

Склад

діюча речовина: тіоколіхікозид;

1 таблетка містить тіоколіхікозиду 8 мг;

допоміжні речовини: лактоза, моногідрат; целюлоза мікрокристалічна (тип 101); целюлоза мікрокристалічна (тип 102); повідон (тип К30); кремнію діоксид колоїдний безводний; кросповідон (тип А); магнію стеарат.

Лікарська форма

Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки круглої форми з двоопуклою поверхнею жовтого кольору.

Фармакотерапевтична група

Міорелаксанти з центральним механізмом дії. Тіоколіхікозид. Код АТХ М03В Х05.

Фармакологічні властивості

Фармакодинаміка.

Тіоколіхікозид — напівсинтетичний сульфідний аналог натурального глікозиду колхіцину, діє як центральний міорелаксанти, не виявляє курареподібних ефектів, оскільки діє через центральну нервову систему (ЦНС), а не через нервово-м'язове з'єднання. Він знижує або значно пригнічує скоротливу активність спазмованих м'язів, зменшує пасивний супротив м'язів при розтягненні, а також знижує або усуває залишкову спастичність. Дію тіоколіхікозиду за даними досліджень 2003 та 2007 рр. пов'язують із вибірковою агоністичним впливом на гліцинергічні рецептори стовбуру головного та спинного мозку. Тіоколіхікозид не впливає на довільні рухи, не викликає паралічу, що виключає ризик порушення функції дихання, діє як антагоніст ГАМК-рецепторів кори головного мозку, з чим пов'язаний ризик виникнення судом та збільшення судомної готовності. Тіоколіхікозид не впливає на серцево-судинну систему.

Фармакокінетика.

Абсорбція

Після перорального застосування тіоколіхікозиду в плазмі крові виявляється 2 його метаболіти: фармакологічно активний метаболіт SL18.0740, що має ефективність незмінного тіоколіхікозиду, та неактивний метаболіт SL59.0955. Максимальна концентрація цих метаболітів у плазмі крові ($C_{\max}$) спостерігається протягом 1 години після застосування тіоколіхікозиду. Після прийому одноразової дози тіоколіхікозиду 8 мг показники $C_{\max}$ та площа під фармакокінетичною кривою (AUC) для SL18.0740 дорівнюють 60 нг/мл та 130 нг•г/мл відповідно. Для SL59.0955 ці показники є значно нижчими: $C_{\max}$ дорівнює приблизно 13 нг/мл, а AUC — у діапазоні від 15,5 нг•г/мл (до 3 годин) до 39,7 нг•г/мл (до 24 годин).

Розподіл

Дані щодо розподілу обох метаболітів відсутні.

Метаболізм

Після перорального застосування тіоколіхікозид спочатку метаболізується до аглікон-3-деметилтіоколіхіцину або SL59.0955, це відбувається, в основному, у кішківнику. З цим пов'язують відсутність незмінного тіоколіхікозиду в плазмі крові після перорального застосування. Метаболіт SL59.0955 глюкурокон'югується до SL18.0740, який має ефективність незмінного тіоколіхікозиду, таким чином забезпечується фармакологічна активність перорального тіоколіхікозиду. SL59.0955 також деметилується в дидеметилтіоколіхіцин.

Виведення

Після перорального застосування виведення метаболітів відбувається переважно з калом (79 %) та сечею — 20%. В незміненому вигляді тіоколіхікозид з сечею або калом не виводиться. Метаболіти SL18.0740 та SL59.0955 виявляються в сечі і калі, у той час як дидеметилтіоколіхіцин виводиться тільки з калом.

Після перорального застосування тіоколіхікозиду період напіввиведення метаболіту SL18.0740 становить 3,2–7 годин, а метаболіту SL59.0955 — у середньому 0,8 години.

Показання

Ад'ювантна терапія болісних м'язових контрактур у випадках гострих патологій хребта у дорослих та підлітків віком від 16 років.

Протипоказання

Тіонекс не слід застосовувати:

- пацієнтам із підвищеною чутливістю до діючої речовини або до будь-якої з допоміжних речовин лікарського засобу;
- під час вагітності;
- у період годування груддю;
- жінкам репродуктивного віку, які не використовують належні засоби контрацепції.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами

Інформація щодо взаємодії відсутня. Однак рекомендується дотримуватися обережності при одночасному прийомі з іншими міорелаксантами.

При одночасному застосуванні з препаратами, що пригнічують ЦНС, в 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 щодо застосування

Тіоколікозид слід з обережністю застосовувати пацієнтам з епілепсією або з ризиком виникнення судом. Виникнення судом вимагає припинення лікування.

При виникненні діареї слід зменшити дозування. При необхідності, таблетки можна застосовувати разом із антацидами.

Метаболіт тіоколікозиду (SL59.0955) при дослідженнях на тваринах може викликати анеуплоїдію (зміна кількості хромосом у клітинах, що діляться).

Анеуплоїдія вважається фактором ризику тератогенності, токсичності для ембріона/плода, викидня, зменшення фертильності та потенційним фактором ризику виникнення раку. У якості профілактики слід уникати перевищення рекомендованої дози лікарського засобу або тривалого застосування (див. розділ «Спосіб застосування та дози»).

Пацієнти повинні бути добре поінформовані щодо потенційних ризиків для можливої вагітності та щодо ефективних засобів контрацепції, які слід застосовувати.

Лікарський засіб містить лактозу, тому пацієнтам з рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, недостатністю лактази або синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції не слід його застосовувати.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність

Інформація щодо застосування тіоколікозиду вагітним жінкам обмежена, тому потенційний ризик для ембріона та плода невідомий.

Дослідження на тваринах показали тератогенний вплив цього препарату.

Тіонекс протипоказаний під час вагітності та жінкам репродуктивного віку, які не використовують належні заходи контрацепції (див. розділ «Протипоказання»).

Період годування груддю

Застосування тіоколікозиду протипоказане під час годування груддю, оскільки він проникає у грудне молоко (див. розділ «Протипоказання»).

Фертильність

Дослідження фертильності, проведені на тваринах, не показали змін фертильності при дозуванні, до 12 мг/кг, тобто на рівні доз, які не викликали клінічного ефекту. Тіоколікозид та його метаболіти чинять анеугенну дію при різних рівнях концентрації, що є фактором ризику порушення фертильності у людини.

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

Даних клінічних досліджень, які вказують на здатність тіоколікозиду впливати на керування автотранспортом або іншими механізмами, немає.

Незважаючи на те, що сонливість вважається дуже рідкісним проявом, слід враховувати можливість її появи при плануванні небезпечної діяльності.

Спосіб застосування та дози

Спосіб застосування

Приймати перорально, запиваючи склянкою води.

Дози

Рекомендована доза становить 8 мг кожні 12 годин (доза 16 мг тіоколіхікозиду є також максимальною на добу). Тривалість лікування не повинна перевищувати 7 днів поспіль. Слід уникати перевищення рекомендованої дози або тривалого застосування (див. розділ «Особливості застосування»).

Діти.

Лікарський засіб протипоказаний дітям та підліткам віком до 16 років.

Передозування

Симптоми

Можливі прояви з боку шлунково-кишкового тракту, такі як діарея або блювання.

Лікування

У разі передозування рекомендовані ретельний медичний нагляд та симптоматичне лікування.

Побічні ефекти

Побічні реакції наведені за системами органів і за частотою: рідко ($\geq 1/10000$ та $< 1/1000$), дуже рідко ($< 1/10000$), частота невідома (неможливо оцінити з наявної інформації).

З боку імунної системи.

Дуже рідко: алергічні реакції, такі як кропив'янка та ангіоневротичний набряк.

Частота невідома: анафілактичний шок.

З боку шкіри та підшкірної клітковини.

Рідко: везикулярні висипи.

Дуже рідко: свербіж, еритема, макулопапульозні висипи.

З боку шлунково-кишкового тракту.

Рідко: гастралгія, діарея, нудота, блювання.

З боку нервової системи.

Дуже рідко: сонливість.

Частота невідома: виникнення або повторне виникнення судом у пацієнтів із епілепсією.

Термін придатності

2 роки.

Умови зберігання

Лікарський засіб не вимагає спеціальних умов зберігання. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка

По 14 таблеток у блістері; по 1 блістеру у картонній коробці.

Категорія відпуску

За рецептом.

Виробник

Біофарм Лтд / Biofarm Sp. z o.o.