

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ТОЛПИРИЛИД®

Регистрационный номер:

Торговое наименование: ТОЛПИРИЛИД®

Международное непатентованное или группировочное наименование:

Толперизон + [Лидокаин]

Лекарственная форма: раствор для внутривенного или внутримышечного введения

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:

Метилпарагидроксibenзоат - 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 мембрано-стабилизирующее, 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

Толперизон подвергается интенсивному метаболизму в печени и почках. Выводится почками, практически полностью (> 99%) в виде метаболитов, фармакологическая активность которых неизвестна. При внутривенном введении период полувыведения ($T_{1/2}$) – около 1,5 ч.

Лидокаин: абсорбция – полная (скорость абсорбции зависит от места введения и дозы). TC_{max} при в/м введении – 30-45 мин. Связь с белками плазмы – 50-80%.

Быстро распределяется в тканях и органах. Проникает через 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 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 (включая лидокаин); миастения gravis; беременность и период грудного вскармливания; дети и подростки до 18 лет.

С осторожностью

Препарат следует применять с осторожностью у 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

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 (особенно в I триместре беременности).

Период грудного вскармливания

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

Способ применения и дозы

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

Пациенты с почечной и/или печеночной недостаточностью: опыт применения толперизона у пациентов с почечной и/или печеночной недостаточностью ограничен, у данной категории пациентов чаще возникают нежелательные реакции. Поэтому у пациентов с нарушениями функции почек/печени средней степени необходимо проводить подбор дозы толперизона с тщательным наблюдением за состоянием здоровья пациента и контролем функции почек/печени. При тяжелом поражении почек/печени назначение толперизона не рекомендуется.

Побочное действие

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* (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 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 почек и мочевыводящих путей: *редко:* энурез, протеинурия.

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

Общие расстройства и нарушения 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 нарушения (тошнота, рвота, боль в эпигастрии), тахикардия, повышение артериального давления, брадикардия и вертиго. В тяжелых случаях атаксия, тонико-клонические судороги, одышка и дыхательный паралич.

Лечение: специфического антидота нет. Рекомендуется проведение симптоматической и поддерживающей 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, 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 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.

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 толпери-

зон 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 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 внутривенного и внутримышечного введения, 100 мг/мл + 2,5 мг/мл.

По 1 мл в ампулы с точкой или кольцом излома светозащитного нейтрального стекла марки СНС-1 или стекла с классом сопротивления гидролизу НГА1 (первый гидролитический).

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

1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона для потребительской тары.

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

Упаковка для стационаров

По 4, 5 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкциями по применению в количестве, равном количеству контурных ячейковых упаковок, помещают в пачку из картона для потребительской тары.

По 50 или 100 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкциями по применению в количестве, равном количеству контурных ячейковых 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

ООО «Эллара»

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

Владелец регистрационного удостоверения и организация, принимающая претензии потребителей

ООО «Эллара»

601122, Владимирская обл., Петушинский район, г. Покров, ул. Франца Штольверка, д. 20
тел./факс: (49243) 6-42-22, (49243) 6-42-24

Начальник отдела регистрации

ООО «Эллара»



Виноградова И.В.