

ЗБИРЕН ИЗВЕШТАЈ ЗА ОСОБИНИТЕ НА ЛЕКОТ

DIAZEPAM / ДИАЗЕПАМ

diazepam

таблети
супозитории

Зба

1. ИМЕ НА ЛЕКОТ:

DIAZEPAM / ДИАЗЕПАМ

2. КВАЛИТАТИВЕН И КВАНТИТАТИВЕН СОСТАВ:

diazepam (таблети од 2 mg)
diazepam (таблети од 5 mg)
diazepam (таблети од 10 mg)
diazepam (супозитории од 5 mg)
diazepam (супозитории од 10 mg)

3. ФАРМАЦЕВТСКИ ОБЛИК:

таблети
супозитории

4. КЛИНИЧКИ ПОДАТОЦИ:

4.1. *Терапевтски индикации*

- анксиозни состојби, страв, напнатост од било која етиологија
- несоница,
- апстиненцијален синдром кај алкохолизам,
- конвулзии, централни и периферни мускулни спазми,
- премедикација пред хируршки зафат или друга дијагностичка или терапевтска процедура.

4.2. *Дозирање и начин на употреба*

Дозирањето на диазепам е индивидуално во однос на состојбата на болниот и клиничката слика на болеста.



Возрасни:

Вообичаена доза за возрасни е 2-5 mg, 2-3 пати дневно.

Анксиозност, невротски реакции: 2-10 mg, 2-3 пати дневно.

Несоница: 4-10 mg диазепам навечер пред спиење.

Апстиненцијален синдром: 5-10 mg, 3-4 пати (дневно) првите 24 часа, а потоа 5 mg 3 пати дневно.

Конвулзии: 2-10 mg, 2-3 пати дневно

Деца:

Вообичаена доза за деца постари од 6 месеци е 0.1 до 0.3 mg/kg/t.t на ден.

Постари пациенти:

2 mg диазепам 1 до 2 пати дневно.

4.3. Контраиндикации

- преосетливост на бензодијазепини или на некоја од помошните супстанции,
- респираторна инсуфициенција,
- тешки оштетувања на црниот дроб,
- мијастенија гравис,
- акутен глауком тесен агол,
- бременост,
- синдром на ноќна апнеа,
- акутна интоксикација со алкохол или други депресори на ЦНС,
- кома.

4.4. Мерки на претпазливост

- постари пациенти, деца и пациенти со органски лезии на ЦНС (кај овие пациенти подносливоста е индивидуално варијабилна)
- хронични белодробни заболувања (можно влошување на истата),
- срцева инсуфициенција,
- шок,
- склоност кон конзумирање алкохол
- депресија на виталните функции,
- психотични пациенти,
- депресија,
- суицидни тенденции,
- хепатална и ренална инсуфициенција,
- депресија на респираторна функција.

При примената на диазепам можна е појава на зависност, особено ако се земаат високи дози подолг временски период.

При ненадеен прекин на терапијата можна е појава на "rebound" феномен (влошување на анксиозноста или инсомнијата). Поради ова третманите со диазепам кои траат подолго треба секогаш да се прекинуваат постепено.



Исто така, посебно внимание е потребно при употреба на супзиториите кај болни со ренална инсуфициенција, заради можна појава на метаболна ацидоза, предизвикана од присуство на ПЕГ.

4.5. Интеракции

- *алкохол*: диазепам ја намалува толеранцијата кон алкохол, затоа не смее да се конзумира алкохол,
- *седативи, антидепресиви, невролептици, антипсихотици, барбитурати, опиоиди, анестетици, МАО инхибитори, антиепилептици, антихистаминици*: зголемен инхибиторен ефект на ЦНС,
- *еритромицин, рифампицин*: зголемен ефект на диазепам,
- *леводопа*: диазепам го намалува дејството на леводопа,
- *циметидин, омепразол*: го намалува клиренсот на диазепам и ја пролонгира неговата екскреција и неговите ефекти,
- *антифунгални лекови (флуконазол, кетоконазол, интраконазол)*: можно е зголемување на плазматските концентрации на диазепам и обемот на несакани дејства,
- *орални контрацептиви*: можат да го намалат метаболизмот на диазепам.

4.6. Бременост и доење

Диазепам не се препорачува за време на бременост. Диазепамот ја преминува плацентарната бариера, а концентрациите во фетусот се слични на оние во плазмата на мајката. Елиминацијата на диазепамот и неговите метаболити се одвива и преку мајчиното млеко и може да доведе до појава на несакани ефекти кај доенчето. Диазепам не треба да се употребува за време на доење освен ако не е неопходно. Доколку се одпочне терапија со диазепам, доењето треба да се прекине.

4.7. Влијание врз способноста за возење или ракување со машини

Лекот може да влијае на психофизичките способности на пациентите, особено ако се зема заедно со алкохол или депресори на ЦНС. Пациентите треба да бидат предупредени од страна на лекарот или фармацевтот дека лекот може да ја промени способноста за управување возило или ракување со машини.

4.8. Несакани дејства

Диазепамот, даден орално во терапевски дози, добро се поднесува. Можно е појава на несакани дејства, како што се замор, поспаност, атаксија, конфузија, слабост, вртоглавица, синкопа, пореметување во помнењето. Останати несакани дејства се: главоболка, гадење, повраќање, констипација, зголемен апетит, анорексија, сушење на устата, хиперсаливација и бронхијална секреција, отечен јазик и горчлив или метален



вкус. При долготрајна употреба на диазепам, можат да се јават неутропенија, жолтило (icterus), и заради тоа се препорачува повремена контрола на крвната слика и ензимски тестови на црниот дроб. При нагол прекин на терапијата со диазепам може да дојде до појава на конвулзии, тремор, абдоминални и мускулни грчеви, повраќање и препотување.

4.9. *Предозирање*

Во случај на предозирање можат да се јават сомноленција, вртоглавица, замор, дизартрија и респираторна инсуфициенција. Во потешки случаи, може да дојде и до кома, хипорефлексија или арефлексија, па дури и застој во дишењето, особено при истовремено земање на алкохол или други депресори на ЦНС. *Третман на предозирање:* Специфичен антидот е флумазенил и се администрира интравенски. Со оглед на тоа што неговото дејство е значајно пократко од дејството на диазепам, пациентите треба внимателно да се мониторираат повеќе часа после освестувањето и во колку е потребно да се примени симптоматска терапија.

5.0. ФАРМАКОЛОШКИ СВОЈСТВА

5.1. *Фармакодинамски својства*

- фармакотерапевтска група

анксиолитик од групата на бензодијазепини

- механизам на дејство и фармакодинамски ефекти

Диазепам спаѓа во групата на бензодијазепини. Делува анксиолитички, седативно, антиконвулзивно и миорелаксантно, и помалку изразено хипнотичко дејство. Механизмот на дејство се остварува преку бензодијазепинските рецептори на ГАБА-ергичниот инхибиторен систем на ЦНС.

Бензодијазепините делуваат како агонисти на бензодијазепинските рецептори и на тој начин делуваат анксиолитички, седативно и антиконвулзивно. Диазепамот, како и сите бензодијазепини делува пред сè на лимбичниот систем, за кој се знае дека ја контролира емоционалната состојба на човекот. На тој начин бензодијазепините ја отстрануваат психичката пренапнатост и стравот. Сите бензодијазепини во терапевтски дози предизвикуваат блага релаксација на скелетната мускулатура. Ова е како последица на инхибиторното дејство на бензодијазепините на полисинаптичките рефлексии во ЦНС.

5.2. *Фармакокинетски својства*

Диазепамот брзо се ресорбира од дигестивниот тракт.

Максималната концентрација во плазмата се постигнува за 30 минути до 2 часа. Диазепамот и неговите метаболити значително се врзуваат за плазма протеините (96-99%). Врзувањето зависи од полот: поголемо е кај мажите отколку кај жените.



Полувремето на елиминација е бифазно, со почетен $t_{1/2}$ од 7-10 часа и подолга втора фаза од 2-6 дена. Полувремето на елиминација на неговите метаболити е уште подолго. Кај пациенти во геријатријата и кај оние со хепатални заболувања $t_{1/2}$ е продолжен. Диазепамот ја преминува хематоенцефалната и плацентарната бариера, а преминува и во мајчиното млеко. Се метаболизира во активни метаболити (N-desmethyldiazepam и N-methyloxazepam), кои се конвертираат со помош на конјугација со глукуронска киселина во охазепам , пред да се елиминираат. Диазепамот се излачува воглавно преку бубрезите.

5.3. *Претклинички податоци*

Токсиколошките испитувања се опширно опишани во Експертскиот извештај за фармаколошко-токсиколошката документација од 2008 година.

6.0. ФАРМАЦЕВТСКИ ПОДАТОЦИ

6.1. *Состав*

- 1 таблета содржи 2 mg диазепам.
- 1 таблета содржи 5 mg диазепам.
- 1 таблета содржи 10 mg диазепам.
- 1 супозиторија содржи 5 mg диазепам.
- 1 супозиторија содржи 10 mg диазепам.

6.2. *Ексципиенти:*

Таблети:

- Лактоза монохидрат
- Кроскармелоза натриум
- Микрокристална целулоза
- Коповидон
- Магнезиум стеарат
- Натриум лаурил сулфат (таблети од 2 mg)
- Боја жолта Е 104 (таблети од 2 mg и 5 mg)
- Боја портокалова Е 110 (таблети од 2 mg)
- Боја плава Е 132 (таблети од 10 mg)
- Боја зелена Е104/Е132 (таблети од 5 mg и 10 mg)

Супозитории:

- ПЕГ подлога
- Метил парабен
- Пропил парабен

6.3. *Пакување*

- Кутија со 30 таблети од 2 mg
- Кутија со 30 таблети од 5 mg
- Кутија со 30 таблети од 10 mg
- Кутија со 5 супозитории од 5 mg
- Кутија со 5 супозитории од 10 mg



6.4. *Рок на траење*

Таблети:

3 години

Супозитории:

2 години

6.5. *Начин на чување*

Да се чува на температура до 25°C, заштитено од светлина.

ЛЕКОТ ДА СЕ ЧУВА НА МЕСТА НЕДОСТАПНИ ЗА ДЕЦАТА!

6.6. *Карактеристики на внатрешното (контактно) пакување*

Таблети:

Блистер пакување од алуминиумска тврда фолија и ПВЦ фолија

Супозитории:

ПЕ алвеоли

6.7. *Начин на издавање*

Лекот се издава само со лекарски рецепт.

7.0. *Име и адреса на производителот*

АД ЈАКА 80 Радовиш

Производна локација: Првوماјска б.б. Скопје

Република Македонија

8.0. *Дата на првата регистрација*

9.0. *Дата на последната ревизија на Збирниот извештај за особините на лекот*

Скопје, декември, 2007 г.

