

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

МУСКОМЕД
(MUSKOMED)

Склад:

діюча речовина: тіоколхікозид;

1 ампула (2 мл) містить тіоколхікозиду 4 мг;

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

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

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

Фармакотерапевтична група.

Міорелаксанти з центральним механізмом дії. Код АТХ 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 виявляє селективну афінність до ГАМК-рецепторів, спричиняє ефективний міорелаксуючий ефект за допомогою регуляторних комплексних механізмів на різних рівнях нервової системи, 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 тіоколікозид та його головний метаболіт не спричиняють седативний ефект.

Фармакокінетика.

Абсорбція.

Після внутрішньом'язового введення максимальна концентрація у плазмі крові ($C_{\max}$) тіоколікозиду 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 (AUC) дорівнюють 283 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 тіоколікозиду становить приблизно 42,7 л після внутрішньом'язового введення 8 мг. Дані щодо обох метаболітів відсутні.

Виведення.

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

Клінічні характеристики.

Показання.

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

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до діючої речовини або до будь-якої з допоміжних речовин лікарського засобу;
- в'ялий параліч, м'язова гіпотонія;
- вагітність;
- період годування груддю;
- застосування жінкам репродуктивного віку, які не використовують належні засоби контрацепції під час лікування та протягом одного місяця після завершення лікування;
- застосування чоловікам, які не використовують належні засоби контрацепції під час

лікування та протягом трьох місяців після завершення лікування.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Інформація щодо взаємодії відсутня.

Особливості застосування.

Після внутрішньом'язової ін'єкції тіоколікозиду повідомляли 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 із застосуванням тіоколікозиду. У пацієнтів, які супутньо застосовували нестероїдні протизапальні засоби 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 тіоколікозиду можливий розвиток епілептичних нападів у пацієнтів, які страждають на епілепсію або на захворювання, які супроводжуються ризиком виникнення судом (див. розділ «Побічні реакції»).

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

Згідно з даними доклінічних досліджень, один з метаболітів тіоколікозиду 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. У якості профілактики слід уникати перевищення рекомендованої дози лікарського засобу або тривалого застосування (див. розділ «Спосіб застосування та дози»).

Пацієнтів слід добре поінформувати щодо потенційних ризиків для можливої вагітності та щодо ефективних засобів контрацепції, які слід використовувати.

Після внутрішньом'язового введення тіоколікозиду 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 тіоколікозиду необхідно дотримуватися правильної техніки ін'єкції.

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.

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

Через анеугенний потенціал тіоколікозиду та його метаболітів жінки репродуктивного віку повинні використовувати ефективні засоби контрацепції під час лікування тіоколікозидом і протягом одного місяця після завершення лікування.

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

Вагітність.

Інформація щодо застосування тіоколікозиду вагітним жінкам обмежена, тому потенційний ризик для ембріона та плода невідомий. Дослідження на тваринах показали тератогенний вплив тіоколікозиду. Лікарський засіб протипоказаний для застосування у період вагітності (див. розділ «Протипоказання»).

Період годування груддю.

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

Фертильність.

Тіоколікозид 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 тіоколікозиду на здатність керувати автотранспортом або іншими механізмами не проводили.

Під час застосування тіоколікозиду 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.

Даних про випадки передозування немає. 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 ($< 1/10000$), невідомо (частоту не можна оцінити на основі наявних даних).

З боку імунної системи:

нечасто – свербіж; рідко – кропив'янка; дуже рідко – гіпотензія; невідомо – ангіоневротичний набряк та анафілактичні реакції, включаючи анафілактичний шок.

З боку нервової системи:

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

З боку травного тракту:

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

З боку гепатобіліарної системи:

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

З боку шкіри та підшкірних тканин:

нечасто – алергічні шкірні реакції.

З боку організму в цілому та реакції у місці введення:

невідомо – 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 підозрювані побічні реакції, що виникли після реєстрації лікарського засобу, дуже важливі. Це дає змогу постійно спостерігати за балансом користь/ризик лікарського засобу. Працівників системи охорони здоров'я просять повідомляти про будь-які підозрювані побічні реакції через національну систему повідомлень.

Термін придатності.

3 роки.

Умови зберігання.

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

Упаковка.

2 мл розчину в безбарвній скляній ампулі; 6 ампул у контурній чарунковій упаковці;
1 чарункова упаковка в картонній коробці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

Мефар Ілач Сан. А.Ш., Туреччина/

Mefar Ilac San. A.S., Turkey.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Рамазаноглу Мах. Енсар Джад. № 20, 34906 Курткой – Пендик/Стамбул, Туреччина/
Ramazanoglu Mah. Ensar Cad. No. 20, 34906 Kurtkoy – Pendik/Istanbul, Turkey.

Заявник.

ТОВ «УОРЛД МЕДИЦИН», Україна/

WORLD MEDICINE, LLC, Ukraine.