

## ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

### ТОЛПЕРІЛ-ЗДОРОВ'Я

#### Склад:

*діючі речовини:* tolperisone, lidocaine;

1 мл розчину містить толперизону гідрохлориду 100 мг, лідокаїну гідрохлориду 2,5 мг;

*допоміжні речовини:* діетиленгліколю моноетиловий ефір, метилпарабен (Е 218), вода для ін'єкцій.

**Лікарська форма.** Розчин для ін'єкцій.

**Основні фізико-хімічні властивості:** прозорий, безбарвний або злегка забарвлений розчин.

**Фармакотерапевтична група.** Міорелаксанти центральної дії. Код АТХМ03В Х04.

#### **Фармакологічні властивості.**

**Фармакодинаміка.** Міорелаксанти центральної дії. Механізм дії зумовлений гальмуванням провідності імпульсів первинних аферентних волокон і рухових нейронів у результаті мембраностабілізуючої і місцевоанестезуючої дії, що призводить до блокування спинномозкових моно- і полісинаптичних рефлексів. Шляхом гальмування надходження  $Ca^{2+}$  у синапси вторинно перешкоджає виходу медіаторів. Гальмує проведення збудження за ретикулоспінальним шляхом. Посилює периферичний кровотік незалежно від впливу ЦНС. У розвитку цього ефекту може відігравати роль слабкий спазмолітичний і антиенергетичний ефект толперизону.

**Фармакокінетика.** Біодоступність внаслідок вираженого метаболізму становить близько 20 %. Метаболізується у печінці і нирках. Фармакологічна активність метаболітів невідома. Т<sub>1/2</sub> після внутрішньовенного введення становить приблизно 1,5 години. Виводиться нирками, більше 99 % – у вигляді метаболітів.

#### **Клінічні характеристики.**

**Показання.** М'язова спастичність, включаючи постінсультну спастичність, у випадках, коли ін'єкційна форма є формою вибору.

**Протипоказання.** Підвищена чутливість до компонентів у препараті/амідних місцевоанестезуючих засобів, еперизону. М'ястенькі гравіс.

**Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.** Одночасне призначення толперизону підвищує концентрації у крові препаратів, які переважно метаболізуються CYP2D6, зокрема тіоридазину, толтеродину, венлафаксину, атомоксетину, дезипраміну, декстрометорфану, метопрололу, небололу, перфеназину. Значущого інгібування або індукції інших ізоферментів CYP (2B6, 2C8, 2C9, 2C19, 1A2, 3A4) не виявлено.

Очікується, що при одночасному прийомі з іншими субстратами CYP2D6 і/або іншими препаратами експозиція толперизону зростати не буде, що зумовлено різноманітністю шляхів метаболізму толперизону.

Толперизон посилює дію ніфлумової кислоти, тому при одночасному застосуванні може знадобитися зниження дози останньої, так само, як і інших НПЗП.

Хоча толперизон є препаратом центральної дії, ймовірність розвитку седативного ефекту при його застосуванні мала. У разі одночасного призначення з іншими міорелаксантами центральної дії необхідно розглянути питання про зниження дози толперизону.

**Особливості застосування.** Препарат не призначати дітям.

При застосуванні толперизону найбільш часто повідомлялося про реакції гіперчутливості. Їх вираженість варіює від легких шкірних реакцій до тяжких системних реакцій, включаючи анафілактичний шок. Симптомами реакцій гіперчутливості можуть бути еритема, висипи, кропив'янка, свербіж, ангіоневротичний набряк, тахікардія, артеріальна гіпотензія або задишка.

У жінок з гіперчутливістю до інших препаратів або алергічними станами в анамнезі ризик реакцій гіперчутливості при застосуванні толперизону більш високий.

Необхідно рекомендувати пацієнтам пам'ятати про можливість алергії. Пацієнти мають бути проінформовані про те, що при появі симптомів алергії слід припинити прийом толперизону і негайно звернутися за медичною допомогою.

Після епізоду гіперчутливості до толперизону повторно призначати препарат не можна.

Препарат містить лідокаїн, тому у разі відомої гіперчутливості до лідокаїну та інших амідних місцевоанестезуючих засобів препарат не слід застосовувати у зв'язку з можливістю розвитку перекресних алергічних реакцій.

**Застосування у період вагітності або годування груддю.** Існують дані, що толперизон не чинить тератогенну дію у тварин. Застосування препарату у І триместрі вагітності протипоказане. Застосування препарату у II і III триместрах вагітності можливе, коли, на думку лікаря, очікувана користь значною мірою перевищує потенційний ризик для плода/дитини.

Оскільки невідомо, чи проникає толперизон у грудне молоко, застосування препарату у період годування груддю протипоказане.

**Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.** Враховуючи можливість розвитку запаморочення, сонливості, порушення уваги, епілепсії, нечіткості зору, слід з обережністю застосовувати препарат при керуванні автотранспортом та іншими механізмами.

**Спосіб застосування і дози.** Тільки для парентерального введення дорослим: препарат вводити внутрішньом'язово по 1 мл 2 рази на добу або повільно внутрішньовенно по 1 мл 1 раз на добу. Тривалість лікування визначає лікар залежно від характеру перебігу захворювання і ефективності лікування.

**Діти.** Ін'єкційний розчин не застосовувати дітям.

**Передозування.** Дані щодо передозування обмежені. Препарат має широкий терапевтичний індекс, за даними доза 600 мг, застосована внутрішньо дітям, не викликала симптомів передозування. Дратівливість спостерігалася, коли дітям давали внутрішньо 300-600 мг на добу. Існують дані, що введення високих доз викликало атаксію, тоніко-клонічні судими, утруднення зупинку дихання.

**Лікування:** відміна препарату, симптоматична підтримуюча терапія. Специфічного антитоду немає.

**Побічні реакції.** Приблизно 50-60 % випадків побічних реакцій, асоційованих із застосуванням толперизону, становили реакції гіперчутливості. Загалом, ці реакції були несерйозними і проходили самостійно. Реакції гіперчутливості, що являють собою загрозу для життя, виникали у поодиноких випадках.

**З боку системи крові і лімфатичної системи:** анемія, лімфаденопатія.

**З боку імунної системи:** реакція гіперчутливості, анафілактична реакція, анафілактичний шок.

**Психічні розлади:** безсоння, порушення сну, зниження активності, депресія, сплутаність свідомості.

**З боку нервової системи:** головний біль, запаморочення, сонливість, порушення уваги, тремор, судими, піщестезія, парестезія, летаргія.

**З боку органів чуття:** порушення зору, шум у вухах, вертиго.

**З боку судинної системи:** гіпотонія, гіперемія шкіри.

**З боку серця:** стенокардія, тахікардія, прискорене серцебиття, зниження артеріального тиску, брадикардія.

**З боку дихальної системи:** утруднення дихання, носова кровотеча, задишка.

**З боку травної системи:** нудота, блювання, відчуття дискомфорту у животі, діарея, сухість слизової оболонки порожнини рота, диспепсія, біль у епігастрії, запор, метеоризм, пошкодження печінки легкого ступеня.

**З боку шкіри:** алергічний дерматит, п'єрідроз, свербіж, кропив'янка, висипи.

**З боку кістково-м'язової системи:** м'язова слабкість, міалгія, відчуття дискомфорту/біль у кінцівках, остеопенія.

**З боку сечовидільної системи:** енурез, протейурія.

**Загальні порушення:** астенія, дискомфорт, підвищена стомлюваність, анорексія, відчуття сп'яніння, відчуття жару, дратівливість, спрага, полідипсія, відчуття дискомфорту у грудях, зміни у місці введення препарату (у т. ч. почервоціння).

**З боку лабораторних показників:** підвищення концентрації білірубину у крові, зміна активності печінкових ферментів, зниження кількості тромбоцитів, лейкоцитоз, підвищення концентрації креатиніну у крові.

**Термін придатності.** 3 роки.

**Умови зберігання.** Зберігати в оригінальній упаковці при температурі від 2 °С до 8 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці.

**Несумісність.** Дані відсутні, тому препарат не слід змішувати з іншими лікарськими засобами в одному шприці. Вводити окремо від інших препаратів.

**Упаковка.** Розчин для ін'єкцій в ампулах по 1 мл № 5 у коробці; № 5 або № 5x2 у блістері, в коробці.

**Категорія відпуску.** За рецептом.

**Виробник.** ТОВ «Фармацевтична компанія «Здоров'я».

**Місцезнаходження.** Україна, 61013, м. Харків, вул. Шевченка, 22.