

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА НА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА

Кратка характеристика на продукта - Приложение 1

Към РУ 2404 / 03.04.08

Одобрено: 18 / 03.06.08

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Myolastan® 50 mg

Миоластан 50 mg

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Една таблетка съдържа: Tetrazeram 50 mg

За помощните вещества виж т.6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Делими филмирани таблетки

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Показания

Поддържащо лечение на болезнени мускулни контрактури в ревматологията (в комбинация със специфични лечения).

4.2 Дозировка и начин на приложение

Само за възрастни.

Перорална употреба.

Таблетката се поглъща цяла без да се сдъвква, с малко количество вода.

Лечението се провежда за възможно най-кратък период от време, обикновено няколко дни.

При домашно лечение:

Началната доза Миоластан е 1 таблетка (50 mg) вечер преди лягане. Дозировката може постепенно да се увеличи с 1/2 т. дневно до достигане на максималната дневна доза от 2 таблетки (100 mg). Тази дозировка може да се раздели на 2 или 3 приема, като по-високата доза се взима преди лягане или като еднократна вечерна доза.

При вътреболнично лечение или при пациенти на легло:

Началната доза Миоластан е 1 таблетка (50 mg) вечер преди лягане. Дозировката може да се увеличи с 1/2 т. дневно до достигане на ефективна доза от 150 mg. Тази дозировка трябва да се приема на два приема (1 таблетка сутрин и 2 вечер) или разделено на три приема през деня.

Специални популации

Деца

Тетразепам не трябва да се предписва на деца под 1 година. Дневната доза при деца над 1 година не трябва да бъде > 4 mg/kg телесно тегло (виж т.4.4)

При пациенти в старческа възраст:

Препоръчително е да се прилагат по-ниски дози (половината от стандартната доза обикновено е достатъчна).

Чернодробно нарушение

Виж Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Бъбречно нарушение

Виж Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба



4.3 Противопоказания

Този лекарствен продукт не трябва да се използва в следните случаи:

- Известна алергия към бензодиазепини,
- Декомпенсирана дихателна недостатъчност,
- апнея по време на сън (sleep apnea),
- деца под 1 година

4.4 Специални предупреждения и специални предпазни мерки при употреба

Специални предупреждения

Фармакологична поносимост:

Анксиолитичния ефект на бензодиазепините и сходни субстанции трябва да се спира постепенно, независимо от използваната еднаква доза няколко седмици.

- **Зависимост:** всяко лечение с бензодиазепини може да доведе до развитие на физическа и психическа зависимост.

Няколко фактори повлияват появата на зависимост:

- продължителност на лечението,
- дозировка,
- едновременното приложение с други лекарства: психотропни, анксиолитици, хипнотици,
- комбиниране с алкохол,
- анамнеза за наличието на лекарствена или друга зависимост, включително и към алкохол.

Това може да доведе до т.н. синдром на отнемането при прекъсване на лечението, включвайки безсъние, главоболие, изразено безпокойство, миалгия, повишен мускулен тонус, епизодична раздразнителност, възбуда и дори объркване. В изолирани случаи, може да се наблюдават: тремор, халюцинации, припадъци.

- Толеранс може да се развие по време на продължителна употреба
- Предписването на тетразепам при болезнени мускулни контрактури обикновено е краткотрайно. Обаче, при продължителна употреба или високи дози е необходимо да се обясни на пациента как постепенно да спре лечението (от няколко дни до няколко седмици).
- Антероградна амнезия може да се развие, особено когато бензодиазепините се използват преди лягане и при кратка продължителност на съня (ранно събуждане поради външна причина).
- При деца, тетразепам си използва само при случаи когато лечението е наложително (тежък спастичен синдром)
- Продължителността на лечението трябва да е възможно най-кратка

Специални предпазни мерки при употреба

- **Миактения:** лечение с бензодиазепини може да засили симптомите. Не трябва да се използва по изключение и под внимателно наблюдение.
- Алкохол: консумацията на алкохолни напитки не се препоръчва паралелно на лечението.



- Пациенти в старческа възраст, или с бъбречна недостатъчност, е необходимо коригиране на дозата.
- При чернодробна недостатъчност, употребата на бензодиазепини може да причини енцефалопатия. Може да се наложи намаляване на дозата поради намаляване на екскрецията.
- При пациенти с дихателна недостатъчност, подтискащия ефект на бензодиазепините трябва да се вземат предвид (влошаване на хипоксията може да доведе до безпокойство, изискващо хоспитализация на пациента в интензивно отделение).
- При прекъсване на лечението: След продължително лечение или при подозирана лекарствена зависимост, прекъсване на лечението може да доведе до развитието на симптоми на отнемане. Пациентът трябва да бъде предупреден и се препоръчва постепенно спиране на лечението с редуциране на дозата в рамките на няколко седмици.
- Комбинирането на няколко бензодиазепини е без ефект и може засили лекарствената зависимост.

4.5 Лекарствени и други форми взаимодействия

Рискът от развитие на синдрома на отнемането се увеличава при комбинирането на бензодиазепини (предписани като анксиолитици или хипнотици)

НЕПРОРЪЧИТЕЛНИ КОМБИНАЦИИ

Алкохол

Трябва да се избягва приема на алкохол и лекарствени продукти, съдържащи алкохол (увеличен седативен ефект на бензодиазепините дължащ се на алкохола).

СЛЕДНИТЕ ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ ТРЯБВА ДА СЕ ИМАТ ПРЕДВИД

- **Други депресанти на централна нервна система:** морфинови производни (аналгетици и противокашлични), барбитурати, някои антидепресанти, N1 седативни антихистаминови препарати, транквилизатори различни от бензодиазепини, невролептици, клонидин и подобни субстанции.

Засилването на депресията може да има сериозни последици, особено при шофиране или работа с машини.

- Clozapine

Риск от колапс с респираторен и/или сърдечен арест е увеличен при комбинирането на клозапин и бензодиазепини.

- Cisapride

Временното увеличение на седативния ефект на бензодиазепини поради по-бърза абсорбция. Намаляване на бдителността може да направи опасно шофирането и работата с машини.

4.6 Бременност и кърмене

Бременност

При хора, тератогенният риск, ако съществува е изключително нисък. Някои бензодиазепини тератогенния ефект е възможен, но е доказан в



епидемиологични проучвания. Поради това се избягва предписването на тези лекарствени продукти през първите три месеца на бременността.

През последните три месеца на бременността не се предписват високи дози тъй като могат да предизвикат при новороденото неонатална хипотония или респираторен дистрес. Няколко дни или седмици след раждането може да възникне синдром на отнемане.

Кърмене

По време на кърмене не се прилагат бензодиазепини.

4.7 Влияние върху способността за шофиране и работа с машини

Необходимо е специално внимание при шофиране на превозни средства и при работа с машини поради риск от сънливост при употребата на продукта. Комбинирането с други лекарствени продукти може да засили седативния ефект (виж Лекарствени взаимодействия).

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Свързани са с приеманата доза и индивидуалната чувствителност на пациента:

Общи нарушения

- замаяност
- астения, сънливост (особено при пациенти в старческа възраст)
- мускулна хипотония

Неврологични и психиатрични нарушения

- антероградна амнезия (виж т.4.4), брадипсихия
– при някои пациенти (особено при деца и възрастни) парадоксални реакции могат да се наблюдават: раздразнителност, агресивност, възбуда, объркване, халюцинации,

•- Продължителна употреба (особено във високи дози) може да доведе до развитие на физическа зависимост, и прекъсването на лечението води до синдром на отнемането (виж т.4.4),

Това се наблюдава по-често при бензодиазепини с кратък полу-живот отколкото при такива с дълъг полу-живот (няколко дни).

Нарушения на имунната система

- реакции на свръхчувствителност, понякога тежки, включително анафилактикис, ангиоедем, и уртикария са били докладвани.

Нарушения на кожата и подкожната тъкан

- Макулопапуларни, еритематозен и прurigенозен сърбеж, екзема. Докладвани са случаи на кожни реакции като еритема мултиформе, синдром на Steven Johnson или токсична епидермална некролиза.

4.9 Предозиране

Симптоми

Случаите на предозиране могат да бъдат живото-застрашаващи при едновременната употреба на няколко депресанти на централната нервна система (включително и алкохол).

В случаите на прием на високи дози, основният белег на предозиране е летаргия и дори кома в зависимост от приетото количество.

Признаците при леките случаи на предозиране са объркване и летаргия.



По-сериозните случаи се характеризират с атаксия, хипотония, подтискане на дихателната функция, в изключителни случаи и смърт. Прогнозата е добра, особено ако липсва комбинация с други психотропни агенти, и при продължително лечение.

Мерки

Специално внимание се обръща в специализирани отделения на дихателната и сърдечно-съдовата функции. Изходът е благоприятен.

Прилагането на флумазенил може да е полезно за диагнозата и/или лечението на случайно или нарочно предозирание с бензодиазепини.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1 Фармакодинамични свойства

ДРУГИ ДЕЙСТВАЩИ НА ЦЕНТРАЛНАТА НЕРВНА СИСТЕМА АГЕНТИ

АТС: M03BX07

Тетразепам принадлежи към клас 1-4 бензодиазепини и има фармакодинамична активност качествено сходна с другите представители от класа:

- миорелаксант,
- анксиолитик,
- седативен,
- хипнотик
- антиконвулсантен,
- амнестичен ефект.

Тези свойства се дължат на специфичен агонизъм на действие на централен рецептор, който е част от GABA – OMEGA макромолекулярен рецепторен комплекс, наричан още BZ1 и BZ2 и регулира отварянето на хлорните каналчета.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция

Абсорбцията на тетразепам от гастроинтестиналния тракт е бърза, тъй като лекарственият продукт се открива в кръвта след 14 минути. Бионаличността му е висока.

Разпределение

В кръвта тетразепам се открива главно в непроменена форма, която е отговорна в най-голяма степен за фармакологичната активност.

Тетразепам притежава висока степен на плазмено свързване, като in vitro не се измества от различни аналгетици и противовъзпалителни лекарствени продукти.

Метаболизъм и разпределение

Метаболизмът на тетразепам е предимно чернодробен:

Тетразепам главно се екскретира чрез урината (70%) и в по-малка-степен чрез фекалиите (30%); главният екскретиран метаболит е глюкуроконюгат (hydroxyl -3' tetrazepam).

Елиминационният полуживот е 22+/-4 часа.

След повторен прием на дневните дози липсва разлика във фармакокинетичните параметри в сравнение с тези след прием на еднократна доза.

Приемът на храна не променя фармакокинетичния профил на тетразепам.

При пациенти в напреднала възраст се установява удължено време на полуживот. Поради тази причина се препоръчва редуциране на дозата.



Кинетиката на тетразепам слабо се променя при бъбречна недостатъчност, дори и при тежка, обаче удължаването на плазмения полуживот, чиито различия между отделните индивиди са значителни, налага редуциране на дозата при пациенти с тежка бъбречна недостатъчност.

В случаите с чернодробна недостатъчност, поради забавяне на екскрецията се налага редуциране на дозата.
Установено е преминаването на бензодиазепините през плацентата и в майчиното мляко.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества и техните количества

Ядро:

Микрокристална целулоза; нишесте, прежелатинизирано; магнезиев стеарат, коповидон, за една необвита таблетка с тегло 200.00 mg

Обвивка:

Хидроксипропилцецулоза, талк, титаниев диоксид, триацетин.

6.2 Физико-химични несъвместимости

Не са описани.

6.3 Срок на годност

36 месеца

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява на стайна температура под 25 °С, на сухо и тъмно място.

6.5 Данни за опаковката

2 топлинно формирани блистери (PVC/алуминий) с по 10 таблетки.

6.6 Препоръки при употреба

Вижте "Дозировка и начин на приложение"

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Sanofi-Aventis France

1 – 13, boulevard Romain Rolland,

75014 Paris

Франция

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР

20000339

9. ДАТА НА ПОСЛЕДНА РЕДАКЦИЯ НА ТЕКСТА

Декември 2007

