



# TASIFEN MUSCULAR

## LEA CUIDADOSAMENTE LAS SIGUIENTES INSTRUCCIONES ANTES DE TOMAR ESTE MEDICAMENTO

Asociación relajante muscular de acción central + Analgésico antiinflamatorio no esteroide.  
Aduyante del tratamiento de las contracturas musculares dolorosas en mayores de 18 años.

### PRESENTACIÓN

#### Cápsulas blandas:

Tasifen Muscular (Ibuprofeno 400 mg + tiocolchicosido 4 mg), caja x 10.

**VÍA DE ADMINISTRACIÓN:** Oral.

**FORMA FARMACÉUTICA:** Cápsulas blandas.

### COMPOSICIÓN CUALITATIVA Y CUANTITATIVA:

#### Cada cápsula blanda contiene:

Ibuprofeno 400 mg  
Tiocolchicosido 4 mg

#### Excipientes:

Hidróxido de potasio, propilenglicol, polietilenglicol 400, gelatina Bloom, agua purificada, glicerina, metilparabeno, propilparabeno.

### FARMACODINAMIA

Asociación miorelajante-analgésica:

#### IBUPROFENO:

- Antinflamatorio no esteroide, antirreumático: inhibe la actividad de la enzima ciclo-oxigenasa (COX) y, en consecuencia, disminuye la actividad de los precursores de prostaglandinas y tromboxanos, de los cuales depende la inflamación y el dolor. También podrían estar involucrados los siguientes mecanismos: inhibición de la migración de leucocitos, inhibición de la liberación de acciones de las enzimas lisosomales y acciones sobre otras células y procesos inmunitarios en el tejido mesenquimatoso y conectivo.
- Analgésico: puede bloquear la generación periférica del impulso doloroso involucrando la disminución de la actividad de prostaglandinas. Es posible que inhiba la síntesis y acciones de otras sustancias sensibilizadoras de los nociceptores.

#### TIocolchicosido:

- Derivado natural azufrado de la colchicina y derivado semisintético del colchicosido natural de las semillas de *Gloriosa superba* (Liliaceae).
- Se ha afirmado que es un relajante muscular que ejerce acciones GABAérgicas y glicinérgicas, lo que explica su acción inhibitoria del SNC (sistema nervioso central).
- No obstante, la evidencia experimental y clínica sugiere fuertemente una acción pro-convulsiva. [Se ha sugerido que el tiocolchicosido puede interactuar con un subtipo cortical de receptor del ácido gamma-amino-butírico (receptor GABA-A) que expresa baja afinidad por los sitios de ligadura del GABA. Parecería que este reconocimiento de baja afinidad fuere un sitio de unión antagonista, lo que explicaría el efecto pro-convulsivo del tiocolchicosido]. Esto contrasta con los estudios previos que sugirieron el efecto GABA-mimético que explica su propiedad miorelajante.

### FARMACOCINÉTICA

#### IBUPROFENO:

- **Absorción:** rápida en el tracto gastrointestinal.
- **Ligadura a las proteínas plasmáticas:** 90 a 99%.
- **Tiempo de concentración plasmática máxima (T<sub>máx</sub>):** 1 a 2 horas.
- **Concentración plasmática máxima (C<sub>máx</sub>):** 22 a 27 mcg / ml con dosis de 200 mg; 23 a 45 mcg / ml con 400 mg; 42 a 57 mcg / ml con 600 mg; 56 a 66 mcg / ml con 800mg. Disminuye hasta 30% con los alimentos.
- **Vida media de eliminación (t<sub>1/2</sub>):** 1.8 a 2 horas.
- **Biotransformación:** hepática. La disposición espacial del ibuprofeno es estereoselectiva y hay alguna conversión metabólica del enantiómero inactivo R-(-) al **enantiómero activo S-(+), dexibuprofeno**.
- **Eliminación:** 100% en 24 horas.  
Menos de 1% se excreta inalterado en la orina, y 14% como conjugados de ibuprofeno.

#### TIocolchicosido:

- **Tiempo de concentración plasmática máxima (T<sub>máx</sub>):** 50 minutos.
- **Vida media de eliminación (t<sub>1/2</sub>):** 4.3 horas.
- **Biotransformación:** luego de su administración oral, el tiocolchicosido se convierte en la aglicona 3-desmetiltiocolchicina o en SL59.0955; esto se refleja en la ausencia de tiocolchicosido circulante inalterado. Después, por glucuronooconjugación, el SL59.0955 se transforma en SL18.0740 cuya actividad farmacológica es equipotente al tiocolchicosido (administrado por vía intramuscular); asimismo, el SL59.0955 se transforma a didesmetil-tiocolchicina.
- **Eliminación de metabolitos: heces:** 79% (SL18.0740 y SL59.0955); **riñón:** 20% (SL18.0740, SL59.0955 y didesmetiltiocolchicina). Eliminación plasmática del tiocolchicosido: 19.2 horas.

### INDICACIONES

#### Mayores de 18 años de edad:

- Tratamiento adyuvante de contracturas musculares dolorosas causadas por:
  - Traumatismo tisular local o por esfuerzo muscular.
  - Alteraciones neurológicas (v.g., esclerosis múltiple, parálisis cerebral y apoplejía).
  - Patología vertebral aguda de diversas causas (degenerativas, traumáticas, neurológicas).
  - Contracturas espásticas de origen central, traumáticas, reumáticas o reflejas.

### CONTRAINDICACIONES

#### Ibuprofeno:

- Embarazo.
- Nefropatía, hepatopatía.
- Enfermedad acidopéptica (úlceras, gastritis, hemorragia digestiva).
- Lupus eritematoso sistémico.
- Hipersensibilidad a los AINE.

#### Tiocolchicosido:

- Embarazo y lactancia.
- Niños y adolescentes menores de 18 años.
- Parálisis flácida, hipotonía muscular.
- Síncope vasovagal.
- Epilepsia.
- Hipersensibilidad al tiocolchicosido, a la colchicina o a cualquier componente del producto.

### PRECAUCIONES

#### Tiocolchicosido:

- No administrarlo durante la gestación ni en mujeres que pueden estar gestantes o con la posibilidad de quedar gestantes (no administrarlo si no están usando métodos anticonceptivos eficaces).
- No administrarlo durante períodos largos por la posibilidad de aneuploidia.

### GESTACIÓN

#### Ibuprofeno:

- Categoría D de riesgo fetal (3er. trimestre): puede causar cierre prematuro del conducto arterioso [mediante meta análisis se ha observado que el uso de AINE durante tiempo corto se ha asociado con incremento de 15 veces el riesgo del cierre prematuro, comparado con placebo o con fármacos que no son AINE].
- La ingestión prenatal de AINE está implicada en la hipertensión pulmonar persistente del neonato.

#### Tiocolchicosido:

- Por la evidencia de aneuploidia hay riesgo genotóxico, embriotoxicidad y teratógeno (categoría X de riesgo fetal).

## REACCIONES ADVERSAS

### IBUPROFENO:

- **Incidencia más frecuente:** diarrea, indigestión, náusea.
- **Incidencia poco frecuente:** gastrointestinales (abdominalgia, anorexia, constipación, meteorismo), cefalalgia, dificultad para dormir, mareo, nerviosismo o irritabilidad, retención de líquidos.
- **Incidencia rara:** aumento de la presión arterial, acústicas (hipoacusia, tinnitus), conjuntivitis, dermatitis alérgica, eritema multiforme, síndrome de Stevens-Johnson, gastritis, sangrado gastrointestinal, hematuria, cistitis o uretritis, reacciones hematológicas (anemia, anemia hemolítica, eosinofilia, granulocitopenia, neutropenia, pancitopenia, trombocitopenia con o sin púrpura), hepatitis, hepatitis colestásica o ictericia, reacciones anafilácticas (rinitis, broncoespasmo), vómito.

### TIOCOLCHICOSÍDO:

- Rara vez molestias digestivas (diarrea, gastralgia), fotodermatosis, alérgicas.

## INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS

**IBUPROFENO:** efectos de los antiinflamatorios no esteroides (AINE) sobre diversos fármacos:

- **Anticoagulantes orales:** aumenta el riesgo de sangrado.
- **Antidiabéticos orales e insulina:** puede aumentar el efecto hipoglucemiante.
- **Ciclosporina, diuréticos, inhibidores de la convertasa (IECA), tacrolimo:** riesgo de nefrotoxicidad. Los efectos en la función renal puede llevar a reducir la excreción de algunos fármacos.
- **Corticoides, fluoxetina e inhibidores de la recaptación de serotonina (SSRI), venlafaxina (inhibidor de la recaptación de serotonina y noradrenalina), antiplaquetarios clopidogrel y ticlopidina, iloprost, erlotinib, sibutramina y, posiblemente, alcohol, bifosfonatos y pentoxifilina:** aumenta el riesgo de sangrado gastrointestinal y ulceración.
- **Fenitoína y sulfonilureas antidiabéticas:** incrementan los efectos de estos fármacos.
- **Glucósidos cardiotónicos, litio, metotrexato:** incrementan sus concentraciones plasmáticas.
- **Ibuprofeno y otros AINE:** se ha sugerido que el ibuprofeno y posiblemente otros AINE puedan reducir el efecto antiagregante plaquetario cardioprotector de la aspirina.
- **Inhibidores de la convertasa (IECA), betabloqueadores y diuréticos:** pueden reducir su efecto antihipertensivo.
- **Inhibidores de la ECA y algunos diuréticos, incluyendo los ahorradores de potasio:** incrementa el riesgo de hiperpotasemia.
- **Quinolonas:** riesgo de convulsiones.
- **Uso concomitante de más de un AINE:** evitarlo porque aumenta el riesgo de efectos adversos.
- **Zidovudina:** aumenta el riesgo de hematotoxicidad.

### TIOCOLCHICOSÍDO:

- No se conocen.

## POSOLOGÍA

### Mayores de 18 años:

1 cápsula blanda cada 8 a 12 horas.

## ADVERTENCIAS

Producto de uso delicado. Administrar por prescripción y bajo vigilancia médica. Cumplir estrictamente las indicaciones de su médico. No administrarlo durante periodos largos por la posibilidad de aneuploidia. No administrar antiinflamatorios no esteroides durante la gestación. No administrar en el lupus eritematoso sistémico. Mantener fuera del alcance de los niños.

## CUIDADOS DE ALMACENAMIENTO

Conservar a temperatura no mayor de 30 °C.

## VENTA

Bajo receta médica.

## FABRICADO POR

### PROPHAR S.A.

Dirección: Av. General Rumiñahui s/n, sector Inchalillo (frente a la gasolinera El Viejo Roble), Sangolquí, Pichincha, Ecuador.

**Para:** PROSIRIOS S.A. Dirección: Lizardo García E10-80 y Av. 12 de Octubre. Edificio Alto Aragón, oficina 8A. Quito, Ecuador.

