

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

МІДОКАЛМ
(MYDOCALM)

Склад:

діючі речовини: толперизону гідрохлорид, лідокаїну гідрохлорид;

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

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

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група. Міорелаксанти з центральним механізмом дії.

Код АТС М03В Х04.

Клінічні характеристики.

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.

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.

Побічні реакції.

Побічні реакції наведені за класами систем органів відповідно до Медичного словника регуляторної діяльності MedDRA з використанням визначень частоти MedDRA: дуже часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, $<1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, $<1/100$), рідко ($\geq 1/10000$, $<1/1000$), дуже рідко ($<1/10000$), невідомої частоти (не можна визначити за наявними даними).

За даними постмаркетингового спостереження, приблизно 50-60 % випадків побічних реакцій, асоційованих з прийомом толперизону, становлять реакції гіперчутливості. Більшість цих реакцій були несерйозними і проходили самостійно. Реакції гіперчутливості, що являють собою загрозу для життя, виникали в поодиноких випадках.

Класи системи органів	Часто ($\geq 1/100$, $<1/10$)	Нечасто ($\geq 1/1000$, $<1/100$)	Рідко ($\geq 1/10000$, $<1/1000$)	Дуже рідко ($<1/10000$)
Порушення з боку системи крові та лімфатичної системи				Анемія Лімфаденопатія

Порушення з боку імунної системи			Реакція гіперчутливості Анафілактична реакція	Анафілактичний шок
Порушення харчування та обміну речовин		Анорексія		Полідипсія
Психічні розлади		Безсоння Порушення сну	Зниження активності Депресія	Сплутаність свідомості
Порушення з боку нервової системи		Головний біль Запаморочення Сонливість	Порушення уваги Тремор Судоми Гіпестезія Парестезія Летаргія (підвищена сонливість)	
Порушення з боку органів зору			Порушення зору	
Порушення з боку органів слуху та рівноваги			Шум у вухах Вертиго (запаморочення)	
Порушення з боку серця			Стенокардія Тахікардія Прискорене серцевиття Зниження артеріального тиску	Брадикардія
Порушення з боку судинної системи		Гіпотонія	Гіперемія шкіри	
Порушення з боку дихальної системи, органів грудної клітки і середостіння			Утруднення дихання Носова кровотеча Задишка	
Порушення з боку шлунково-кишкового тракту		Відчуття дискомфорту в животі Діарея Сухість слизової оболонки порожнини рота Диспепсія Нудота	Болі в епігастрії Запор Метеоризм Блювання	
Порушення з боку печінки та жовчовивідних шляхів			Пошкодження печінки легкого ступеня	
Порушення з боку шкіри та підшкірної клітковини			Алергічний дерматит Гіпергідроз Свербіж Кропив'янка	

			Висип	
Порушення з боку кістково-м'язової системи та сполучної тканини		М'язова слабкість Міалгія Болі в кінцівках	Відчуття дискомфорту в кінцівках	Остеопенія
Порушення з боку нирок і сечовивідних шляхів			Енурез Протеїнурія	
Загальні порушення та ускладнення у місці введення	Почервоніння у місці введення	Астенія Дискомфорт Підвищена стомлюваність	Відчуття сп'яніння Відчуття жару Дратівливість Спрага	Відчуття дискомфорту в грудях
Лабораторні показники			Зниження артеріального тиску Підвищення концентрації білірубину в крові Зміна активності печінкових ферментів Зниження кількості тромбоцитів Лейкоцитоз	Підвищення концентрації креатиніну в крові

Частота невідома (не можна визначити за наявними даними) – зміни в місці введення препарату.

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.

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.

Діти.

Розчин для ін'єкцій Мідокалм не застосовувати дітям.

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 роботі з 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.

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, атомоксетину, дезипраміну, декстрометорфану, метопрололу, небівололу, перфеназину.

У ході досліджень *in vitro* в мікосомах 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.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Міорелаксant 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 ретикулоспінальних 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.

Фармакологічні характеристики.

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

Несумісність.

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

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. Зберігати у недоступному для дітей місці при температурі 8–15 °C 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/
Gedeon Richter Plc, Hungary.

Місцезнаходження.

Н-1103 Будапешт, вул. Демреї, 19-21, Угорщина/
Н-1103, Budapest, Gyömrői ut. 19-21, Hungary.