

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

МЕДОКАЛМИЗОН

Регистрационный номер:

Торговое наименование: МЕДОКАЛМИЗОН

Международное непатентованное или группировочное наименование: толперизон +
[лидокаин]

Лекарственная форма: раствор для внутримышечного введения

Состав на 1 мл:

Действующие вещества: толперизона гидрохлорид – 100,0 мг, лидокаина гидрохлорида моногидрат (в пересчете на лидокаина гидрохлорид) – 2,5 мг.

Вспомогательные вещества: метилпарагидроксибензоат (метилпарабен), диэтиленгликоля моноэтиловый эфир, 0,1 М раствор хлористоводородной кислоты, вода для инъекций.

Описание

Прозрачный бесцветный или желтоватый, или зеленовато-желтоватый раствор со специфическим запахом.

Фармакотерапевтическая группа: миорелаксанты; миорелаксанты центрального действия; другие миорелаксанты 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. 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 (ЦНС) 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

Толперизона гидрохлорид подвергается интенсивному метаболизму в печени и почках. Выводится почками, практически полностью (более 99 %) в виде метаболитов, фармакологическая активность которых неизвестна. При внутривенном введении период полувыведения ~ 1,5 ч.

Лидокаина гидрохлорид: абсорбция – полная (скорость абсорбции зависит от места введения и дозы). Время достижения максимальной концентрации в плазме крови при внутримышечном введении – 30–45 мин. 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). Метаболизируется в печени (на 90–95 %) с участием микросомальных ферментов путем дезалкилирования аминогруппы и разрыва амидной связи с образованием активных метаболитов. Выводится с желчью (часть дозы подвергается реабсорбции в желудочно-кишечном тракте) и почками (до 10 % в неизменном виде).

Показания к применению

Препарат МЕДОКАЛМИЗОН показан к применению у взрослых в возрасте от 18 лет.

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

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к толперизону или химически сходному эперизону или к любому из компонентов препарата, в том числе к лидокаину;
- Миастения gravis;
- Беременность и период грудного вскармливания;
- Дети и подростки до 18 лет.

С осторожностью

Препарат следует применять с осторожностью женщинам, пациентам с повышенной чувствительностью к другим препаратам или с аллергией в анамнезе (см. раздел «Особые указания»), пациентам 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 оправдывает потенциальный риск для плода.

Период грудного вскармливания

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

Способ применения и дозы

Взрослым 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.

Применение у детей

Применение препарата у детей в возрасте до 18 лет противопоказано.

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 побочных реакций. Большинство побочных реакций не были серьезными и проходили самостоятельно. Жизнеугрожающие реакции повышенной чувствительности регистрировались очень редко.

Побочные реакции приведены ниже в соответствии с классификацией MedDRA и частотой: 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 (невозможно оценить на основании 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: 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, брадикардия и вертиго.

В тяжелых случаях судороги, угнетение дыхания, апноэ и кома.

Лечение: рекомендуется проведение симптоматической и поддерживающей терапии.

Специфического антидота нет.

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.

В случае известной повышенной чувствительности к лидокаину при применении толперизона следует соблюдать повышенную осторожность из-за возможных перекрестных реакций.

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, его содержащему.

Вспомогательные вещества

Препарат содержит метилпарагидроксибензоат, который может вызвать аллергические реакции (возможно, отсроченные) и, в исключительных случаях, бронхоспазм.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

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

Форма выпуска

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

По 1 мл препарата в ампулы светозащитного стекла с кольцом излома или с надрезом и точкой. На ампулы дополнительно может быть нанесено одно, два или три цветных кольца. На ампулу наклеивают самоклеящуюся этикетку.

3, 5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и пленки полимерной или без пленки полимерной.

1, 2 контурные ячейковые упаковки помещают в пачку из картона.

В каждую пачку вкладывают инструкцию по медицинскому применению, скарификатор ампульный. Скарификатор ампульный не вкладывают при использовании ампул с кольцом излома или с надрезом и точкой.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре от 2 до 8 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Владелец регистрационного удостоверения

Российская Федерация

Общество с ограниченной ответственностью «Велфарм УК» (ООО «Велфарм УК»)

125239, г. Москва, ул. Коптевская, 83, корп. 1, оф. 16

Производитель/ Организация, принимающая претензии

Российская Федерация

Общество с ограниченной ответственностью «Велфарм» (ООО «Велфарм»)

Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 11

Тел.: +7 (3522) 48-60-00

E-mail: fsk@velpharm.ru

Сообщить о нежелательных реакциях можно по телефону +7 (3522) 55-51-80 или на сайте:

www.brwaygroup.ru, в разделе «ПРОДУКЦИЯ» – «Фармаконадзор».