

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу
СПАСТИКАЛМ
(SPASTICALM)

Склад:

діюча речовина: тіоколхікозид;

1 ампула містить тіоколхікозиду 4 мг;

допоміжні речовини: натрію хлорид, кислота хлористоводнева, натрію гідроксид, вода для ін'єкцій.

Лікарська форма Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: прозорий розчин, жовтого кольору.

Фармакотерапевтична група

Міорелаксанти з центральним механізмом дії. [Код АТС](#) M03B X05.

Фармакологічні властивості

Фармакодинаміка

Тіоколхікозид - це напівсинтетичний сульфідний похідний колхікозиду, який чинить міорелаксуючу дію.

У дослідженнях *in vitro* тіоколхікозид зв'язується тільки з ГАМК та стрихнін чутливими гліциновими рецепторами. Тіоколхікозид, що діє як антагоніст ГАМК-рецепторів, виявляє ефективний міорелаксуючий ефект за допомогою регуляторних комплексних механізмів на супраспінальному рівні, проте його гліцинергічний механізм дії не може бути виключений.

Характеристики взаємодії тіоколхікозиду з ГАМК-рецепторами такі ж, як і для його глюкоронідного похідного, що є основним метаболітом (див. нижче).

У дослідженнях *in vivo* міорелаксуючі властивості тіоколхікозиду та його основного метаболіту були продемонстровані на різних експериментальних моделях.

Також електроенцефалографічні дослідження показали, що тіоколхікозид та його головний метаболіт не спричиняють седативний ефект.

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.

Розподіл.

Уявний об'єм розподілу тіоколхікозиду становить приблизно 42,7 л після внутрішньом'язового введення 8 мг. Дані щодо обох метаболітів відсутні.

Виведення.

Період напіввиведення тіоколхікозиду становить 1,5 години, а плазмовий кліренс - 19,2л/г.

Клінічні характеристики

Показання.

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

Протипоказання.

Тіоколхікозид не слід застосовувати:

- пацієнтам із підвищеною чутливістю до діючої речовини або до будь-якої з допоміжних речовин лікарського засобу;
- пацієнтам, які страждають на в'ялий параліч, м'язову гіпотонію;
- протягом усього періоду вагітності;
- під час грудного вигодовування;
- жінкам репродуктивного віку, які не використовують належні засоби контрацепції під час лікування лікарським засобом Спастікалм та протягом одного місяця після припинення лікування;
- чоловікам, які не використовують належні засоби контрацепції під час лікування лікарським засобом Спастікалм та протягом трьох місяців після припинення лікування.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Інформація щодо взаємодії відсутня.

Особливості застосування.

Після внутрішньом'язової ін'єкції тіоколхікозиду повідомляти про вазовагальну непритомність, тому після введення лікарського засобу слід здійснювати моніторинг стану пацієнта (див. розділ «Побічні реакції»).

У постмаркетинговий період повідомляли про ураження печінки у зв'язку зі застосуванням тіоколхікозиду. У пацієнтів, які супутньо застосовували нестероїдні протизапальні засоби (НПЗЗ) або парацетамол, були зареєстровані тяжкі випадки (наприклад, фульмінантний гепатит) ураження печінки. У разі розвитку під час застосування лікарського засобу ознак ураження печінки слід припинити лікування та звернутися до лікаря (див. розділ «Побічні реакції»).

Під час застосування тіоколхікозиду можливий розвиток епілептичних нападів у пацієнтів, які страждають на епілепсію або на захворювання, які супроводжуються ризиком виникнення судом (див. розділ «Побічні реакції»).

Не перевищувати максимальну рекомендовану дозу тіоколхікозиду 8 мг на добу, яку слід розділити на 2 введення з 12-годинним інтервалом. У разі пропуску чергової дози наступну дозу потрібно вводити у звичний час.

Згідно даних доклінічних досліджень, один із метаболітів тіоколхікозиду SL59.0955 спричиняє анеуплоїдію (зміна кількості хромосом у клітинах, що діляться) у концентраціях, наближених до 8 мг 2 рази на добу при пероральному застосуванні, які впливали подібним чином на людину.

Анеуплоїдія вважається фактором ризику тератогенності, токсичності для ембріона/плода, викидня, зміни фертильності у чоловіків та потенційним фактором ризику виникнення раку. З метою профілактики слід уникати перевищення рекомендованої дози лікарського засобу або тривалого застосування (див. розділ «Спосіб застосування та дози»). Пацієнтів потрібно добре поінформувати щодо потенційних ризиків для можливої вагітності та щодо ефективних засобів контрацепції, які слід використовувати.

Реакції в місці ін'єкції

Після внутрішньом'язового введення тіоколхікозиду повідомлялося про реакції у місці ін'єкції, включаючи некроз у місці ін'єкції та лікарську емболію шкіри, також відомі як синдром Ніколау та ліведоїдний дерматит (див. розділ «Побічні реакції»). При внутрішньом'язовому введенні тіоколхікозиду необхідно дотримуватися правильної техніки ін'єкції.

Важлива інформація про допоміжні речовини.

Лікарський засіб містить менше 1 ммоль (23 мг)/дозу натрію, тобто практично вільний від натрію.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Контрацепція у жінок і чоловіків

Тіоколхікозид протипоказаний жінкам дітородного віку та чоловікам, які не використовують ефективні засоби контрацепції (див. розділ «Протипоказання»).

Через анеугенний потенціал тіоколхікозиду та його метаболітів жінки дітородного віку повинні використовувати ефективні засоби контрацепції під час лікування тіоколхікозидом і протягом одного місяця після завершення лікування.

Чоловіки повинні використовувати ефективні засоби контрацепції під час лікування тіоколхікозидом і протягом трьох 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 тіоколхікозиду. Лікарський засіб протипоказаний для застосування у період вагітності (див. розділ «Протипоказання»).

Період годування груддю.

Тіоколхікозид проникає у грудне молоко. Лікарський засіб протипоказаний для застосування у період годування груддю (див. розділ «Протипоказання»).

Фертильність.

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.

Дослідження впливу тіоколхікозиду на здатність керувати автотранспортом або іншими механізмами не проводили.

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

Спосіб застосування та дози.

Лікарський засіб призначений для внутрішньом'язового введення.

Рекомендована максимальна добова доза становить 4 мг кожні 12 годин (8 мг на добу). Лікування не повинно перевищувати 5 днів поспіль.

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

Діти.

Лікарський засіб протипоказаний для застосування дітям віком до 16 років.

Передозування.

Симптоми. Даних про випадки передозування немає.

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

Побічні реакції

Нижченаведені побічні реакції систематизовано відповідно до класів систем органів за MedDRA та частотою: дуже часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$ - $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$ - $< 1/100$), рідко ($\geq 1/10000$ - $< 1/1000$), дуже рідко ($< 1/10000$), частота невідома (не можуть бути оцінені за наявними даними).

З боку імунної системи:

нечасто - свербіж; рідко - кропив'янка; дуже рідко - артеріальна гіпотензія; частота невідома - ангіоневротичний набряк та анафілактичні реакції, включаючи анафілактичний шок.

З боку нервової системи:

часто - сонливість; рідко - збудження або короткотривала сплутаність свідомості; частота невідома - нездужання, що супроводжується або не супроводжується вазовагальною непритомністю впродовж перших декількох хвилин після внутрішньом'язового введення; судоми (див. розділ «Особливості застосування»).

З боку шлунково-кишкового тракту:

часто - діарея, біль у шлунку; нечасто - нудота, блювання; рідко - печія.

З боку печінки і жовчовивідних шляхів:

частота невідома - ураження печінки (див. розділ «Особливості застосування»).

З боку шкіри та підшкірної клітковини:

нечасто - алергічні шкірні реакції.

Загальні патології та стани, пов'язані з місцем введення:

частота невідома: реакції у місці ін'єкції, включаючи набряк, еритему, свербіж, біль навколо місця ін'єкції та синдром Ніколау («лікарська емболія шкіри» та «ліведоїдний дерматит») після внутрішньом'язової ін'єкції.

Повідомлення про підозрювані побічні реакції

Повідомлення про побічні реакції після реєстрації лікарського засобу має важливе значення. Це дає змогу проводити моніторинг співвідношення користь/ризик при застосуванні цього лікарського засобу. Медичним та фармацевтичним працівникам, а також пацієнтам або їх законним представникам слід повідомляти про усі випадки підозрюваних побічних реакцій та відсутності ефективності лікарського засобу через Автоматизовану інформаційну систему з фармаконагляду за посиланням: <https://aisf.dec.gov.ua>

Термін придатності.

4 роки.

Умови зберігання

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25°C. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка

По 2 мл в ампулі; по 6 ампул у картонній пачці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

ВЕМ Ілач Сан. ве Тік. А.С.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Черкезкой Органайз Санай Бьолгезі, Караагач Махалесі, Фатіх Бульварі №38 Капаклі/ Текірдак /Туреччина.