

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Diazepam Gerot 10 mg/2, 5 ml rectal solution
Диазепам Герот 10 mg/2,5 ml ректален разтвор

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

1 туба с ректален разтвор 2, 5 ml съдържа 10 mg диазепам

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВОТА

Кратка характеристика на продукта - Приложение 1

Към Рег. № *2130054*

Разрешение № *11-21086* / *11.02.2013*

Одобрение № /

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Ректален разтвор

Тубите Диазепам Герот 10 mg/2,5 ml ректален разтвор съдържат бистър до бледожълт разтвор.
При температура 20°C разтворът има рН между 6,4 и 7,0.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Терапевтични показания

- Епилептични припадъци и фебрилни гърчове,
 - Мускулни спазми при тетанус,
 - Като премедикация преди малки оперативни или стоматологични интервенции,
 - За първоначално лечение на остри, тежки състояния на безпокойство, напрежение и възбуда, и в случаи, при които интравенозното приложение е невъзможно или нежелателно, въпреки че трябва да се постигне бърз терапевтичен ефект.
- Диазепам Герот ректален разтвор е особено подходящ за постигане на бърз терапевтичен ефект при третиране на гърчове при деца.

4.2 Дозировка и начин на приложение

По принцип дозата зависи от възрастта и теглото, както и от индивидуалния отговор на пациента.

За деца с телесно тегло до 15 kg се предлагат туби Диазепам Герот 5 mg ректален разтвор .

Деца с телесно тегло под 10 kg, на възраст под 1 година:

Не се препоръчва употреба на лекарствения продукт.

Деца с телесно тегло под 15 kg, на възраст между 1 и 3 години:

Препоръчва се доза от 5 mg диазепам = 1 туба Диазепам Герот 5 mg ректален разтвор. При необходимост (персистиране или рецидив на гърчовете), може допълнително да се приложат 5 mg диазепам.

При деца под 3 годишна възраст, ректалният накрайник на тубата трябва да се вкара само наполовина.

Деца с телесно тегло над 15 kg, на възраст 3 и повече години:

Препоръчва се доза от 10 mg диазепам = 1 туба Диазепам Герот 10 mg ректален разтвор. При необходимост (персистиране или рецидив на гърчовете), може допълнително да се приложат 10 mg диазепам.

Възрастни (над 18 годишна възраст):



Препоръчва се доза от 10 - 20 mg диазепам = 1 – 2 туби Диазепам Герот 10 mg ректален разтвор. При необходимост (персистиране или рецидив на гърчовете), може допълнително да се приложат 10 mg диазепам.

Лечението може да се повтори на всеки 12 часа. При първоначално използване на по-високи дози или многократно приложение, трябва да се следи дишането на пациента. В случай, че припадъците не могат да се контролират, трябва да се предприемат други антиконвулсивни мерки.

Пациенти в напреднала възраст (над 65 години) или немощни възрастни:

Препоръчва се доза от 5 mg диазепам = 1 туба Диазепам Герот 5 mg ректален разтвор. При необходимост (персистиране или рецидив на гърчовете), може допълнително да се приложат 5 mg диазепам.

Употреба при пациенти с нарушение на чернодробната, бъбречната или белодробната функции и сърдечна недостатъчност:

Препоръчва се доза от 5 mg диазепам = 1 туба Диазепам Герот 5 mg ректален разтвор. При необходимост (персистиране или рецидив на гърчовете), може допълнително да се приложат 5 mg диазепам.

Начин на приложение





Алуминиевото саше, съдържащо индивидуално опакованите туби трябва да се отвори непосредствено преди употреба.

Разтворът се прилага ректално. Пациентът трябва да бъде в странично положение.


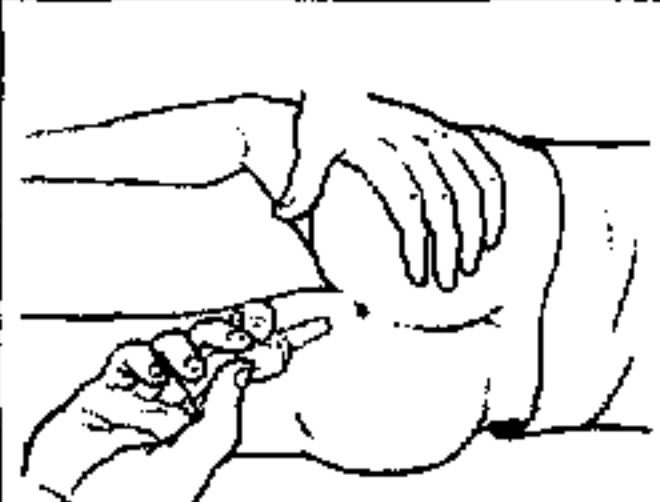


Разкъсайте фолиото на опаковката.

Ректални туби с отворена канюла: Развийте затварящата капачка.

Ректални туби с капачка с шип: Развийте затварящата капачка и пробийте мембраната на тубата с шипа на капачката.

| | | | | |
|---|---|--|---|--|
|  |  |  |  |  |
| <p>1 Поставете пациента в странично положение</p> | <p>2 Свийте коляното на крайника, който е отгоре и го издърпайте леко напред..</p> | <p>3 Събуйте пациента.</p> | <p>4 Разтворете леко двете седалищни половини.</p> | <p>5 Внимателно вкарайте крайника на тубата. При деца под 3 години, крайникът трябва да се вкара само наполовина.</p> |



| | | | | |
|---|---|---|---|--|
|  |  |  |  | |
| 6 Бавно изстискайте тубата, докато се изпразни. | 7 Отстранете изстисканата туба. Не освобождавайте седалището, докато не отстраните напълно тубата. | 8 Притиснете двете седалищни половини една към друга за около 5 секунди, така че да не се излее течността. | 9 Отбележете времето на приложение. Следете редовно пациента. | |

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активната съставка, други бензодиазепини или към някое от помощните вещества.
- Миастения гравис.
- Тежко нарушение на дихателната функция евентуално водещо до потискане на дишането.
- Синдром на апнея по време на сън.
- Тежко нарушение на функцията на черния дроб евентуално водещо до развитие на енцефалопатия.
- Тежка алкохолна интоксикация или интоксикация с други вещества, които потискат централната нервна система.
- Тежка хронична хиперкапния.
- Тежки състояния на шок.
- Кома.
- Поради функционална незрялост на метаболизма, Диазепам Герот5 mg ректален разтвор не трябва да се използва при преждевременно родени и новородени бебета през първите 30 дни от живота на детето или при деца на възраст под една година.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Развитие на толерантност

При многократна употреба в продължение на няколко седмици е възможно намаляване на ефекта на диазепам.

Зависимост

При лечение с диазепам, рискът от развитие на зависимост е минимален при краткотрайна употреба, но е възможно възникване на симптоми на отнемане, дори при краткотрайно лечение с нормални терапевтични дози.

Възможни симптоми на отнемане

Обикновено са възможни следните прояви: главоболие, мускулни болки, силно проявено безпокойство и напрежение, възбуда, обърканост и раздразнителност.

В тежки случаи са възможни следните симптоми на отнемане: дереализация, деперсонализация, безчувственост и изтръпване на крайниците, повишена чувствителност към светлина, допир, халюцинации или епилептични припадъци.



Амнезия

Бензодиазепините може да отключат антероградна амнезия, която най-често възниква няколко часа след прием на продукта (вж. също 4.8 Нежелани лекарствени реакции).

Психични и необичайни (парадоксални) реакции

При пациенти, приемащи бензодиазепини може да се появят реакции, като безпокойство, възбуда, агресивност, самозаблуда, силен гняв, нощни кошмари, халюцинации, психози, неадекватно поведение и други поведенчески проблеми.

При поява на подобни реакции трябва да се преустанови лечението с диазепам.

По-вероятно е възникване на парадоксални реакции при деца и пациенти в напреднала възраст.

Специални групи пациенти

Приложението на диазепам при пациенти, третирани с депресанти на ЦНС, при болни в напреднала възраст или тежко болни пациенти, пациенти с органични мозъчни увреждания (артериосклероза), със сърдечна недостатъчност и/или дихателна недостатъчност, или при малки деца може да доведе до потискане на дишането.

Диазепам трябва да се използва внимателно при пациенти с нарушение на бъбречната или чернодробна функции (вж. 4.2 Дозировка и начин на приложение и 4.3 Противопоказания).

Освен това, диазепам трябва да се използва внимателно при пациенти с тясно-ъгълна глаукома. Както и при другите бензодиазепини, особено внимание се изисква, когато диазепам се предписва на пациенти с психични нарушения, напр. личностни разстройства, фобии, психози, маниакално-натрапчиви разстройства, безпокойство и депресия. При болни с депресия или агресивни към себе си и околните пациенти, под влияние на бензодиазепините може да се стимулира извършването на самоубийство.

Диазепам трябва да се използва особено внимателно при болни с анамнеза за алкохолна или лекарствена зависимост.

При продължително, често многократно прилагане на високи дози се препоръчва контрол на кръвната картина и чернодробната функция.

4.5 Взаимодействия с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Депресанти на ЦНС

При приложение с депресанти на ЦНС (напр. антипсихотици, анксиолитици, седативи, антидепресанти, хипнотици, опиоидни аналгетици, анестетици, антиепилептици, седативни антихистамини), потискащият ЦНС ефект може да се потенцира и да възникнат дихателна или сърдечносъдова недостатъчност.

Алкохол

Възможно е усилване на седативния ефект. По тази причина трябва напълно да се избягва едновременния прием на алкохол и диазепам.

Опиоидни аналгетици

Възможно е усилване на еуфоричните чувства, което да доведе до увеличаване на психичната зависимост.

Средства, които се метаболизират чрез цитохром P450 ензимната система

След като диазепам се метаболизира в черния дроб посредством цитохром P450 ензими, може да се очакват взаимодействия в насока както увеличаване, така и намаляване ефектите с всички лекарствени продукти, които се разграждат по същия метаболитен път (напр. клозапин, изониазид, дисулфирам, симетидин, омепразол, орални контрацептиви, теофилин, азолови противогъбични препарати, рифампицин).

Клозапин



Повишен е рискът от сърдечносъдов колапс, вероятно вследствие на сърдечен и респираторен арест.

4.6 Бременност и кърмене

Бременност

Диазепам има вредни фармакологични ефекти върху бременността и новороденото.

Диазепам Герот ректален разтвор не трябва да се използва по време на бременност, освен в случай, че наистина е необходимо и няма друга безопасна алтернатива.

При прилагане на високи дози или продължително прилагане на ниски дози в последния период на бременността, или по време на раждане, при новороденото е възможно развитие на хипотермия, хипотония, умерено потискане на дишането, нарушаване на сърдечния ритъм на плода и влошаване на смукателния рефлекс („синдром на отпуснатото бебе“).

Ректалният разтвор съдържа бензилов алкохол. Бензиловият алкохол може да премине в кръвообращението на бебето.

Трябва да се има предвид евентуалната токсичност за преждевременно родените след приложение на Диазепам Герот ректален разтвор преди или след раждането.

Кърмене

Диазепам се излъчва в майчиното мляко. Кърменето трябва да се преустанови за период до 4 дни след приложението.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Диазепам Герот ректален разтвор има мощен ефект върху способността за шофиране и работа с машини. Третираните с Диазепам Герот ректален разтвор пациенти не трябва да шофират или работят с машини най-малко 24 часа след последното приложение.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Следните данни за честота се използват за оценка на нежеланите лекарствени реакции:

| | |
|-----------------------|---|
| Много чести: | ≥ 1 на 10 |
| Чести: | < 1 на 10, ≥ 1 на 100 |
| Нечести: | < 1 на 100, ≥ 1 на 1 000 |
| Редки: | < 1 на 1 000, ≥ 1 на 10 000 |
| Много редки: | < 1 на 10 000 |
| С неизвестна честота: | от наличните данни не може да бъде направена оценка |

При всяко групиране в зависимост от честотата, нежеланите лекарствени реакции се изброяват в низходящ ред по отношение на тяхната сериозност.

Изброените обичайни нежелани реакции може да бъдат обяснени с профила на фармакологичното действие на диазепам.

Изследвания

Редки: промени в чернодробните показатели (повишаване на ALAT, ASAT, алкална фосфатаза).

Сърдечни нарушения

Редки: синкоп, брадикардия, ортостатичен колапс, хипотония.

Нарушения на кръвта и лимфната система

Редки: агранулоцитоза, апластична анемия, левкопения, левкоцитоза.

Нарушения на нервната система

Чести: седиране, атаксия, тремор, замаяност, сънливост, главоболие, забавен говор, умора, неразположение.



Редки: парестезия, дискинезия, сухота в устата, хиперсаливация.

Очни нарушения

Чести: диплопия.

Редки: нистагъм, нарушения на акомодацията, замъглено зрение.

Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения

Редки: апнея, потискане на дишането, диспнея, забавено дишане, хипервентиляция, алергична астма, бронхоспазъм, ларингоспазъм.

Стомашно-чревни нарушения

Редки: повръщане, гадене, диария или запек.

Нарушения на бъбреците и пикочните пътища

Редки: инконтиненция, уринна задръжка, нарушено уриниране.

Нарушения на кожата и подкожната тъкан

Много редки: кожни алергични реакции, като ангиоедем, уртикария, пигментирана пурпура, екзантем, еритем.

Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан

Чести: отпускане на мускулите, мускулна хипотония.

Нарушения на ендокринната система

Редки: импотентност, повишено или понижено либидо, потискане на овулацията, нередовна менструация, антитиреоиден ефект (поради намалено освобождаване на TSH).

Нарушения на метаболизма и храненето

Редки: повишен апетит.

Социални предпоставки

Чести: зависимост или злоупотреба.

Хепатобилиарни нарушения

Редки: хепатоцелуларна жълтеница, холестатична жълтеница.

Нарушения на възпроизводителната система и гърдата

Редки: гинекомастия, галакторея и хиперплазия на млечните жлези.

Психични нарушения

Чести: парадоксални реакции, като остра свръхвъзбуда, пристъпи на силен гняв, безпокойство, халюцинации, нарушения на съня, безсъние, стимулация, усилен мускулни спазми, склонност към агресия, обърканост, антероградна амнезия, ступор, нарушения на паметта и познавателните способности, емоционално изчерпване.

Редки: депресия, апатия.

4.9 Предозиране

Симптоми

Предозирането може да се прояви като усилване на терапевтичните ефекти. В леки случаи, потискането на централната нервна система се проявява със седация, мускулна слабост и дълбок сън. При тежките форми може да се появят атаксия, хипотония, потискане на дишането, както и арефлексия, и дори кома (рядко), или фатален изход (много рядко).

Лечение

Лечението е симптоматично. Препоръчва се мониториране на дишането, сърдечната честота, кръвното налягане и телесната температура, както и прилагането на мероприятия за поддържане на сърдечносъдовата и дихателна функции, ако е необходимо. За отстраняване на централния потискащ ефект на бензодиазепините е показано прилагане на флумазенил.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: бензодиазепинови производни, диазепам.



АТС код: N05BA01

Диазепам е психотропно вещество от групата на бензодиазепиновите транквилизатори с изразени свойства за потискане на напрежението, възбудата и безпокойството, както и седативни и хипнотични ефекти. Освен това, диазепам притежава мускуло-релаксиращи и антиконвулсивни свойства. Тези ефекти се основават на потенциране на ефектите на гама-аминобутировата киселина, важен инхибиращ невротрансмитер в мозъка.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция

След ректална апликация на разтвора, диазепам се абсорбира много бързо и почти напълно от ректума. След ректална апликация, действието започва да се проявява след няколко минути. Плазмените нива след ректална апликация се повишават почти толкова бързо както след интравенозно приложение, но върхови плазмени концентрации са по-ниски отколкото след интравенозно приложение. При възрастни, върхови плазмени концентрации се достигат около 10 – 30 минути след ректално приложение на 10 mg диазепам ректален разтвор.

Разпределение

Свързването на диазепам с плазмените протеини е между 95 – 99%. Обемът на разпределение е между 0,95 и 2 l/kg телесно тегло в зависимост от възрастта. Диазепам и неговите метаболити преминават през кръвно-мозъчната и плацентарната бариера и се излъчват в майчиното мляко.

Метаболизъм

Диазепам се разгражда главно в черния дроб до метаболитите N-дезметилдиазепам (нордиазепам), темазепам и оксазепам, които са също фармакологично активни.

Елиминация

Полуживотът на диазепам е двуфазен. Бързата начална фаза на разпределение е последвана от удължена терминална фаза на елиминация до 48 часа. Елиминационният полуживот на активните метаболити е 30 до 100 часа за N-дезметилдиазепам, 10 до 20 часа за темазепам и 5 до 15 часа за оксазепам. Диазепам и неговите метаболити се екскретират основно с урината под форма на глюкурониди; само 20% от метаболитите се откриват в урината през първите 72 часа. Клирънсът на диазепам е приблизително 20 – 30 ml/min.

Специални групи пациенти

Излъчването е предимно през бъбреците, но също така и с жлъчката. То зависи от възрастта, както и от чернодробната и бъбречна функции.

Пациенти в напреднала възраст и пациенти с бъбречно увреждане

При пациенти в напреднала възраст или при болни с нарушена бъбречна функция, времето за екскреция е удължено 2 до 4 пъти.

Увреждане на черния дроб

При пациенти с чернодробни заболявания (цироза на черния дроб, хепатит), времето за екскреция е удължено 2 пъти.

Новородени

При новородени, метаболизмът и елиминацията са значително по-бавни, отколкото при деца и възрастни.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Предклинични ефекти са наблюдавани само при дози значително превишаващи максималните терапевтични дози при хора. Приема се, че тяхното значение за хората е минимално.

Хронична токсичност

При проучванията при различни животински видове няма получени доказателства за настъпване на промени свързани с веществото.

Канцерогенен и мутагенен потенциал

Данните от няколко проучвания показват слаб мутагенен потенциал при високи концентрации, многократно превишаващи терапевтичните дози при хора. Не са провеждани продължителни проучвания за изследване на канцерогенния потенциал на диазепам.



Репродукционна токсичност

При мишки е установена вродена цепка на небцето при пренатално излагане на действието на диазепам. Освен вродена цепка на небцето при хамстери са установени и ексенцефалия и малформации на крайниците след прилагане на много високи пренатални дози на диазепам. При плъхове и примати не са отбелязани тератогенни ефекти. При проучванията при опитни животни, хронично излагани на ефекта на диазепам, са установени поведенчески проблеми в поколението. При мишки, след 1 до 6 седмично лечение с диазепам, са установени патологични промени в сперматозоидите.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Пропиленгликол, етанол (96%), бензилов алкохол, бензоена киселина (E210), натриев бензоат (E211), натриев хидроксид (за корекция на рН), вода.

6.2 Несъвместимости

Поради отсъствие на данни за съвместимост, този лекарствен продукт не трябва да се смесва с други лекарствени продукти.

6.3 Срок на годност

3 години.

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 25°C.

Да се съхранява в оригиналната опаковка.

Алуминиевото саше трябва да се отвори непосредствено преди употреба..

6.5 Данни за опаковката

Бели туби с ректален разтвор, с капачка с шип: 5 туби от нископлътностен полиетилен (LDPE) с ректален разтвор, с мембрана, с полипропиленови (PP) капачки, индивидуално опаковани в алуминиеви сашета.

Бели туби с ректален разтвор, с отворена канюла: 5 туби от нископлътностен полиетилен (LDPE) с ректален разтвор, с полипропиленови (LDPE) капачки, индивидуално опаковани в алуминиеви сашета.

Всяка туба съдържа 2,5 ml бистър до бледожълт ректален разтвор.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Gerot Pharmazeutika Ges.m.b.H, Arnehtgasse 3, 1160 Vienna, Австрия

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Ноември/2012

НАЧИН НА ОТПУСКАНЕ

Лекарственият продукт се отпуска по лекарско предписание. Предлага се само в аптеките. Разрешава повторно отпускане.

