

## **Состав**

*действующие вещества:* толперизона гидрохлорид, лидокаина гидрохлорид;

1 мл раствора содержит: толперизона гидрохлорида – 100 мг, лидокаина гидрохлорида – 2,5 мг;

*вспомогательные вещества:* метилпарабен (Е 218), диэтиленгликоля моноэтиловый эфир, 0,1 М раствор кислоты хлористоводородной, вода для инъекций.

## **Лекарственная форма**

Раствор для инъекций.

*Основные физико-химические свойства:* прозрачная, бесцветная или зеленоватая жидкость.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Миорелаксанты с центральным механизмом действия. Код АТХ М03В Х04.

## **Фармакодинамика**

Миорелаксант центрального действия. Точный механизм действия неизвестен. В результате мембраностабилизирующего и местноанестезирующего действия препятствует проведению возбуждения в первичных афферентных волокнах, блокируя моно- и полисинаптические рефлексy 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, которые обусловлены децеребрацией животных в ходе эксперимента.

Усиливает периферическое кровообращение. Это действие не связано с влиянием препарата на центральную нервную систему. Она может быть обусловлена слабым спазмолитическим и антиадренергическим действием толперизона.

## **Фармакокинетика**

Подвергается интенсивному метаболизму в печени и почках. Выводится почками, более 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 к сходному с толперизоном по химическому составу перизона, а также к любому из вспомогательных веществ и другим амидным местноанестезирующим средствам.
- Миастения гравис.
- Период кормления грудью.
- Детский возраст.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

Фармакокинетические исследования лекарственных взаимодействий с декстрометорфаном, субстратом CYP2D6, продемонстрировали, что одновременное назначение толперизона повышает концентрации в плазме крови препаратов, которые метаболизируются преимущественно цитохромом CYP2D6, в частности тиоридазина, толтеролина, венлафаксина, атомоксетина, дезипрамина, декстрометорфана, метопролола, небиволола, перфеназина.

В ходе исследований *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 толперизона расти не будет, что обусловлено разнообразием путей метаболизма толперизона.

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 толперизона.

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

### **Особенности применения**

Инъекционную форму препарата не назначать детям.

Реакции гиперчувствительности.

При постмаркетинговом наблюдении при применении толперизона наиболее часто сообщалось о реакциях гиперчувствительности. Их выраженность варьирует от легких кожных реакций до тяжелых системных реакций, включая анафилактический шок. Симптомами реакций гиперчувствительности 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 реакций гиперчувствительности при приеме толперизона более высокий.

Пациентам необходимо помнить о возможной аллергии. При появлении симптомов аллергии следует прекратить прием толперизона и немедленно обратиться за медицинской помощью.

После эпизода гиперчувствительности к толперизону повторно назначать препарат нельзя.

Препарат содержит лидокаин, поэтому в случае известной гиперчувствительности к лидокаину, а также к другим амидным местноанестезирующим средствам препарат Токката для инъекций не следует применять в связи с возможностью развития перекрестных аллергических реакций.

Препарат содержит метилпарабен (Е 218), что может вызвать аллергические реакции (возможно, замедленные), а в отдельных случаях – бронхоспазм.

### **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 препарат 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 Токката во II и III триместре беременности возможно, когда, по мнению врача, ожидаемая польза в значительной степени превышает потенциальный риск для плода/ребенка.

Поскольку неизвестно, проникает ли толперизон в грудное молоко, применение препарата Токката в период кормления грудью противопоказано.

## **Способ применения и дозы**

Только для парентерального введения.

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

*Инъекционный раствор нельзя применять детям.*

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

## **Дети**

Раствор для инъекций Токката не применять детям.

## **Передозировка**

Данные о передозировке Токката ограничены. Токката имеет широкий терапевтический индекс. По данным, доза 600 мг, примененная внутрь детям, не вызвала серьезных симптомов передозировки.

Раздражительность наблюдалась в тех случаях, когда детям применяли 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 толперизона не существует специфического антидота. В случае передозировки рекомендуется симптоматическое и поддерживающее лечение.

## Побочные реакции

Побочные реакции приведены по классам систем органов в соответствии с Медицинским словарем регуляторной деятельности MedDRA с использованием определений частоты MedDRA: очень часто ( $\geq 1/10$ ), часто ( $\geq 1/100$ ,  $<1/10$ ), нечасто ( $\geq 1/1000$ ,  $<1/100$ ), редко ( $\geq 1/10000$ ,  $<1/100$ ), очень редко ( $<1/10000$ ), неизвестной частоты (нельзя определить по имеющимся данным).

По данным постмаркетингового наблюдения, примерно 50–60 % случаев побочных реакций, ассоциированных с приемом толперизона, составляют реакции гиперчувствительности. Большинство этих реакций были несерьезными и проходили самостоятельно. Реакции гиперчувствительности, которые представляют собой угрозу для жизни, возникали в единичных случаях.

| Классы систем органов                            | Часто<br>( $\geq 1/100$ ,<br>$<1/10$ ) | Нечасто<br>( $\geq 1/1000$ ,<br>$<1/100$ )    | Редко<br>( $\geq 1/10000$ , $<1/1000$ )                                                                  | Очень редко<br>( $<1/10000$ ) |
|--------------------------------------------------|----------------------------------------|-----------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------|
| Со стороны системы крови и лимфатической системы |                                        |                                               |                                                                                                          | Анемия<br>Лимфаденопатия      |
| Со стороны иммунной системы                      |                                        |                                               | Реакция гиперчувствительности<br>Анафилактическая реакция                                                | Анафилактический шок          |
| Со стороны питания и обмена веществ              |                                        | Анорексия                                     |                                                                                                          | Полидипсия                    |
| Психические расстройства                         |                                        | Бессонница<br>Нарушение сна                   | Снижение активности<br>Депрессия                                                                         | Спутанность сознания          |
| Со стороны нервной системы                       |                                        | Головная боль<br>Головокружение<br>Сонливость | Нарушение внимания<br>Тремор<br>Судороги<br>Гипестезия<br>Парестезия<br>Летаргия (повышенная сонливость) |                               |

|                                                                      |  |                                                                                                           |                                                                                         |             |
|----------------------------------------------------------------------|--|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------|-------------|
| Со стороны органов зрения                                            |  |                                                                                                           | Нарушение зрения                                                                        |             |
| Со стороны органов слуха и равновесия                                |  |                                                                                                           | Шум в ушах<br>Вертиго<br>(головокружение)                                               |             |
| Со стороны сердца                                                    |  |                                                                                                           | Стенокардия<br>Тахикардия<br>Ускоренное сердцебиение<br>Снижение артериального давления | Брадикардия |
| Со стороны сосудистой системы                                        |  | Гипотония                                                                                                 | Гиперемия кожи                                                                          |             |
| Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения |  |                                                                                                           | Утрудненное дыхание<br>Носовое кровотечение<br>Одышка                                   |             |
| Со стороны желудочно-кишечного тракта                                |  | Ощущение дискомфорта в животе<br>Диарея<br>Сухость слизистой оболочки полости рта<br>Диспепсия<br>Тошнота | Боли в эпигастрии<br>Запор<br>Метеоризм<br>Рвота                                        |             |
| Со стороны печени и желчевыводящих путей                             |  |                                                                                                           | Повреждение печени легкой степени                                                       |             |

|                                                           |                              |                                                    |                                                                                                                                                                            |                                           |
|-----------------------------------------------------------|------------------------------|----------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------|
| Со стороны кожи и подкожной клетчатки                     |                              |                                                    | Аллергический дерматит<br>Гипергидроз<br>Зуд<br>Крапивница<br>Сыпь                                                                                                         |                                           |
| Со стороны костно-мышечной системы и соединительной ткани |                              | Мышечная слабость<br>Миалгия<br>Боли в конечностях | Ощущение дискомфорта в конечностях                                                                                                                                         | Остеопения                                |
| Со стороны почек и мочевыводящих путей                    |                              |                                                    | Энурез<br>Протеинурия                                                                                                                                                      |                                           |
| Общие нарушения и осложнения в месте введения             | Покраснение в месте введения | Астения<br>Дискомфорт<br>Повышенная утомляемость   | Ощущение опьянения<br>Ощущение жара<br>Раздражительность<br>Жажда                                                                                                          | Ощущение дискомфорта в груди              |
| Лабораторные показатели                                   |                              |                                                    | Снижение артериального давления<br>Повышение концентрации билирубина в крови<br>Изменение активности печеночных ферментов<br>Снижение количества тромбоцитов<br>Лейкоцитоз | Повышение концентрации креатинина в крови |

Частота неизвестна (нельзя определить по имеющимся данным) – изменения в месте введения препарата.

### **Срок годности**

2 года.

Не применять препарат после окончаний срока годности, указанного на упаковке.

**Условия хранения**

Хранить в оригинальной упаковке при температуре от +2°C до +8°C.

Не замораживать.

Хранить в недоступном для детей месте.

**Упаковка**

По 1 мл в ампулах; по 5 ампул в блистере; по 1 блистеру в пачке.

**Категория отпуска**

По рецепту.

**Производитель**

ПАО «Фармак».

**Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

Украина, 04080, г. Киев, ул. Фрунзе, 74.

**Источник инструкции**

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