

Состав

действующие вещества: толперизон гидрохлорид, лидокаина гидрохлорид;

1 мл 100 мг толперизон гидрохлорида и 2,5 мг лидокаина гидрохлорида;

вспомогательные вещества: метилпарагидроксибензоат (Е 218), диэтиленгликоля моноэтиловый эфир, вода для инъекций.

Лекарственная форма

Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: бесцветный или немного зеленого цвета прозрачный раствор, практически не содержит частиц.

Фармакотерапевтическая группа

Миорелаксанты центрального действия.

Код АТС М03В Х04.

Фармакодинамика

Миорелаксант центрального действия. Точный механизм действия неизвестен. В результате мембраностабилизирующей и местноанестезирующего действия препятствует проведению возбуждения в первичных афферентных волокнах, блокируя моно- и полисинаптические рефлексии спинного мозга. Вторичный механизм действия заключается в блокировании высвобождения трансмиттера путем блокады поступления ионов кальция в синапсы.

Снижает рефлекторную готовность в ретикулоспинальных путях ствола мозга. Снижает повышенный тонус и ригидность мышц, обусловлены децеребрацией животных в ходе эксперимента.

Усиливает периферическое кровообращение. Это действие не связано с влиянием препарата на центральную нервную систему. Она может быть обусловлена слабой спазмолитическим и Антиадренергические действием толперизон.

Фармакокинетика

Подвергается интенсивному метаболизму в печени и почках. Выводится почками, 99% - в виде метаболитов. Фармакологическая активность метаболитов неизвестна. При внутривенном введении период полувыведения составляет примерно 1,5 часа.

Показания

Мышечная спастичность, включая постинсультную спастичность, в случаях, когда инъекционная форма является методом выбора.

Противопоказания

Гиперчувствительность к действующим веществам или сходного с толперизон по химическому составу еперизону, а также к любой из вспомогательных веществ и к другим амидных местноанестезирующих средств.

Миастения гравис.

Период кормления грудью.

Детский возраст.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Фармакокинетические исследования лекарственных взаимодействий с декстрометорфаном, субстратом CYP2D6, показали, что одновременное назначение толперизон повышает концентрации в плазме крови препаратов, преимущественно метаболизируются цитохромом CYP2D6, в частности тиоридазина, тольтероидина, венлафаксина, атомoksetин, дезипрамина, декстрометорфана, метопролола, небиволола, перфеназин.

В ходе исследования *in vitro* в микросомах печени и гепатоцитах человека значимого ингибирования или индукции других изоферментов CYP (CYP2B6, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP1A2, CYP3A4) не выявлено.

Ожидается, что при одновременном приеме с другими субстратами CYP2D6 и / или другими препаратами экспозиция толперизон расти не будет, что обусловлено разнообразием путей метаболизма толперизон.

Хотя толперизон является препаратом центрального действия, вероятность развития седативного эффекта при его применении мала. В случае одновременного назначения с другими миорелаксантами центрального действия необходимо рассмотреть вопрос о снижении дозы толперизон.

Толперизон потенцирует эффекты нифлуминовой кислоты, поэтому при одновременном приеме с толперизон дозу нифлуминовой кислоты, так же, как и других НПВП, целесообразно уменьшить.

Несовместимость

Данные по исследованию совместимости отсутствуют, поэтому препарат Мидокалм не следует смешивать с другими лекарственными средствами в одном шприце. Вводить отдельно от других препаратов.

Особенности применения

Инъекционную форму препарата не назначать детям.

Реакции гиперчувствительности

При постмаркетинговом наблюдении при применении толперизон наиболее часто сообщалось о реакции гиперчувствительности. Их выраженность варьирует от легких кожных реакций в тяжелых системных реакций, включая анафилактический шок. Симптомами аллергических реакций могут быть эритема, сыпь, крапивница, зуд, ангионевротический отек, тахикардия, артериальная гипотензия или одышка.

У женщин с гиперчувствительностью к другим препаратам или аллергическими состояниями в анамнезе риск аллергических реакций при приеме толперизон более высокий.

Необходимо рекомендовать пациентам помнить о возможных аллергии. Пациенты должны быть осведомлены о том, что при появлении симптомов аллергии следует прекратить прием толперизон и немедленно обратиться за медицинской помощью.

После эпизода гиперчувствительности к толперизон повторно назначать нельзя

Препарат содержит лидокаин, поэтому в случае известной гиперчувствительности к лидокаина, а также к другим амидных местноанестезирующих средств Мидокалм для инъекций не следует применять в связи с возможностью развития перекрестных аллергических реакций.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Учитывая возможность развития таких симптомов, как головокружение, сонливость, нарушение внимания, эпилепсия, нечеткость зрения, следует с осторожностью применять при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

По данным исследований на животных толперизон не оказывает тератогенного действия.

Применение препарата в I триместре беременности противопоказано.

Ввиду отсутствия значимых клинических данных, применение препарата Мидокалм во II и III триместре беременности возможно, когда, по мнению врача, ожидаемая польза значительной мере превышает потенциальный риск для плода / ребенка.

Поскольку неизвестно, проникает толперизон в грудное молоко, применение Мидокалма в период кормления грудью противопоказано.

Способ применения и дозы

Только для парентерального введения.

Применять только взрослым. Препарат вводить внутримышечно по 100 мг дважды в день или в виде медленной инъекции по 100 мг 1 раз в день.

Инъекционный раствор нельзя применять детям.

Продолжительность лечения определяет врач в зависимости от характера течения заболевания и эффективности лечения.

Дети

Раствор для инъекций Мидокалм не применять детям.

Передозировка

Данные о передозировке Мидокалмом ограничены. Мидокалм обладает широким терапевтическим индексом. По данным, доза 600 мг, применена внутрь детям, не вызвала серьезных симптомов передозировки.

Раздражительность наблюдалась в тех случаях, когда детям давали внутрь 300-600 мг в сутки. В ходе доклинических исследований острой токсичности

введение высоких доз вызвало атаксию, тонико-клонические судороги, затруднение и остановку дыхания.

Для толперизон не существует специфического антидота. В случае передозировки рекомендуется симптоматическое и поддерживающее лечение.

Побочные реакции

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 ЖКТ.

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.

Побочные реакции приведены ниже в соответствии с классификацией MedDRA и частотой: нечасто (от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$); редко (от $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$); частота неизвестна (невозможно оценить на основании имеющихся данных).

Со стороны крови и лимфатической системы: очень редко - анемия, лимфаденопатия.

Со стороны иммунной системы: редко - реакция повышенной чувствительности, анафилактическая реакция; очень редко - анафилактический шок; частота неизвестна - ангионевротический отек, включая отек лица, губ.

Со стороны обмена веществ: нечасто - анорексия; очень редко - полидипсия.

Нарушения психики: нечасто - бессонница, нарушения сна; редко - снижение активности, депрессия; очень редко - спутанность сознания.

Со стороны нервной системы: нечасто - головная боль, головокружение, сонливость; редко - нарушение внимания, тремор, эпилепсия, гипестезия, парестезия, летаргия.

Со стороны органа зрения: редко - нечеткость зрения.

Со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения: редко - шум в ушах, вертиго.

Со стороны сердца: редко - стенокардия, тахикардия, ощущение сердцебиения; очень редко - брадикардия.

Со стороны сосудов: нечасто - артериальная гипотензия; редко - "приливы".

Со стороны дыхательной системы: редко - одышка, носовое кровотечение, учащенное дыхание.

Со стороны ЖКТ: нечасто - дискомфорт в животе, диарея, сухость во рту, диспепсия, тошнота; редко - боль в эпигастральной области, запор, метеоризм, рвота.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: редко - печеночная недостаточность легкой степени.

Со стороны кожи и подкожных тканей: редко - аллергический дерматит, повышенная потливость, зуд, крапивница, сыпь.

Со стороны почек и мочевыводящих путей: редко - энурез, протеинурия.

Со стороны костно-мышечной системы 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 АД, гипербилирубинемия, изменение активности печеночных ферментов, тромбоцитопения, лейкоцитоз; очень редко - увеличение концентрации креатинина в плазме крови.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить в недоступном для детей месте при температуре 8-15 ° С в оригинальной упаковке для защиты от воздействия света.

Упаковка

По 1 мл в ампуле из коричневого стекла, по 5 ампул в картонной упаковке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ОАО «Гедеон Рихтер», Венгрия.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Н-1103 Будапешт, ул. Демреи, 19-21, Венгрия.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).