

## **Склад**

*діюча речовина:* thiocolchicoside;

1 таблетка містить тіоколхікозиду 8 мг;

*допоміжні речовини:* коповідон, лактози моногідрат, крохмаль

```
прежелатинізований, целюлоза мікрोकристалічна, кремнію діоксид колоїдний безводний, натрію стеарилфумарат.
```

## **Лікарська форма**

Таблетки.

*Основні фізико-хімічні властивості:* круглі, двоопуклі таблетки жовтого кольору з лінією розлому з одного боку та з гравіюванням «8» з іншого боку.

## **Фармакотерапевтична група**

Міорелаксанти з центральним механізмом дії. Код АТХ M03B X05.

## **Фармакологічні властивості**

*Фармакодинаміка.*

Тіоколхікозид – напівсинтетичний міорелаксант, який одержують з глікозиду колхікозиду. Проявляє селективну афінність до гамма-аміномасляної кислоти (ГАМК) і гліцинових рецепторів.

Міорелаксуючий ефект проявляється переважно на супраспінальному рівні, за рахунок складних регуляторних механізмів, не виключений також гліцинергічний механізм дії.

Зв'язування тіоколхікозиду з ГАМК якісно і кількісно розділяється з його активним метаболітом – глюкуронізованою похідною.

Тіоколхікозид та його похідні не мають седативного ефекту.

*Фармакокінетика.*

Всмоктування.

Після прийому одноразової дози 8 мг тіоколхікозиду максимальна концентрація ( $C_{max}$ ) досягається протягом 30 хвилин, і сягає значення 175 нг/мл. Значення

площі під кривою «концентрація-час» (AUC) становить 417 нг.годину/мл.

Фармакологічно активний метаболіт SL18.0740 також виявляється при більш низьких концентраціях  $C_{\max}$  11,7 нг/мл, що досягається через 5 годин після введення дози, і AUC 83 нг.годину/мл. Доступних даних щодо неактивного метаболіту SL59.0955 немає.

Після перорального введення тіоколікозиду в плазмі крові виявляються тільки два метаболіти: фармакологічно активний метаболіт SL18.0740 та неактивний метаболіт SL59.0955. Максимальна концентрація в плазмі крові обох метаболітів тіоколікозиду досягається приблизно через 60 хвилин. Після одноразового перорального прийому 8 мг, значення  $C_{\max}$  і AUC метаболіту SL18.0740 становлять приблизно 60 нг/мл і 130 нг.годину/мл відповідно. У метаболіту SL59.0955 значення набагато нижче:  $C_{\max}$  становить десь 13 нг/мл, а AUC – у межах від 15,5 нг.годину/мл (до 3 годин) до 39,7 нг.годину/мл (до 24 годин).

#### Розподіл.

Об'єм розподілу тіоколікозиду становить близько 42,7 л після застосування 8 мг. Дані щодо об'єму розподілу метаболітів відсутні.

#### Метаболізм.

Після перорального застосування тіоколікозид швидко метаболізується до аглікон-3-диметилтіоколікозиду або SL59.0955. Це, в основному, відбувається за рахунок кишкового метаболізму, що пояснює відсутність незміненого тіоколікозиду після перорального застосування. Метаболіт SL59.0955 глюкуронізується до SL18.0740 який має рівносильну фармакологічну активність з тіоколікозидом і, таким чином, забезпечує фармакологічну активність після перорального введення тіоколікозиду. SL59.0955 також деметилується, перетворюючись на диметилтіоколіцін.

#### Виведення.

Після перорального застосування  $^{14}\text{C}$ -тіоколікозид в основному виділяється з калом (79 %), а з сечею – лише 20 %. В незміненому вигляді тіоколікозид виводиться з сечею або калом. Метаболіти SL18.0740 та SL59.0955 виявляються в сечі і калі, у той час як диметилтіоколіцін виводиться тільки з калом.

Після перорального застосування тіоколікозиду час напіввиведення метаболіту SL18.0740 становить 3,2-7 годин та метаболіту SL59.0955 – у середньому 0,8 години.

#### **Показання**

Симптоматичне лікування болючих контрактур м'язів при патологіях спинного мозку.

## **Протипоказання**

- Гіперчутливість до діючої речовини або до інших компонентів препарату;
- період вагітності та годування груддю;
- застосування жінкам дітородного віку, які не використовують контрацепцію.

## **Взаємодія з іншими лікарськими засобами**

Даних про лікарську взаємодію немає. Однак рекомендується дотримуватися обережності при одночасному прийомі з іншими міорелаксантами.

При одночасному застосуванні з препаратами, що пригнічують центральну нервову систему, у тому числі з алкоголем, антигіпертензивними засобами, курареподібними препаратами можливе посилення міорелаксації і пригнічення ЦНС, розвиток гіпотонії.

При одночасному застосуванні з антикоагулянтами підвищується ризик кровотеч.

## **Особливості застосування**

Тіоколікозид не рекомендується застосовувати дітям віком до 16 років.

У разі виникнення нудоти дозу препарату слід знизити.

Тіоколікозид може спричинити судоми у пацієнтів зі схильністю до виникнення судом або з епілепсією.

Відомо, що один з метаболітів тіоколікозиду (SL59.0955) індукує анеуплоїдію (тобто нерівне число хромосом в клітинах, що діляться) в концентраціях, близьких до виявлених у плазмі крові людини, при застосуванні дози 8 мг 2 рази на добу перорально. Анеуплоїдія є фактором ризику тератогенності, ембріо-/фетотоксичності, спонтанного викидня, порушення чоловічої фертильності, а також розвитку раку. Тому слід уникати застосування препарату в дозах, що перевищують рекомендовані, та протягом тривалого часу.

Жінки дітородного віку повинні бути проінформовані про потенційний ризик у період вагітності та необхідність застосування ефективних засобів контрацепції.

Препарат містить лактози моногідрат, тому пацієнти з рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, недостатністю лактази Лаппа або

синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції не повинні застосовувати препарат.

*Застосування у період вагітності або годування груддю.*

Препарат протипоказаний під час вагітності та у період годування груддю.

*Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.*

У період лікування необхідно дотримуватися обережності, керуючи автотранспортом або займаючись іншими потенційно небезпечними видами діяльності, що потребують підвищеної концентрації уваги і швидкості психомоторних реакцій, через можливість виникнення сонливості.

### **Спосіб застосування та дози**

Рекомендована доза становить 8 мг кожні 12 годин (добова доза 16 мг). Тривалість терапії має становити до 7 днів поспіль.

*Діти.*

Препарат не слід застосовувати дітям віком до 16 років.

### **Передозування**

Дані про передозування відсутні.

Лікування: симптоматичне, підтримувальна терапія.

### **Побічні реакції**

*З боку імунної системи:* анафілактичні реакції, кропив'янка, артеріальна гіпотензія, анафілактичний шок після внутрішньом'язового введення, ангіоневротичний набряк.

*З боку шкіри та підшкірної тканини:* шкірні алергічні реакції (після внутрішньом'язового введення).

*З боку нервової системи:* сонливість, млявість, вазовагальна непритомність, що настає протягом декількох хвилин після застосування.

*З боку травного тракту:* діарея, біль у шлунку, блювання, нудота.

### **Термін придатності**

2 роки.

### **Умови зберігання**

Зберігати при температурі не вище 25 °С в оригінальній упаковці.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

### **Упаковка**

По 10 таблеток у блістері, по 1 або 2 блістери у картонній упаковці.

### **Побічні ефекти**

*З боку імунної системи:* анафілактичні реакції, кропив'янка, артеріальна гіпотензія, анафілактичний шок після внутрішньом'язового введення, ангіоневротичний набряк.

*З боку шкіри та підшкірної тканини:* шкірні алергічні реакції (після внутрішньом'язового введення).

*З боку нервової системи:* сонливість, млявість, вазовагальна непритомність, що настає протягом декількох хвилин після застосування.

*З боку травного тракту:* діарея, біль у шлунку, блювання, нудота.

### **Категорія відпуску**

За рецептом.

### **Виробник**

Нобел Ілач Санаї ве Тіджарет А.Ш.

### **Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.**

Квартал Санкаклар, пр. Ескі Акчакоджа, №299, 81100 м. Дюздже, Туреччина.