

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата

Лидамитол**Регистрационный номер:****Торговое наименование:** Лидамитол**Группировочное наименование:** Толперизон + [Лидокаин]**Лекарственная форма:** раствор для внутримышечного введения**Состав**

1 мл препарата содержит:

Действующие вещества:

Толперизона гидрохлорид 100 мг

Лидокаина гидрохлорида моногидрат

(в пересчете на лидокаина гидрохлорид) 2,5 мг

Вспомогательные вещества:

Метилпарагидроксibenзоат 0,6 мг

Пропиленгликоль 0,3 мл

0,1 М раствор хлористоводородной кислоты до pH 3,0-4,5

Вода для инъекций до 1 мл

Описание

Прозрачная бесцветная или окрашенная жидкость со специфическим запахом.

Фармакотерапевтическая группа

Миорелаксанты; миорелаксанты центрального действия; другие миорелаксанты центрального действия.

Код АТХ: M03BX04**Фармакологические свойства****Фармакодинамика**Механизм действия и фармакодинамические эффекты*Толперизона гидрохлорид* – миорелаксант центрального действия. Оказывает мембрано-стабилизирующее, местноанестезирующее действие, тормозит проведение нервных им-

пульсов в первичных афферентных волокнах и двигательных нейронах, что приводит к блокированию спинномозговых моно- и полисинаптических рефлексов. Предположительно, толперизон 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 усиливает периферическое кровоснабжение. Это действие не связано с воздействием препарата на центральную нервную систему 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

Абсорбция

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

$TC_{\max}$ 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).

Биотрансформация

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.

Элиминация

Толперизон: выводится почками, практически полностью (более 99 %) в виде метаболитов, фармакологическая активность которых неизвестна. При внутривенном введении период полувыведения ~ 1,5 ч.

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

Показания к применению

- Симптоматическое лечение спастичности у взрослых, обусловленной инсультом.
- Миофасциальный болевой синдром средней и тяжелой степени (в т.ч. мышечный спазм

при дорсопатиях).

Противопоказания

- Гиперчувствительность к толперизону, 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, у пациентов с почечной и печеночной недостаточностью.

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 оправдывает потенциальный риск для плода.

Лактация

Поскольку данные о выделении толперизона с грудным молоком отсутствуют, то его применение в период кормления грудью противопоказано.

Способ применения и дозы

Режим дозирования

Взрослым

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

Способ применения

Внутримышечно.

Порядок работы с полимерной ампулой:

1. Взять ампулу и встряхнуть ее, удерживая за горлышко.
2. Вращающими движениями повернуть и отделить клапан от ампулы.
3. Через образовавшееся отверстие немедленно соединить луер шприца с ампулой.
4. Набрать в шприц содержимое ампулы.
5. Надеть иглу на шприц.

Побочное действие

Профиль безопасности толперизона оценивался по данным постмаркетингового применения более чем у 12000 пациентов.

В соответствии с этими данными наиболее частыми были нарушения со стороны кожи и подкожных тканей, общие расстройства, нарушения со стороны нервной системы и желудочно-кишечного тракта.

При постмаркетинговом применении реакции повышенной чувствительности составили 50–60 % всех нежелательных реакций. Большинство нежелательных реакций не были серьезными и проходили самостоятельно. Жизнеугрожающие реакции повышенной чувствительности регистрировались очень редко.

Нежелательные реакции распределены в зависимости от частоты их возникновения: 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 (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Класс системы органов	Частота возникновения	Нежелательная реакция
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	Ангioneвротический 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, кожный 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 передозировки чаще всего включают: сонливость, желудочно-кишечные нарушения (тошнота, рвота, боль в эпигастрии), тахикардия, повышение артериального давления, брадикинезия и вертиго. В тяжелых случаях судороги, угнетение дыхания,

апноэ и кома.

Лечение: специфического антидота нет, рекомендована симптоматическая терапия.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

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, 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 уменьшение дозы нифлумовой кислоты или других нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП).

Особые указания

Наиболее частыми нежелательными реакциями при применении толперизона в пострегистрационном периоде были реакции повышенной чувствительности. Их выраженность варьирует 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 толперизон после эпизода повышенной чувствительности к лекарственному препарату, содержащему толперизон или лидокаин.

Вспомогательные вещества

В состав препарата входит метилпарагидроксибензоат (Е218), который может вызвать аллергические реакции (возможно, 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 (Политвист) из полиэтилена низкой плотности со скручивающимся колпачком для безыгольного забора препарата или в ампулы из окрашенного стекла.

По 5 или 10 ампул из полиэтилена низкой плотности вместе с инструкцией по применению в пачке из картона.

По 5 или 10 ампул из окрашенного стекла в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной или полиэтилентерефталатной с пленкой полимерной или с фольгой алюминиевой лакированной, или без пленки полимерной и фольги алюминиевой лакированной, или в форме из картона с ячейками для укладки ампул.

По 1 контурной ячейковой упаковке или форме из картона с 5 или 10 ампулами или по 2 контурные ячейковые упаковки или формы из картона с 5 ампулами вместе с инструкцией по применению и скарификатором ампульным или без него в пачке из картона.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 15 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не применять после окончания срока годности!

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения

ООО «Гротекс»

Россия, 195279, Санкт-Петербург

Индустриальный пр., д. 71, к. 2, лит. А

Тел.: +7 812 385 47 87

Факс: +7 812 385 47 88

Производитель/Организация, принимающая претензии

ООО «Гротекс»

Россия, 195279, Санкт-Петербург

Индустриальный пр., д. 71, к. 2, лит. А

Тел.: +7 812 385 47 87

Факс: +7 812 385 47 88

www.solopharm.com

www.lidamitol.ru