для медичного застосування лікарського засобу

МІОТИЛ

MIOTIL

Склад:

діюча речовина: тіоколхікозид;

1 таблетка містить 8 мг тіоколхікозиду;

допоміжні речовини: лактози 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: круглі, двоопуклі таблетки жовтого кольору.

Фармакотерапевтична група.

Міорелаксанти з центральним механізмом дії. Код АТХ М03В Х05.

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 виявляють седативного ефекту.

Фармакокінетика.

Абсорбція

Після внутрішньом’язового введення максимальна концентрація у плазмі крові (C_{max})

тіоколхікозиду спостерігається через 30 хвилин, показники 113 нг/мл досягаються після введення дози 4 мг, а 175 нг/мл – після введення дози 8 мг. Відповідні показники площі під фармакокінетичною кривою «концентрація-час» (AUC) дорівнюють 283 нг•г/мл та 417 нг•г/мл.

Фармакологічно активний метаболіт SL18.0740 спостерігається також при більш низьких концентраціях – при C_{max} 11,7 нг/мл, яка досягається через 5 годин після введення дози, а AUC – 83 нг•г/мл.

Дані щодо неактивного метаболіту SL59.0955 відсутні.

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 застосування тіоколхікозиду в плазмі крові виявляються тільки два метаболіти: фармакологічно активний метаболіт SL18.0740 та неактивний метаболіт SL59.0955. Максимальна концентрація в плазмі крові обох метаболітів тіоколхікозиду 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 приблизно 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 тіоколхікозиду становить приблизно 42,7 л після застосування 8 мг. Дані щодо об’єму розподілу метаболітів відсутні.

Метаболізм

Після перорального застосування тіоколхікозид швидко метаболізується до аглікон-3-диметилтіоколхікозиду або SL59.0955. Це, в основному, відбувається за рахунок кишкового метаболізму, що пояснює відсутність незміненого тіоколхікозиду після перорального застосування. Метаболіт SL59.0955 глюкуронізується до SL18.0740, який має рівносильну фармакологічну активність з тіоколхікозидом і, таким чином, забезпечує фармакологічну активність після перорального застосування тіоколхікозиду. SL59.0955 також деметилюється, перетворюючись на диметилтіоколхіцин.

Виведення

Після перорального застосування ^{14}С-тіоколхікозид в основному виділяється з калом (79 %), а зі сечею – лише 20 %. У незміненому вигляді тіоколхікозид не виводиться зі сечею або калом. Метаболіти SL18.0740 та SL59.0955 виявляються в сечі і калі, у той час як дидеметилтіоколхіцин виводиться тільки з калом.

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

Клінічні характеристики.

Показання.

Додаткова терапія болісних м’язових контрактур у випадках гострих патологій хребта у дорослих та підлітків віком від 16 років.

Протипоказання.

– Гіперчутливість до діючої речовини або до будь-якої з допоміжних речовин препарату;

– млявий параліч або м’язова гіпотонія;

– період вагітності та годування груддю.

Протипоказано жінкам дітородного віку, якщо вони не використовують ефективну контрацепцію під час лікування тіоколхікозидом та протягом 1 місяця після завершення лікування (див. розділи «Особливості застосування» та «Застосування у період вагітності або годування груддю»).

Протипоказано чоловікам, якщо вони не використовують ефективну контрацепцію під час лікування тіоколхікозидом та протягом 3 місяців після завершення лікування (див. розділи «Особливості застосування» та «Застосування у період вагітності або годування груддю»).

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

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

При одночасному застосуванні з препаратами, що пригнічують центральну нервову систему (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 застосування.

Необхідно з обережністю застосовувати тіоколхікозид пацієнтам, які страждають на епілепсію або які мають підвищений ризик виникнення епілептичних нападів. У разі виникнення епілептичних нападів лікування слід припинити.

Тіоколхікозид може спровокувати судоми, особливо у пацієнтів з епілепсією або у тих, хто має ризик розвитку судом (див. розділ «Побічні реакції»).

З моменту виходу тіоколхікозиду на ринок повідомлялося про випадки ураження печінки

(наприклад, цитолітичний або холестатичний гепатит). Відомо про тяжкі випадки (фульмінантний гепатит) у пацієнтів, які одночасно приймали нестероїдні протизапальні препарати або парацетамол. Пацієнтам потрібно припинити лікування та звернутися до лікаря у разі появи ознак та симптомів ураження печінки (див. розділ «Побічні реакції»).

У випадку діареї слід зменшити дозу.

За необхідності лікарський засіб можна застосовувати разом з антацидами.

Відомо, що один з метаболітів тіоколхікозиду (SL59.0955) індукує анеуплоїдію (тобто нерівне число хромосом у клітинах, що діляться) у 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 лікарського засобу в дозах, що перевищують рекомендовані, та протягом тривалого часу (див. розділ «Спосіб застосування та дози»).

Пацієнти (обох статей) повинні бути проінформовані про потенційний ризик у період вагітності та необхідність застосування ефективних засобів контрацепції під час лікування і після його завершення (див. розділ «Протипоказання» та «Застосування у період вагітності або годування груддю»).

Лікарський засіб містить лактози моногідрат, тому пацієнтам із рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, недостатністю лактази або синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції не слід застосовувати цей лікарський засіб.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Міотил протипоказаний жінкам репродуктивного віку та чоловікам, які не застосовують ефективні засоби контрацепції (див. розділ «Протипоказання»).

Через анеугенний потенціал тіоколхікозиду та його метаболітів жінки репродуктивного віку повинні використовувати ефективні засоби контрацепції під час лікування тіоколхікозидом і протягом одного місяця після завершення лікування (див. розділ «Протипоказання»).

Чоловіки повинні використовувати ефективні засоби контрацепції під час лікування тіоколхікозидом і протягом 3 місяців після завершення лікування (див. розділ «Протипоказання»).

Вагітність

Інформація щодо застосування тіоколхікозиду вагітним жінкам обмежена. Тому потенційний ризик для ембріона та плода невідомий.

Дослідження на тваринах показали тератогенний вплив (див. розділ «Протипоказання»).

Лікарський засіб протипоказаний для застосування у період вагітності та для жінок з репродуктивним потенціалом, які не використовують належні засоби контрацепції.

Період годування груддю

Оскільки тіоколхікозид проникає у грудне молоко, лікарський засіб протипоказаний для застосування у період годування груддю (див. розділ «Протипоказання»).

Фертильність

Дослідження фертильності, проведені на щурах, не показали змін фертильності при дозуванні, що не перевищувало 12 мг/кг, тобто на рівні доз, які не спричиняли клінічного ефекту. Тіоколхікозид та його метаболіти чинять анеугенну дію при різних рівнях концентрації, що є фактором ризику для фертильності людини.

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

Дані, що свідчать про вплив тіоколхікозиду на здатність керувати автотранспортом або іншими механізмами, відсутні.

Під час застосування тіоколхікозиду можливий розвиток сонливості, що слід враховувати у разі керування автотранспортом або іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Призначений для перорального застосування.

Таблетки необхідно ковтати цілими, запиваючи склянкою води.

Рекомендована доза становить 8 мг кожні 12 годин (добова доза становить 16 мг). Тривалість лікування не має перевищувати 7 днів поспіль.

Слід уникати перевищення рекомендованої дози або довготривалого застосування (див. розділ «Особливості застосування»).

Діти.

Лікарський засіб не слід застосовувати дітям віком до 16 років.

Передозування.

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

У разі передозування рекомендується ретельний медичний нагляд за пацієнтом та проведення симптоматичної терапії.

Побічні реакції.

Нижченаведені побічні реакції систематизовано відповідно до класів систем органів та за частотою: дуже часто (> 1/10), часто (³ 1/100, < 1/10), нечасто (³ 1/1000, < 1/100), рідко (³ 1/10000, < 1/1000), дуже рідко (< 1/10000), частота невідома (частоту не можна оцінити на основі наявних даних).

З боку імунної системи: дуже рідко — артеріальна гіпотензія; рідко — алергічні реакції (кропив'янка, набряк Квінке); частота невідома — ангіоневротичний набряк та анафілактичні реакції, зокрема анафілактичний шок.

З боку шкіри та підшкірної тканини: нечасто — алергічні шкірні реакції; рідко — везикулярні висипання; дуже рідко — свербіж, еритема, макулопапульозні висипання.

З боку шлунково-кишкового тракту: рідко — біль у животі, діарея, нудота та блювання, печія.

З боку гепатобіліарної системи: частота невідома — печінкові розлади (наприклад, цитолітичний або холестатичний гепатит).

З боку нервової системи: часто — сонливість; рідко — збудження та тимчасове пригнічення свідомості; частота невідома — судоми або рецидиви судом у пацієнтів, що страждають на епілепсію.

Термін придатності.

2 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25 ºС у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 14 таблеток у блістері, по 1 блістеру в картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

Біофарм Сп. з о.о.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

вул. Валбжиска 13, Познань, 60-198, Польща.