

Склад

діючі речовини: толперизону гідрохлорид, лідокаїну гідрохлорид;

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

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

Лікарська форма

Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: безбарвний або трохи зеленкуватого кольору прозорий розчин, що практично не містить часточок.

Фармакотерапевтична група

Міорелаксанти з центральним механізмом дії.

Код АТС М03В Х04.

Фармакодинаміка

Міорелаксанти центральної дії. Точний механізм дії невідомий. У результаті мембраностабілізуючої та місцевоанестезуючої дії перешкоджає проведенню збудження у первинних аферентних волокнах, блокуючи моно- і полісинаптичні рефлекси спинного мозку. Вторинний механізм дії полягає у блокуванні вивільнення трансмітера шляхом блокади надходження іонів кальцію у синапси.

Знижує рефлекторну готовність у ретикулоспинальних шляхах стовбура мозку. Знижує підвищений тонус і ригідність м'язів, обумовлені децеребрацією тварин у ході експерименту.

Підсилює периферичний кровообіг. Ця дія не пов'язана із впливом препарату на центральну нервову систему. Вона може бути обумовлена слабкою спазмолітичною та антиадренергічною дією толперизону.

Фармакокінетика

Піддається інтенсивному метаболізму у печінці і нирках. Виводиться нирками, більше 99 % - у вигляді метаболітів. Фармакологічна активність метаболітів

невідома. При внутрішньовенному введенні період напіввиведення становить приблизно 1,5 год.

Показання

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

Протипоказання

Гіперчутливість до діючих речовин або подібного з толперизоном за хімічним складом еперизону, а також до будь-якої з допоміжних речовин та до інших амідних місцевоанестезуючих засобів.

Міастенія гравіс.

Період годування груддю.

Дитячий вік.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій

Фармакокінетичні дослідження лікарських взаємодій з декстрометорфаном, субстратом CYP2D6, продемонстрували, що одночасне призначення толперизону підвищує концентрації в плазмі крові препаратів, які переважно метаболізуються цитохромом CYP2D6, зокрема тіоридазину, толтеродину, венлафаксину, атомoksetину, дезипраміну, декстрометорфану, метопрололу, небівололу, перфеназину.

У ході досліджень *in vitro* в мікросомах печінки і гепатоцитах людини значущого інгібування або індукції інших ізоферментів CYP (CYP2B6, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP1A2, CYP3A4) не виявлено.

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

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.

Толперизон потенціює ефекти ніфлумінової кислоти, тому при одночасному прийомі з толперизоном дозу ніфлумінової кислоти, так само, як і інших НПЗП,

доцільно зменшити.

Несумісність

Дані щодо дослідження сумісності відсутні, тому препарат Мідокалм не слід змішувати з іншими лікарськими засобами в одному шприці. Вводити окремо від інших препаратів.

Особливості застосування

Ін'єкційну форму препарату не призначати дітям.

Реакції гіперчутливості

При постмаркетинговому спостереженні 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, висип, 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 прийомі толперизону більш високий.

Необхідно рекомендувати пацієнтам пам'ятати про можливих алергії. Пацієнти повинні бути інформовані 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, а також до інших амідних місцевоанестезуючих засобів Мідокалм для ін'єкцій не слід застосовувати у зв'язку з можливістю розвитку перехресних алергічних реакцій.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами

Враховуючи можливість розвитку таких симптомів, як запаморочення, сонливість, порушення уваги, епілепсія, нечіткість зору, слід з обережністю застосовувати препарат при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Застосування у період вагітності або годування груддю

За даними досліджень на тваринах толперизон не чинить тератогенної дії.

Застосування препарату у I триместрі вагітності протипоказане.

Зважаючи на відсутність значущих клінічних даних, застосування препарату Мідокалм у II та III триместрі 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 Мідокалму у період годування груддю протипоказане.

Спосіб застосування та дози

Тільки для парентерального введення.

Застосовувати тільки дорослим. Препарат вводити внутрішньом'язово по 100 мг двічі на день або у вигляді повільної внутрішньовенної ін'єкції по 100 мг 1 раз на день.

Ін'єкційний розчин не можна застосовувати дітям.

Тривалість лікування визначає лікар залежно від характеру перебігу захворювання та ефективності лікування.

Діти

Розчин для ін'єкцій Мідокалм не застосовувати дітям.

Передозування

Дані щодо передозування Мідокалмом обмежені. Мідокалм має широкий терапевтичний індекс. За даними, доза 600 мг, застосована внутрішньо дітям, не викликала серйозних симптомів передозування.

Дратівливість спостерігалася в тих випадках, коли дітям давали внутрішньо 300-600 мг на добу. У ході доклінічних досліджень гострої токсичності введення високих доз викликало атаксію, тоніко-клонічні судоми, утруднення і зупинку дихання.

Для толперизону не існує специфічного антидоту. У разі передозування рекомендується симптоматичне та підтримуюче лікування.

Побічні реакції

Профіль безпеки толперизона оцінювався за даними постмаркетингового застосування більш ніж у 12000 пацієнтів.

Відповідно до цих даних, найбільш частими були порушення з боку шкіри і підшкірних тканин, загальні розлади, порушення з боку нервової системи і шлунково-кишкового тракту.

При постмаркетинговому застосуванні реакції підвищеної чутливості склали 50-60% всіх побічних реакцій. Більшість побічних реакцій не були серйозними і проходили самостійно. Жизнеугрожаючі реакції підвищеної чутливості реєструвалися дуже рідко.

Побічні реакції наведені нижче відповідно до класифікації MedDRA і частотою: нечасто (від $\geq 1 / 1000$ до $< 1/100$); рідко (від $\geq 1 / 10000$ до $< 1/1000$); дуже рідко ($< 1/10000$); частота невідома (неможливо оцінити на підставі наявних даних).

З боку крові та лімфатичної системи: дуже рідко - анемія, лімфаденопатія.

З боку імунної системи: рідко - реакція підвищеної чутливості, анафілактична реакція; дуже рідко - анафілактичний шок; частота невідома - ангіоневротичний набряк, включаючи набряк обличчя, губ.

З боку обміну речовин: нечасто - анорексія; дуже рідко - полідипсія.

Порушення психіки: нечасто - безсоння, порушення сну; рідко - зниження активності, депресія; дуже рідко - сплутаність свідомості.

З боку нервової системи: нечасто - головний біль, запаморочення, сонливість; рідко - порушення уваги, тремор, епілепсія, гіпестезія, парестезія, летаргія.

З боку органу зору: рідко - нечіткість зору.

З боку органів слуху та лабіринтові порушення: рідко - шум у вухах, вертиго.

З боку серця: рідко - стенокардія, тахікардія, відчуття серцебиття; дуже рідко - брадикардія.

З боку судин: нечасто - артеріальна гіпотензія; рідко - "припливи".

З боку дихальної системи: рідко - задишка, носова кровотеча, прискорене дихання.

З боку шлунково-кишкового тракту: нечасто - дискомфорт в животі, діарея, сухість у роті, диспепсія, нудота; рідко - біль в епігастральній ділянці, запор,

метеоризм, блювання.

З боку печінки та жовчовивідних шляхів: рідко - печінкова недостатність легкого ступеня.

З боку шкіри і підшкірних тканин: рідко - алергічний дерматит, підвищена пітливість, свербіж, кропив'янка, висип.

З боку нирок і сечовивідних шляхів: рідко - енурез, протеїнурія.

З боку кістково-м'язової системи та сполучної тканини: нечасто - м'язова слабкість, біль у м'язах, біль у кінцівках; рідко - дискомфорт в кінцівках; дуже рідко - остеопенія.

Загальні розлади і порушення в місці введення: нечасто - астенія, дискомфорт, втома; рідко - відчуття сп'яніння, відчуття жару, дратівливість, спрага; дуже рідко - дискомфорт у грудній клітці.

Лабораторні та інструментальні дані: рідко - зниження артеріального тиску, гіпербілірубінемія, зміна активності печінкових ферментів, тромбоцитопенія, лейкоцитоз; дуже рідко - збільшення концентрації креатиніну в плазмі крові.

Термін придатності

3 роки.

Умови зберігання

Зберігати у недоступному для дітей місці при температурі 8-15 °С в оригінальній упаковці для захисту від впливу світла.

Упаковка

По 1 мл в ампулі з коричневого скла, по 5 ампул у картонній упаковці.

Категорія відпуску

За рецептом.

Виробник

ВАТ «Гедеон Ріхтер», Угорщина.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності

Н-1103 Будапешт, вул. Демреї, 19-21, Угорщина.

Джерело інструкції

Інструкцію лікарського засобу взято з офіційного джерела — [Державного реєстру лікарських засобів України](#).