

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Толперизон+Лидокаин-Бинергия, 100 мг + 2,5 мг/мл, раствор для внутримышечного введения.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующие вещества: толперизон + [лидокаин]

Каждая ампула (1 мл) содержит 100 мг толперизона гидрохлорид и 2,5 мг лидокаина гидрохлорид.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: метилпарагидроксibenзоат (см. раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Раствор для внутримышечного введения.

Прозрачный бесцветный или слегка зеленоватый раствор с характерным запахом.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**Показания к применению**

Лекарственный препарат показан к применению взрослым пациентам с 18 лет.

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

4.2. Режим дозирования и способ примененияРежим дозирования

Взрослым

Ежедневно внутримышечно 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 Толперизон+Лидокаин-Бинергия не предназначен для применения у детей и подростков в возрасте до 18 лет.

Способ применения

Внутримышечно.

Противопоказания

Гиперчувствительность к толперизону, химически сходному эперизону или лидокаину или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;

Миастения gravis;

- Беременность и период грудного вскармливания;
- Дети и подростки до 18 лет.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

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.

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, содержащему толперизон или лидокаин.

Вспомогательные вещества

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

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие формы взаимодействия

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).

4.6. Фертильность, беременность и лактация

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.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с 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.

Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

Наиболее частыми являются 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 нежелательных реакций не были серьезными и проходили самостоятельно. Жизнеугрожающие реакции повышенной чувствительности регистрировались очень редко.

Табличное резюме нежелательных реакций

Нежелательные реакции распределены по системно-органным классам в соответствии с классификацией MedDRA и частотой: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$ до $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Системно-органный класс	Частота	Нежелательные реакции
Нарушения со стороны крови и лимфотической 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,	Редко	Одышка, носовое кровотечение, учащенное дыхание

органов грудной клетки и средостения		
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	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

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации

лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза-риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств-членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация:

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Адрес: 109012, Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Телефон: +7 800-550-99-03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

www.roszdravnadzor.gov.ru

Передозировка

Симптомы

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

Специфического антидота нет, рекомендована симптоматическая терапия.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

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

Код АТХ: M03BX04.

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

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 ретикулоспи-

нальному 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.

5.2. Фармакокинетические свойства

Толперизон подвергается интенсивному метаболизму в печени и почках. Выводится почками, практически полностью (более 99 %) в виде метаболитов, фармакологическая активность которых неизвестна.

Лидокаин абсорбируется полностью (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 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).

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

метилпарагидроксибензоат

диэтиленгликоля моноэтиловый эфир

хлористоводородной кислоты раствор 1 М (для коррекции pH)

Вода для инъекций.

Несовместимость

В связи с отсутствием исследований совместимости, данный лекарственный препарат не следует смешивать с другими лекарственными препаратами.

Срок годности

3 года.

Особые меры предосторожности при хранении

При температуре не выше 8 °С в оригинальной упаковке (картонной пачке).

Характер и содержание первичной упаковки

По 1 мл препарата в ампулы из светозащитного стекла 1-го гидролитического класса с цветной точкой излома и насечкой или цветным кольцом излома.

По 5 ампул помещают в контурную пластиковую упаковку (поддон) из пленки поливинилхлоридной или из пленки полиэтилентерефталатной.

По 1 или 2 контурные пластиковые упаковки (поддона) с ампулами вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения препарата и другие манипуляции с препаратом

Нет особых требований к утилизации.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

АО «Бинергия»

Россия, 143930, Московская область, г.о. Балашиха, г. Балашиха, мкр. Салтыковка,
ш. Разинское, д. 69, эт. /помещ. 1/41, офис 106А

Тел.: 8 (495) 580-55-02

Факс: 8 (495) 580-55-03

Электронная почта: info@binergia.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

АО «Бинергия»

Россия, 143930, Московская область, г.о. Балашиха, г. Балашиха, мкр. Салтыковка,
ш. Разинское, д. 69, эт. /помещ. 1/41, офис 106А

Тел.: 8 (495) 580-55-02

Факс: 8 (495) 580-55-03

Электронная почта: info@binergia.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

**9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ,
ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)**

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Толперизон+Лидокаин-Бинергия с адреналином форте доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <https://eec.eaeunion.org/>