

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
МИОРИЗОН®

Регистрационный номер: ЛП-006727

Торговое наименование: МИОРИЗОН®

Группировочное наименование: толперизон+[лидокаин]

Лекарственная форма: раствор для внутримышечного введения

Состав

1 мл раствора содержит:

Действующие вещества:

толперизона гидрохлорид – 100,0 мг, лидокаина гидрохлорид – 2,5 мг

Вспомогательные вещества:

метилпарагидроксibenzoат (метилпарабен) – 0,6 мг, диэтиленгликоля моноэтиловый эфир – 0,3 мг, хлористоводородная кислота – до pH 3,0-4,5, вода для инъекций – до 1 мл

Описание:

Прозрачная бесцветная или слегка зеленоватая жидкость 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. 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, почти исключительно ($> 99 \%$) в виде метаболитов, фармакологическая активность которых неизвестна. При внутривенном введении период полувыведения составляет около 1,5 часов.

Лидокаина гидрохлорид: абсорбция – полная (скорость абсорбции зависит от места введения и дозы). T_{max} при внутримышечном введении – 30-45 минут. 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 (ЖКТ) и почками (до 10 % в неизмененном виде).

Показания к применению

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 т.ч. к лидокаину);
- миастения gravis;
- детский возраст до 18 лет;
- беременность;
- период грудного вскармливания.

С осторожностью

Если у Вас одно из перечисленных заболеваний, перед приемом препарата обязательно проконсультируйтесь с врачом.

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

указания»), 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 для матери превышает потенциальный риск для плода.

Грудное вскармливание

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

Способ применения и дозы

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

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

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

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.

Нежелательные явления сгруппированы в соответствии с классификацией органов и систем органов MedDRA, в пределах каждой группы перечислены в порядке уменьшения значимости.

Частота возникновения побочных эффектов определялась в соответствии с классификацией Всемирной Организации Здравоохранения: 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 – реакции повышенной чувствительности, анафилактические реакции; очень редко – анафилактический шок; частота неизвестна – ангионевротический отек, включая отек лица, губ.

Нарушения со стороны обмена веществ и питания: нечасто – анорексия; очень редко – полидипсия.

Нарушения психики: 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 лабиринтные нарушения: 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.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: 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 скелетно-мышечной 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 расстройства и нарушения в месте введения: часто – ощущение тепла в месте введения, покраснение в месте введения препарата; нечасто – дискинезия, астения, дискомфорт, усталость; редко – ощущение покалывания, недостаток энергии, чувство опьянения, ощущение 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 Вы заметили любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

Передозировка

Симптомы: сонливость, желудочно-кишечные нарушения (тошнота, рвота, боль в эпигастрии), тахикардия, повышение артериального давления, брадикинезия, вертиго. В тяжелых случаях судороги, угнетение дыхания, апноэ и кома.

Лечение: специфического антидота нет, при передозировке рекомендуется 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 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 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 вызывать 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. 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 из светозащитного стекла первого гидролитического класса. На ампулы наклеивают этикетки самоклеящиеся.

По 5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой или без фольги.

1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению препарата, скарификатором или ножом ампульным помещают в пачку из картона.

При упаковке ампул с надрезами (насечками) и точками или кольцами излома скарификаторы или ножи ампульные не вкладывают.

Условия хранения

В оригинальной упаковке при температуре от 2 до 8 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не применять после истечения срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель:

Федеральное государственное унитарное предприятие «Московский эндокринный завод»

Юридический адрес: 109052, г. Москва, ул. Новохохловская, д. 25

Производство готовой лекарственной формы:

г. Москва, ул. Новохохловская, д. 25, стр. 2

Выпускающий контроль качества:

г. Москва, ул. Новохохловская, д. 25, стр. 1

Владелец регистрационного удостоверения/наименование, адрес организации, принимающей претензии потребителя:

Федеральное государственное унитарное предприятие «Московский эндокринный завод»

Россия, 109052, г. Москва, ул. Новохохловская, д. 25

Тел./факс: (495) 678-00-50/911-42-10

<http://www.endopharm.ru>

Начальник управления по внедрению
и регистрации лекарственных препаратов
ФГУП «Московский эндокринный завод»



О.В. Баклыкова