

Состав

действующее вещество: тиоколхикозид;

1 ампула (2 мл) содержит тиоколхикозид 4 мг;

другие составляющие: натрия хлорид, кислота хлористоводородная разведенная, вода для инъекций

Лекарственная форма

Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачный раствор светло-желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Миорелаксанты с центральным механизмом действия. Код АТХ M03B X05.

Фармакодинамика

Тиоколхикозид – это полусинтетический сульфидный производный колхикозида, оказывающий миорелаксирующее действие.

В исследованиях *in vitro* тиоколхикозид связывается только с ГАМК и стрихниночувствительными глициновыми рецепторами. Тиоколхикозид проявляет селективную аффинность к ГАМК-рецепторам, оказывает эффективный миорелаксирующий эффект с помощью регуляторных комплексных механизмов на разных уровнях нервной системы, однако его глицинергический механизм действия не может быть исключен.

Характеристики взаимодействия тиоколхикозида с рецепторами ГАМК, такие же, как и для его глюкоронидного производного, что является основным метаболитом (см. ниже).

В исследованиях *in vivo* миорелаксирующие свойства тиоклхикозида и его основного метаболита были продемонстрированы на разных экспериментальных моделях.

Также электроэнцефалографические исследования показали, что тиоколхикозид и его главный метаболит не производят седативный эффект.

Фармакокинетика

Абсорбция.

После внутримышечного введения максимальная концентрация в плазме крови (C_{max}) тиоколхикозида наблюдается через 30 минут, показатели 113 нг/мл достигаются после введения дозы 4 мг, а 175 нг/мл после введения дозы 8 мг. Соответствующие показатели площади под фармакокинетической кривой (AUC) равны 283 и 417 нг•г/мл.

Фармакологически активный метаболит SL18.0740 наблюдается также при более низких концентрациях, при C_{max} 11,7 нг/мл, которая достигается через 5 ч после введения дозы, а AUC – 83 нг•г/мл.

Данные по неактивному метаболиту SL59.0955 отсутствуют.

Распределение.

Кажущийся объем распределения тиоколхикозида составляет примерно 42,7 л после внутримышечного введения 8 мг. Данные об обоих метаболитах отсутствуют.

Выведение

Период полувыведения тиоколхикозида составляет 1,5 ч, а плазменный клиренс – 19,2 л/г.

Показания

Дополнительная терапия болезненных мышечных контрактур при острых патологиях позвоночника у взрослых и подростков в возрасте от 16 лет.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к действующему веществу или любому из вспомогательных веществ лекарственного средства;
- дряблый паралич, мышечная гипотония;
- беременность;
- период кормления грудью;
- применение женщинам репродуктивного возраста, не использующих надлежащие средства контрацепции.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Информация о взаимодействии отсутствует.

Особенности применения

После внутримышечной инъекции тиоколхикозида сообщали о вазовагальном обмороке, поэтому после введения лекарственного средства следует осуществлять мониторинг состояния пациента (см. «Побочные реакции»).

В постмаркетинговый период сообщали о поражении печени в связи с применением тиоколхикозида. У пациентов, сопутствующих нестероидным противовоспалительным средствам или парацетамолу, были зарегистрированы тяжелые случаи (например, фульминантный гепатит) поражения печени. В случае развития при применении лекарственного средства признаков поражения печени следует прекратить лечение и обратиться к врачу (см. «Побочные реакции»).

При применении тиоколхикозида возможно развитие эпилептических приступов у пациентов, страдающих эпилепсией или заболеваниями, сопровождающимися риском возникновения судорог (см. раздел «Побочные реакции»).

Не следует превышать максимальную рекомендованную дозу тиоколхикозида 8 мг/сут, которую следует разделить на 2 введения с 12-часовым интервалом. При пропуске очередной дозы следующую дозу следует вводить в обычное время.

Согласно данным доклинических исследований, один из метаболитов тиоколхикозида SL59.0955 вызывает анеуплоидию (изменение количества хромосом в делящихся клетках) в концентрациях, приближенных к 8 мг 2 раза в сутки при пероральном применении, которые влияли подобным образом на человека.

Анеуплоидия считается фактором риска тератогенности, токсичности для эмбриона/плода, выкидыша, изменения фертильности у мужчин и потенциальным фактором риска возникновения рака. В качестве профилактики следует избегать превышения рекомендуемой дозы лекарственного средства или длительного применения (см. «Способ применения и дозы»).

Пациентов следует хорошо проинформировать о потенциальных рисках возможной беременности и эффективных средств контрацепции, которые следует использовать.

Лекарственное средство содержит менее 1 ммоль (23 мг)/дозу натрия, т.е. практически свободно от натрия.

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

Исследование влияния тиоколхикозида на способность управлять автотранспортом или другими механизмами не проводилось.

При применении тиоколхикозида возможно развитие сонливости, которое следует учитывать при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность.

Информация о применении тиоколхикозида беременным женщинам ограничена, поэтому потенциальный риск для эмбриона и плода неизвестен. Исследования на животных показали тератогенное влияние тиоколхикозида. Лекарственное средство противопоказано для применения в период беременности и для женщин репродуктивного возраста, которые не используют надлежащие меры контрацепции (см. «Противопоказания»).

Период кормления грудью.

Тиоколхикозид проникает в грудное молоко. Лекарственное средство противопоказано для применения в период кормления грудью (см. «Противопоказания»).

Фертильность.

Исследования фертильности, проведенные на животных, не показали изменений фертильности при дозировке, не превышающей 12 мг/кг, т.е. на уровне доз, не вызывавших клинического эффекта. Тиоколхикозид и его метаболиты оказывают анеугенное действие при разных уровнях концентрации, что является фактором риска для фертильности человека.

Способ применения и дозы

Лекарственное средство предназначено для внутримышечного введения.

Рекомендуемая максимальная суточная доза составляет 4 мг каждые 12 часов (8 мг/сут).

Лечение не должно превышать 5 дней.

Следует избегать превышения рекомендуемой дозы или длительности применения (см. «Особенности применения»).

Дети

Лекарственное средство противопоказано для применения детям до 16 лет.

Передозировка

Данных о случаях передозировки нет. В случае передозировки лекарственного средства рекомендуется тщательное медицинское наблюдение за пациентом и проведение симптоматической терапии.

Побочные реакции

Нижеследующие побочные реакции систематизированы в соответствии с классами систем органов по MedDRA и частоте: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), неизвестно (частоту нельзя оценить на основе имеющихся данных).

Со стороны иммунной системы:

- нечасто – зуд;
- редко – крапивница;
- очень редко – гипотензия;
- неизвестно - ангионевротический отек и анафилактические реакции, включая анафилактический шок.

Со стороны нервной системы:

- часто – сонливость;
- редко – возбуждение или кратковременная запутанность сознания;
- неизвестно – недомогание, сопровождающееся или не сопровождающееся вазовальным обмороком в течение первых нескольких минут после внутримышечного введения; судороги (см. раздел «Особенности применения»).

Со стороны пищеварительного тракта:

- часто – диарея, боль в желудке;
- нечасто – тошнота, рвота;
- редко – изжога.

Со стороны гепатобилиарной системы:

- частота неизвестна – поражение печени (см. раздел «Особенности применения»).

Со стороны кожи и подкожных тканей:

- нечасто – аллергические кожные реакции.

Сообщения о подозреваемых побочных реакциях.

Сообщения о подозреваемых побочных реакциях, возникших после регистрации лекарственного средства, очень важны. Это позволяет постоянно наблюдать за балансом польза/риск лекарственного средства. Работников системы здравоохранения просят сообщать о любых подозреваемых побочных реакциях через национальную систему сообщений.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 ° C в недоступном для детей месте.

Упаковка

2 мл раствора в бесцветной стеклянной ампуле; 6 ампул в контурной ячейистой упаковке; 1 ячейистая упаковка в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Мефар Илач Сан. А.Ш.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Рамозаноглу Мах. Энсар Джадд. № 20, 34906 Курткой – Пендик/Стамбул, Турция

Источник инструкции

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