

Состав

действующее вещество: тиоколхикозид;

1 ампула содержит тиоколхикозид 4 мг;

другие составляющие: натрия хлорид, кислота хлористоводородная, натрия гидроксид, вода для инъекций.

Лекарственная форма

Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачный раствор желтого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Миорелаксанты с центральным механизмом действия. Код АТХ M03B X05.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика.

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

В исследованиях *in vitro* тиоколхикозид связывается только с ГАМК и стрихнинчувствительными глициновыми рецепторами. Тиоколхикозид, действующий как антагонист ГАМК-рецепторов, оказывает эффективный миорелаксирующий эффект с помощью регуляторных комплексных механизмов на супраспинальном уровне, однако его глицинергический механизм действия не может быть исключен.

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

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

Также электроэнцефалографические исследования показали, что тиоколхикозид и его главный метаболит не оказывают седативного эффекта.

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 «концентрация-время» (AUC) равны 283 нг•г/мл 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.

Деление.

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

Вывод.

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

Тиоколхикозид не следует применять:

- пациентам с повышенной чувствительностью к действующему веществу или к любому из вспомогательных веществ лекарственного средства;
- в течение всего периода беременности;
- во время грудного вскармливания;
- женщинам репродуктивного возраста, не использующим надлежащие средства контрацепции;
- пациентам, страдающим дряблым параличом, мышечной гипотонией.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Информация о взаимодействии отсутствует.

Особенности по применению

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

В постмаркетинговый период сообщали о поражении печени в связи с применением тиоколхикозида. У пациентов, сопутствующих нестероидным противовоспалительным средствам (НПВС) 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. раздел «Побочные реакции»).

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

Не 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 целях профилактики следует избегать превышения рекомендуемой дозы лекарственного средства или длительного применения (см. «Способ применения и дозы»). Пациенты должны быть хорошо осведомлены о потенциальных рисках для возможной беременности и эффективных средствах контрацепции, которые следует использовать. Важная информация о вспомогательных веществах.

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

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, то есть 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.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими 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.

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. раздел «Особенности применения»).

Дети.

Лекарственное средство противопоказано для применения детям до 16 лет.

Передозировка

Симптомы. Данных о случаях передозировки нет.

Лечение. В случае передозировки лекарственного средства рекомендуется тщательное медицинское наблюдение за пациентом и проведение симптоматической терапии.

Побочные эффекты

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 ($< 1/10000$), частота неизвестна (не могут быть оценены по имеющимся данным).

Со стороны иммунной системы:

нечасто – зуд; редко – крапивница; очень редко – артериальная гипотензия; частота неизвестна – ангионевротический отек и анафилактические реакции, включая анафилактический шок.

Со стороны нервной системы:

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

Со стороны желудочно-кишечного тракта:

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

Со стороны печени и желчевыводящих путей:

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

Со стороны кожи и подкожной клетчатки:

нечасто – аллергические кожные реакции.

Сообщения о подозреваемых побочных реакциях

Сообщение о побочных реакциях после регистрации лекарственного средства имеет важное значение. Это позволяет проводить мониторинг соотношения польза/риск при применении этого лекарственного средства. Медицинским и фармацевтическим работникам, а также пациентам или их законным представителям следует сообщать о всех случаях подозреваемых побочных реакций и отсутствии эффективности лекарственного средства через Автоматизированную информационную систему по фармаконадзору по ссылке: <https://aisf.dec.gov.ua>

Срок годности

4 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

по 2 мл в ампуле; по 6 ампул в картонной пачке.

Категория отпуска

За рецептом.

Производитель

ВЕМ Илочь Сан. ве Тик. А.С.

Местонахождение производителя и адрес места его деятельности.

Черкезкой Органайз Санай Белгези, Караагач Махалеси, Фатих Бульвари № 38
Капакли/ Текирдак /Турция.