

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

Valium® таблетки

1. ТЪРГОВСКО НАИМЕНОВАНИЕ

Valium таблетки.

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Roche

Кръгли, бледожълти таблетки с надпис 5 върху едната страна и единична линия за счупване на таблетата от другата, съдържаща 5 mg diazepam.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Valium таблетки от 5 mg

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Показания

Възрастни

Кратко (2-4 седмици) симптоматично лечение на безпокойство, което е тежко, води до нетрудоспособност и стрес, развиващо се самостоятелно или във връзка с безсъние или кратко психосоматично, органично или психично заболяване.

Кратко (2-4 седмици) лечение на състояния, при които тревожността може да се явява отключващ или утежняващ състоянието фактор, напр. тензионно главоболие или мигренозни пристъпи.

Симптоматично лечение на остра алкохолна абстиненция.

Мускулни спазми. Като допълнително средство за контролиране на мускулните спазми при тетанус.

В отделни случаи може да бъде полезно средство при овладяване на церебрална спастичност.

Като допълнително средство при овладяване на някои форми на епилепсия, напр. миоклонус.

Премедикация.

Деца

Нощни кошмари и сомнамбулизъм.

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО

Приложение към
разрешение за употреба №

11701/24.10.05

683/10.11.05

[Signature]



В отделни случаи може да има ефект при контролиране на напрежение и раздразнителност, съпровождащи церебрална спастичност.

Като допълнително средство за контрол на мускулни спазми при тетанус.

Премедикация.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Стандартна доза:

За постигане на оптимален ефект, дозата трябва да бъде внимателно индивидуализирана. Лечението следва да започне с най-ниската ефективна доза, съответстваща на определеното състояние.

Продължителност на лечението:

Продължителността на лечението следва да бъде максимално кратка. Пациентът трябва да бъде редовно оценяван, като се прави оценка на нуждата от продължаване на лечението, особено, ако пациентът е безсимптомен. Лечението не трябва да продължава повече от 2-3 месеца, включително периода на прекратяване на лечението. Продължаването на лечението след този период може да става само при внимателна оценка на състоянието на пациента.. Може да се окаже полезно да се информира пациента в началото на лечението, че продължителността му ще бъде ограничена, като подробно се обясни как постепенно ще бъде намалявана прилаганата доза. Освен това е важно пациентът да знае, че съществува възможност за повторна поява на оплакванията, с което би намаляла тревожността, свързана с появата на подобна симптоматика в периода на прекратяване на лечението. Има доказателства, че при приложение на кратко действащи бензодиазепини феноменът на абстиненция може да се манифестира дори и в интервала между приемите, особено, ако тя е висока. Когато се прилагат продължително действащи бензодиазепини, като diazepam, е важно да се знае, че при преминаване към лечение с кратко действащи бензодиазепини може да се развият симптоми на абстиненция.

Състояния на тревожност

Възрастни

Обичайна доза: 5 mg дневно.

Максимална доза: до 30 mg дневно, разделени в няколко приема. Определянето на дозата е индивидуално.

Безсъние, свързано с тревожност: 5 до 15 mg преди сън.

Лечението не трябва да продължава, при максимална доза, повече от 4 седмици.

Симптоматично овладяване на остра алкохолна абстиненция: 5 до 20 mg, при нужда повторени след 2 до 4 часа.

Нощни кошмари и сомнамбулизъм



Деца

До 5 mg преди лягане.

Състояния, съпроводени с мускулен спазъм

Възрастни

Мускулен спазъм: До 15 mg дневно, разделени на няколко приема.

Овластяване на церебрална спастичност в определени случаи: До 60 mg дневно, разпределени на няколко приема.

Допълнително средство за контрол на мускулни гърчове при тетанус: До 10 mg/kg телесно тегло дневно чрез назодуоденална сонда. Подбраната доза трябва да съответства на тежестта на заболяването и при особено тежки случаи са прилагани и по-високи дози. Първоначално се препоръчва прилагане на Valium венозно (виж съответната лекарствена информация).

Деца

Контрол на напрежение и раздразнителност при церебрална спастичност в отделни случаи: до 40 mg дневно, разделени в отделни приеми.

Като допълнително средство за контрол на мускулни гърчове при тетанус: като при възрастни.

Допълнение към лечението при някои форми на епилепсия

Възрастни

До 60 mg дневно, разделени на няколко приема.

Премедикация

Възрастни

5 до 20 mg.

Деца

До 10 mg.

Бензодиазепините не следва да се прилагат при деца без внимателно оценка на показанието. Продължителността на лечението следва да бъде минимална.

Пациенти в напреднала възраст

Пациенти в напреднала възраст и изтощени пациенти: Дозите не трябва да надвишават половината от нормално препоръчаните.

Тези пациенти трябва да бъдат редовно преглеждани в началото на лечението за да се намали до минимум дозата и/или честотата на приложение, за да се предотврати предозирането вследствие на акумулиране.

Увредена чернодробна функция

Пациентите с увредена чернодробна функция трябва да получават намалена доза.

Малко е известно за ефективността на бензодиазепините при продължително приложение.



4.3 Противопоказания

Пациенти с анамнестични данни за повишена чувствителност към бензодиазепини или някой друг от ексципиентите на препарата. Тежка дихателна недостатъчност; тежка чернодробна недостатъчност; респираторна депресия; фобия или маниакални състояния; хронични психози; миастения гравис; синдром на апнея по време на сън ; зависимост от други съединения, включително алкохол. Изключение от последното прави единствено поведението при остри реакции на абстиненция.

Valium не трябва да се използва самостоятелно за лечение на депресия или тревожност свързана с депресия, тъй като при такива пациенти може да се отключи проявата на суицидни намерения. Бензодиазепините не се препоръчват за първично лечение на психични заболявания.

4.4 Специални предпазни мерки

При пациенти с хронична белодробна недостатъчност както и при пациенти с хронични чернодробни състояния, може да се наложи дозата да бъде намалена. При бъбречна недостатъчност времето на полу-елиминиране на diazepam остава непроменено и поради това при такива пациенти не се налага корекция на дозата.

Трябва да се помни, че бензодиазепините могат да предизвикат антероградна амнезия. Антероградна амнезия може да се развие и при прилагане на терапевтични дози, но рискът се повишава при по-високи дози. Амнестичните прояви могат да бъдат свързани и с неадекватно поведение. Това състояние обикновено се развива няколко часа след приемане на лекарството и за да се намали риска на пациентите трябва да се осигури 7-8 часа непрекъснат сън.

При загуба на близък бензодиазепините могат да потиснат психологичната адаптация.

Лечението с бензодиазепини и бензодиазепин-подобни средства може да доведе до развитие на физическа и психологична зависимост. Рискът се повишава с повишаване на дозата и продължителността на лечението. Това е характерно най-вече за пациенти с анамнестични данни за злоупотреба с алкохол или наркотици, или при пациенти с изразени личностни отклонения. От съществено значение е проследяването на тези пациенти, като следва да се избягва рутинното повторно предписване, като лечението постепенно се преустанови. След като се развие зависимост внезапното прекратяване на лечението може да бъде съпроводено с явления на абстиненция. Тя се проявява с главоболие, мускулна болка, силно проявена тревожност, напрежение, безпокойство, объркване и раздразнителност. В тежките случаи се развива дереализация, деперсонализация, хиперакузис, мравучкане и обезчувствяване на крайниците, повишена чувствителност към светлина, шум и допир, халюцинации или епилептични припадъци.



При прилагане на бензодиазепини е известно, че могат да се развият парадоксални реакции, като безпокойство, агитация, раздразнителност, агресивност, неориентираност, гняв, кошмари, халюцинации, психози, неадекватно поведение и други нежелани поведенчески реакции. В подобен случай лечението с лекарството следва да бъде преустановено. Подобни реакции се развиват по-често при деца и индивиди в напреднала възраст.

При многократно провеждани за продължителен период от време курсове на лечение с Valium може да се загуби отговорът към провежданото бензодиазепиново лечение.

Може състоянието на тревожност да се появи отново. Това е преходен синдром, при което симптомите, довели до започване на лечението с Valium, се появяват в по-силно проявена форма. Това може да се развие при прекратяване на лечението. Може да бъде съпроводено от други реакции, включително промени в настроението, тревожност и безпокойство.

Тъй като рискът от повторна поява на оплакванията или феномен на абстиненция е по-висок при рязко прекратяване на лечението, се препоръчва постепенно намаляване на дозата.

4.5 Взаимодействие с други лекарства и други форми на взаимодействие

Ако Valium се комбинира с централно-действащи лекарства като антипсихотици, анксиолитици/седатива, антидепресанти, хипнотици, противогърчови, наркотични аналгетици, анестетици и седативни антихистамини, е възможно интензифициране на седативните ефекти. При прилагане на аналгетици усилената еуфория може също да доведе до увеличаване на психичната зависимост. Пациентите в напреднала възраст изискват специално наблюдение.

Едновременното приложение с приемане на алкохол не се препоръчва поради усиляне на седативния ефект. Това оказва влияние върху способността да се шофира или работи с машини.

Фармакокинетичните проучвания върху потенциалните взаимодействия между Valium и анти-епилептични лекарства показват противоречиви резултати. Съобщава се както за увеличаване и намаляване на лекарствените нива, така и за липса на подобни промени. Когато Valium се прилага едновременно с анти-епилептични средства, нежеланите реакции и токсичността могат да бъдат по-изразени, особено при хидантоини или барбитурати, или комбинирани препарати, които ги съдържат. Това налага допълнителни грижи при коригиране на дозата в началните фази на лечението.

Известно е, че доказани инхибитори на чернодробните ензими, напр. cimetidine, fluvoxamine и omeprazole, намаляват клирънса на бензодиазепините и могат да усилят тяхното действие. В същото време индукторите на чернодробните ензими, напр. rifampicin, могат да увеличат клирънса на бензодиазепините. Има и съобщения за възможен ефект на diazepam върху метаболитното елиминиране на phenytoin.



Cisapride може временно да увеличи седативния ефект на перорално прилаганите бензодиазепини поради по-бързата абсорбция.

4.6 Бременност и кърмене

Няма данни за безвредността на препарата по време на бременност при хора, а данните от проучванията върху животни не изключват наличието на определен риск. Да не се прилага по време на бременност, особено през първите и последните три месеца, освен ако няма основателни причини.

Ако лекарството се предписва на жени във фертилна възраст, те трябва да бъдат предупредени, че се налага консултация с лекаря, ако възнамеряват да забременеят или имат съмнение за развитие на бременност.

Прилагането на високи дози или продължителното прилагане на ниски дози бензодиазепини в последните три месеца от бременността причинява нарушаване на сърдечния ритъм на плода, както и хипотония, промяна в смукателния рефлекс, хипотермия и умерено потискане на дишането при новородени. Трябва да се помни, че при новородени ензимната система, участваща в разграждането на лекарството, не е напълно развита (особено при недоносени).

Освен това новородени от майки, приемали продължително бензодиазепини през последните месеци на бременността, могат да развият физическа зависимост и могат да станат рискови по отношение развитието на симптоми на привикване в постнаталния период.

Diazepam се открива в кърмата. Поради това прилагането на Valium по време на кърмене следва да се избягва.

4.7 Влияние върху способността за шофиране и работа с машини

Пациентите следва да бъдат информирани, че както и останалите лекарства от този вид, Valium може да промени способността на пациентите да извършват определени действия. Седирането, амнезията и увредената способност за концентрация, както и променената мускулна функция могат да повлияят неблагоприятно уменията за шофиране и работа на машини. При недостатъчна продължителност на съня вероятността от подобни увреждания може да нарасне. Освен това пациентите следва да знаят, че алкохолът може да увеличи степента на увреждане и поради това по време на лечението следва да се избягва (виж също Взаимодействие с други лекарства и други форми на взаимодействие).

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Най-често срещани нежелани реакции са умора, сънливост и мускулна слабост. Тези феномени обикновено се наблюдават в началото на лечението и при по-нататъшното приложение отзвучават. Могат да се наблюдават още: атаксия, объркване, запек, депресия, диплопия, дизартрия, стомашно-чревни смущения,



главоболие, хипотензия, инконтиненция, променено либидо, гадене, сухота в устата или хиперсаливация, кожни реакции, провлечен говор, тремор, уринна задръжка, световъртеж и променено зрение; много рядко покачване на трансминазите и алкалната фосфатаза, както и случаи на иктер. Пациентите в напреднала възраст са особено чувствителни към ефектите на централно действащите депресанти, които могат да причинят объркване, особено при наличие на органични промени в мозъка. При такива пациенти дозата Valium не трябва да надвишава половината от препоръчаната при останалите възрастни.

Пациентите в напреднала възраст и с увредена чернодробна функция са особено податливи на описаните по-горе нежелани реакции. Препоръчва се да се прави редовна преоценка на провежданото лечение, като прекратяването стане максимално бързо.

Приложението на бензодиазепини може да прояви предхождаща депресия.

Продължителното приложение (дори в терапевтични дози) може да доведе до развитие на физическа и психична зависимост (виж 4.4 Специални предпазни мерки); преустановяването на лечението може да причини поява на абстиненция или феномен на повторна поява на оплакванията.

Има данни за злоупотреба с бензодиазепинови средства.

Бензодиазепините могат да отключат антероградна амнезия (виж 4.4 Специални предпазни мерки).

Има данни за развитие на парадоксални реакции като безпокойство, агитация, раздразнителност, агресивност, неориентираност, гняв, кошмари, халюцинации, психози, неадекватно поведение и други поведенчески реакции (виж 4.4 Специални предпазни мерки).

4.9 Предозиране

Предозирането на бензодиазепини обикновено се проявява с депресия на централната нервна система от сънливост до кома. В леките форми се проявява със сънливост, психично разстройство и летаргия. При по-тежките форми се появява атаксия, хипотония, хипотензия, потискане на дишането, кома (рядко) и смърт (много рядко).

При приемане едновременно с централно-действащи лекарства, особено алкохол, вероятността ефектите на предозиране да са по-изразени нараства, като при липса на поддържащи мерки това може да се окаже фатално.

При овладяване на предозиране винаги трябва да се има пред вид, че може да са използвани много лекарства. След предозиране на перорални бензодиазепини трябва да се предизвика повръщане (до 1 час след приема), ако пациентът е в съзнание, а ако е в безсъзнание – да се извърши стомашен лаваж с протекция на въздушните пътища. Ако изпразването на стомаха няма очаквания благоприятен ефект, за намаляване на абсорбцията следва да се приложи активен въглен. Ефектът от провеждането на диализа не е известен. Специално внимание следва



в интензивно отделение да се обърне на дихателната и сърдечна функции. Специфичен венозно прилаган антидот при спешни ситуации е Anexate (flumazenil). Пациентите, при които се налага подобна интервенция, трябва да бъдат под постоянно наблюдение в болница (виж съответната лекарствена информация). Особено внимание изисква прилагането на Anexate при епилептици лекувани с бензодиазепини.

При поява на възбуда не трябва да се прилагат барбитурати.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНА ХАРАКТЕРИСТИКА

5.1 Фармакодинамична характеристика

Valium притежава анксиолитични, противогърчови и централни мускулно-релаксиращи свойства.

Тези свойства са резултат от стимулиране на действието на γ -аминомаслената киселина (ГАМК), която е най-важният инхибиторен невромедиатор в мозъка. Автономната му активност е слаба.

5.2 Фармакокинетична характеристика

Абсорбция

Diazepam се абсорбира бързо и пълно от стомашно-чревния тракт, като максимални плазмени концентрации се достигат 30 – 90 минути след перорално приложение.

Разпределение

Diazepam и неговите метаболити се свързват екстензивно с плазмените протеини (diazepam 98%). Diazepam и неговите метаболити преминават кръвно-мозъчната и плацентарна бариери, като се откриват в кърмата в концентрации приблизително една десета от тази в плазмата на майката.

Метаболизъм

Diazepam се метаболизира основно до фармакологично активни метаболити като N-desmethyldiazepam, temazepam и oxazepam.

Елиминиране

Профилът плазмени концентрации-време на diazepam след венозно приложение е двуфазен, с бърза начална фаза на екстензивно разпределение, последвана от удължена терминална фаза на елиминиране (време на полуживот до 48 часа). Времето за полуживот на активния метаболит N-desmethyldiazepam е до 100 часа. Diazepam и неговите метаболити се екскретират основно в урината, предимно в конюгирана форма. Клиринсът на diazepam е 20-30 ml/min.

Многократното дозиране води до кумулиране на лекарството и неговите метаболити. Последните изискват две седмици за постигане на състояние на устойчиво равновесие, като концентрациите им могат да надвишат тази на изходния продукт.



Фармакокинетика при специални клинични ситуации

Времето на полу-елиминиране може да бъде удължено при новородени, при пациенти в напреднала възраст и с чернодробно заболяване. При бъбречна недостатъчност времето на полу-елиминиране на diazepam остава непроменено. Няма определена връзка между плазмените нива на Valium и клиничния ефект.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Няма данни.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ОСОБЕНОСТИ

6.1 Списък на помощните вещества

Всяка таблетка от 5 mg съдържа: Lactose, maize starch, magnesium stearate, iron oxide yellow E 172.

6.2 Несъвместимост

Не са известни.

6.3. Срок на годност

PVDC и PVC блистърни опаковки: 5 години

6.4 Специални предпазни мерки при съхранение

Не съхранявайте при температура над 30°C. Съхранявайте в оригиналната опаковка. Пазете от директна светлина.

6.5 Вид и съдържание на първичната опаковка

Valium таблетките се предлагат в блистерни ленти, в опаковка от 25 таблетки.

6.6 Инструкции за употреба

Няма.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Рош България ЕООД, ул. "Бяло поле" 16, 1618 София, България

8. ДАТА НА (ЧАСТИЧНА) КОРЕКЦИЯ НА ТЕКСТА

м. октомври 2003 г.

