущение тепла в месте введения, покраснение в месте введения препарата;

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.

Передозировка

Симптомы

Симптомы передозировки чаще всего включают: сонливость, желудочно-кишечные расстройства (тошнота, рвота, боль в эпигастрии), тахикардия, артериальная гипертензия, брадикинезия 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 средствами

Исследования фармакокинетического лекарственного взаимодействия с маркерным субстратом изофермента CYP2D6 декстраметорфаном показали, что одновременное применение толперизона может повысить содержание в крови лекарственных средств, которые метаболизируются преимущественно изоферментом CYP2D6 (тиоридазин, толтеродин, венлафаксин, атомоксетин, 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 пострегистрационном периоде были реакции гиперчувствительности. Их выраженность варьируется от легких кожных реакций до тяжелых системных реакций, включая анафилактический шок. Симптомами реакций гиперчувствительности могут быть эритема, сыпь, крапивница, зуд, ангионевротический отек, тахикардия, артериальная гипотензия или одышка.

Женщины и пациенты с гиперчувствительностью к другим препаратам или с аллергией в анамнезе могут быть подвержены более высокому риску гиперчувствительности к толперизону.

Пациентам следует быть внимательными в отношении любых симптомов гиперчувствительности. При возникновении симптомов следует немедленно прекратить прием препарата и незамедлительно обратиться к врачу. Не следует повторно назначать препарат Толперизор® инъект после эпизода гиперчувствительности к лекарственному препарату, содержащему толперизон или лидокаин. **Вспомогательные вещества**

Препарат Толперизор® инъект содержит метилпарагидроксibenзоат, который может вызывать аллергические реакции (в том числе, отсроченные) и в исключительных случаях бронхоспазм.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, 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 препарата в ампулы светозащитного нейтрального стекла первого гидролитического класса с цветной точкой и насечкой или с цветным кольцом излома. На ампулы дополнительно может наноситься одно цветное кольцо.

На ампулы наклеивают этикетку.

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

По 1 или 2 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в картонную упаковку (пачку).

Условия хранения

При температуре не выше 15 °C в картонной упаковке (пачке). Не замораживать.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Держатель регистрационного удостоверения

ООО «Атолл»

Россия, 445351, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Производитель

ООО «Озон»

Россия, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Организация, принимающая претензии потребителей

ООО «Озон»

Россия, 445351, Самарская обл., г.о. Жигулевск, г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел.: +79874599991, +79874599992

E-mail: ozon@ozon-pharm.ru