

ЗБИРЕН ИЗВЕШТАЈ ЗА ОСОБИНИТЕ НА ЛЕКОТ

1. ИМЕ НА МЕДИЦИНСКИОТ ПРОИЗВОД

MYOLASTAN 50 mg, обележани, филм-обложени таблети.

2. КВАЛИТАТИВЕН И КВАНТИТАТИВЕН СОСТАВ

Tetrazepam.....50 mg

во 1 филм-обложена таблета

3. ФАРМАЦЕВТСКА ФОРМА

Филм-обложени таблети.

4. КЛИНИЧКИ СВОЈСТВА

4.1 Терапевтски индикации

Терапија на болни мускулни спазми во ревматологијата (во комбинација со специфична терапија).

4.2 Дозирање и начин на употреба

Лекот смее да се употребува само кај возрасни пациенти.

За перорална администрација.

Таблетата треба да се проголта цела, без да се цвака, со мала количина на вода.

Терапијата со MYOLASTAN треба да се дава во најкраток можен временски интервал, (обично од неколку дена).

Амбулантски пациенти: започнете го третманот со една филм-обложена таблета од 50 mg, навечер пред легнување. Дозата потоа може постепено да се зголемува за половина таблета секој ден, се до максималната доза од 100 mg еднаш на ден, која потоа може да се подели во две или три помали дози (со земање на најголемата доза пред легнување) или да се зема како единечна доза навечер пред легнување.

Хоспитализирани пациенти и лежечки пациенти: започнете го третманот со една филм обложена таблета од 50 mg, навечер пред легнување. Постепено зголемувајте ја дозата за половина таблета до 1 таблета, секој ден, се до достигнување на дозата со најголема ефикасност (150 mg), која потоа може да се подели во две помали дози (една таблета наутро и две таблети пред легнување) или на три помали дози.

Постари пациенти и пациенти со хепатално оштетување: се препорачува да примаат намалена доза од лекот (на пример за половина).

4.3 Контраиндикации

Лекот не смее да се употребува во следните случаи:

- преосетливост на активната супстанција или на некоја од помошните супстанции на лекот;
- тешко оштетена функција на респираторниот систем;
- синдром на апнеа при спиење;
- тешка акутна или хронична хепатална инсуфициенција (заради ризикот од развој на енцефалопатија);
- миастенија.



4.4 Предупредување и мерки на претпазливост

Предупредувања

ФАРМАКОЛОШКА ТОЛЕРАНЦИЈА

Анксиолитичното дејство на бензодиазепините и другите слични лекови може постепено да се намали (дури и ако се употребува истата доза), ако се администрираат во времетраење од неколку недели.

ЗАВИСНОСТ

Терапијата со бензодиазепини и лекови кои се слични на нив може да доведе до создавање на физичка и психичка зависност (посебно ако се работи за долготрајна терапија).

Врз создавањето на зависноста влијаат повеќе фактори:

- времетраењето на третманот,
- дозата,
- историја на други типови на зависност (од лекови или други супстанции, вклучувајќи и алкохол).

Зависност од лекот може да се јави и при примена на терапевтски дози и/или кај пациенти кај кои не се присутни фактори на ризик.

При прекин со терапијата може да дојде до појава на симптоми на апстиненција. Некои од овие симптоми се чести и вообичаени: инсомнија, главоболка, поголема анксиозност, мијалгија, тензија во мускулите, иритабилност.

Останатите симптоми се јавуваат поретко: агитација дури со епизоди на конфузија, парестезија на екстремитетите, преосетливост на светлина, врева и физички контакти, деперсонализација, дереализација, халуцинации, конвулзии.

Апстиненцијалните симптоми може да се јават во деновите кои следат по прекин со терапијата. При употреба на бензодиазепини со кратко дејство, посебно ако се даваат во високи дози, апстиненцијални симптоми може да се јават дури и во интервалот помеѓу две дози.

Комбинирањето на два или повеќе бензодиазепини го зголемува ризикот од појава на зависност од лековите, без разлика на индикацијата. Пријавени се случаи и на злоупотреба на лекот.

"REBOUND FENOMEN"

Овој транзиторен синдром може да се јави во вид на влошување на симптомите кои се индикација за терапија со бензодиазепини или слични лекови.

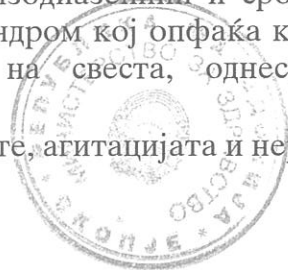
АМНЕЗИЈА И НАРУШЕНА ПСИХОМОТОРИКА

Во часовите по администрација на лекот може да дојде до развој на антероградна амнезија и нарушени психомоторни функции на пациентот.

НАРУШУВАЊА ВО ОДНЕСУВАЊЕТО

Кај одредени пациенти, употребата на бензодиазепини и сродни на нив супстанции може да доведе до појава на синдром кој опфаќа комбинација од различни степени на нарушување на свеста, однесувањето и меморијата. Регистрирана е појава на:

- влошување на инсомнијата, кошмарите, агитацијата и нервозата,



- бесмислени идеи, халуцинации, конфузна состојба, симптоми на психоза,
- дисинхибиција и импулсивност во однесувањето,
- еуфорија, иритабилност,
- антероградна амнезија,
- сугестибилност.

Овој синдром може да е пропретен со нарушувања кои го прават пациентот потенцијално опасен за себе и околината:

- однесување кое не е вообичаено за пациентот,
- агресивно однесување кон себе си или останатите, посебно ако луѓето од околината на пациентот се обидат да влијат врз неговите активности,
- автоматизам во однесувањето проследен со последователна амнезија.

Во овој случај терапијата треба да се прекине.

РИЗИК ОД АКУМУЛАЦИЈА

Бензодиазепините и сродните супстанции (како и сите останати лекови) се задржуваат во организмот во времетраење од 5 полуживоти (Видете дел 5.2-Фармакокинетика на лекот). Кај постари пациенти или кај пациенти со ренална или хепатална инсуфициенција, полуживотот на лековите може да е значајно продолжен. Лекот или неговите метаболити достигнуваат стабилни нивоа во плазмата многу побавно и овие концентрации се многу повисоки по употребување на повторени дози. Ефикасноста и безбедноста од употреба на лекот може да се проценува само ако е постигната негова стабилна концентрација во плазмата. Може да е потребно прилагодување на дозата (Видете дел 4.2).

ПОСТАРИ ПАЦИЕНТИ

Бензодиазепините и сродните супстанции мора внимателно да се употребуваат кај постари пациенти заради ризикот од седација и/или миоралаксантното дејство кое може да доведе до падови кои често се со сериозни последици кај ова популација.

Посебни мерки на претпазливост при употреба:

На пациентите со историја на алкохолизам или други видови на зависност, без разлика дали тие се поврзани со злоупотреба на лекови им се препорачува да превземат посебни мерки на претпазливост (Видете дел 4.5).

ПАЦИЕНТИ СО ГОЛЕМИ ЕПИЗОДИ НА ДЕПРЕСИЈА

Бензодиазепините и сродните супстанции не смее да се употребуваат самостојно заради тоа што влијаат врз текот на депресијата, и го зголемуваат ризикот за самоубиство.

ПОСТЕПЕН ПРЕКИН НА ТЕРАПИЈАТА

Оваа состојба мора детално да му се објасни на пациентот. Пациентите кај кои е потребно постепено прилагодување на дозата мора да бидат предупредени за можноста за појава на "rebound fenomen", со цел



да се минимизира анксиозноста која може да ја предизвикаат симптомите поврзани со прекилот на терапијата. Пациентот мора да е предупреден за можните nelaгодности поврзани со оваа фаза од терапијата.

ДЕЦА

Во одсуство на студии за безбедноста и ефикасноста од употреба на лекот кај деца, MYOLASTAN е наменет за примена само кај возрасни пациенти.

ПОСТАРИ ПАЦИЕНТИ, ПАЦИЕНТИ СО РЕНАЛНА И ХЕПАТАЛНА ИНСУФИЦИЕНЦИЈА

Заради ризикот од акумулација на лекот, кај ваквите пациенти дозата треба да се намали (на пример за половина)(Видете дел 4.4).

РЕСПИРАТОРНА ИНСУФИЦИЕНЦИЈА

Кај пациентите со респираторна инсуфициенција мора да се земе во предвид депресивниот ефект на бензодиазепините и сродните супстанции (појавата на анксиозност и агитација може да е предупредувачки знак на декомпензација на респираторната функција што налага префрлување на пациентот во единиците за интензивна нега).

АЛКОХОЛ

Пациентите не смеат да конзумираат алкохол или продукти кои содржат алкохол (види дел 4.5)

4.5 Интеракции

Комбинации кои не се препорачуваат

Алкохол

Седативното дејство на бензодиазепините и сродните супстанции се зголемува под влијание на алкохол. Нарушената будност влијае врз способноста за возење и управување со машини. Треба да се избегнува консумација на алкохолни пијалоци и лекови кои содржат алкохол.

Комбинации при кои е потребна посебна препазливост

Други седативи: деривати на морфиум (аналгетици, антитусици и супституциона терапија); невролептици, барбитурати, други бензодиазепини, не-бензодиазепински анксиолитици (како мепробамат) хипнотици, седативни антидепресиви (амитриптилин, доксепин, миансерин, миртазапин, тримипрамин), седативни H1 антихистаминици, централни антихипертензивни, баклофен, талидомид.

Ја зголемуваат депресијата со централно потекло. Нарушената будност влијае врз способноста за возење и управување со машини.

Барбитурати

Зголемен ризик од депресија на дишењето која во случај на предозирање може да има фатален исход.

Бупренорфин (како супституциона терапија)

Зголемен е ризикот од респираторна инсуфициенција, која може да е со летален исход. Пред да се употреби оваа комбинација мора внимателно да



се процени "cost/benefit" односот. Пациентот треба да се советува да се придржува до препорачаната доза.

Клозапин

Зголемен ризик од колапс со респираторна инсуфициенција и кардијален застој.

Деривати на морфиум

Зголемен ризик од респираторна инсуфициенција, која во случај на предозирање може да е со летален исход.

4.6 Бременост и доење

Бременост

Ризикот од тератогено дејство на лекот кај луѓе (ако воопшто постои) е многу низок. За одредени бензодиазепини постои сомневање дека може да имаат тератогено дејство, но тоа не е потврдено во епидемиолошките студии. Заради недостаток на податоци, се препорачува да се избегнува употреба на лекот за време на првиот триместер од бременоста.

Заради ризикот од појава на хипотонија и синдром на респираторен дистрес кај новороденото, се препорачува да се избегнува терапија со високи дози од лекот за време на последниот триместер од бременоста. Кај новороденото може да дојде до појава на апстиненцијални симптоми неколку дена до неколку недели по пораѓајот.

Доење

Не се препорачува употреба на лекот за време на доење.

4.7 Влијание врз способноста за возење и управување со машини

Пациентите кои возат и управуваат со машини треба да се свесни за ризикот од намалена будност.

MYOLASTAN не треба да се комбинира со други лекови со седативно дејство или ваквите комбинации треба да се земат во предвид при возење и управување со машини (Видете дел 4.5).

Ризикот за забавено реагирање и намалена свесност дополнително е зголемен ако пациентот не е во состојба доволно да се насие.

4.8 Несакани дејства

Несаканите дејства на MYOLASTAN се зависни од дозата која е администрирана и индивидуалната осетливост на пациентот.

Невроисхијатриски несакани дејства:

- антероградна амнезија која може да се јави и при употреба на терапевски дози од лекот, но ризикот расте со зголемување на дозата;
- нарушувања во однесувањето, нарушена свесност, иритабилност, агресија, агитација;



- психичка и физичка зависност (дури и при примена на тераписки дози), со појава на апстиненцијални симптоми и "rebound fenomen" по прекин на терапијата;
- чувство на опијанетост, главоболка, атаксија;
- конфузија, намалена свесност и поспаност (посебно кај постари пациенти), инсомнија, кошмари, напнатост;
- промени во либидото.

Оштетувања на кожата

- контактен екцем
- пруритичен макуло-папуларен раш
- erythema multiforme;
- Steven-Johnson-ов синдром и токсична епидермална некролиза.

Нарушувања на имуниот систем

- Нагли реакции на преосетливост како уртикарија, ангиоедем или анафилактичен шок

Оштети несакани дејствија

- хипотонија на мускулите, астенија.

Оштетувања на око

- диплопија.

4.9 Предозирање

Предозирањето со MYOLASTAN може да биде опасно по живот, посебно ако се работи за поли-интоксикација (интоксикација од комбинирана терапија со други депресанти на централниот нервен систем, вклучувајќи и алкохол).

При внес на голема количина од лекот предозирањето воглавно се манифестира со знаци на депресија од страна на централниот нервен систем. Депресијата може да варира од зашеметеност до кома, во зависност од внесената доза. Благите случаи на предозирање се манифестираат со ментална конфузија или летаргија, а посериозните со атаксија, хипотонија, хипотензија, депресија на респираторниот систем и во исклучително ретки случаи, смрт.

Во случај на перорално предозирање со MYOLASTAN, ако не е изминат повеќе од еден час, треба да се индуцира повраќање доколку пациентот е свесен или во спротивно да се направи гастрична лаважа со заштита на дишните патишта. По изминување на овој период, абсорпцијата на лекот може да се намали со администрација на активен јаглен. Се препорачува функцијата на срцето и на респираторниот систем внимателно да се следи. Администрација на флумазенил може да е корисна за дијагноза и/или терапија во случај на намерна и/или случајна интоксикација со бензодиазепини.

Антагонизирањето на дејството на безодиазепините од страна на флуменазил може да предизвика развој на неуролошки нарушувања (појава на конвулзии), посебно кај епилептични пациенти.



5. ФАРМАКОЛОШКИ СВОЈСТВА

5.1 Фармакодинамика

Фармакотерапевтска група: ДРУГИ ЛЕКОВИ СО ДЕЈСТВО ВРЗ ЦЕНТРАЛНИОТ НЕРВЕН СИСТЕМ

АТС код: M03BX07

Тетразепам припаѓа на класата од 1-4 бензодиазепини и има квалитативно слична фармакодинамичка активност со останатите лекови од оваа класа:

- миорелаксанти,
- анксиолитици,
- седативи,
- хипнотици,
- антиконвулзиви,
- лекови за амнезија.

Нивното дејство е резултат на специфичниот агонизам врз централните рецептори кои се дел од комплексот "GABA-OMEGA" макромолекуларни рецептори (познати и како BZ1 и BZ2) кои го регулираат отварањето на хлорните канали.

5.2 Фармакокинетика

Абсорпција

Абсорпцијата на тетразепам преку гастроинтестиналниот систем е брза, и времето до негова појава во крвта изнесува 14 минути. Биорасположивоста на тетразепам е висока.

Дистрибуција

Тетразепам е во најголем дел присутен во крвта во неизменета форма, на што се должи и неговото фармаколошко дејство. Тетразепам силно се врзува за протеините од плазмата и во *in vitro* услови не може да биде истиснат од страна на различни аналгетици и анти-инфламаторни лекови.

Метаболизам и елиминација

Тетразепам примарно се метаболизира преку хепарот.

Главен пат на елиминација на тетразепам е преку урината (70%) и во помала количина преку фецесот (30%). Главен екскретиран метаболит е неговиот коњугат со глукуронска киселина, хидрокси-3' тетразепам.

Полуживотот на елиминација е 22±4 часа.

По повторена администрација на дневните дози, фармакокинетичките параметри остануваат непроменети во однос на параметрите утврдени по администрација на единечна доза.

Храната не влијае врз фармакокинетичкиот профил на тетразепам.

Кај постари пациенти забележан е продолжен полуживот на елиминација на лекот; што налага редуцирање на дозата кај оваа популациона група.

Кинетиката на лекот останува во главно неизменета во случај на постоење на ренална инсуфициенција; дури и во случај на тешко оштетување на реналната функција. Сепак, заради продолжениот полуживот на елиминација на лекот кај овие пациенти како мерка на претпазливост се препорачува редуција на дозата.



Кај пациентите со хепатална инсуфициенција, регистрирана е забавена елиминација на лекот од организмот и потребно е намалување на дозата. Постојат докази дека бензодиазепините ја минуваат плацентарната бариера и се излучуваат во мајчиното млеко.

5.3 Предклинички податоци за безбедност

Нема достапни претклинички податоци за безбедноста на лекот.

6. ФАРМАЦЕВТСКИ СВОЈСТВА

6.1 Експципиенси

Јадро на таблетата: Коповидон, микрокристална целулоза, магнезиум стеарат, прежелатиниран скроб.

Филм-обложување: Opadry OY-S-38931 (талк, хипромелоза, титаниум диоксид (E171), глицерол триацетат).

6.2 Инкомпатибилност

Не е применливо.

6.3 Рок на употреба

3 години.

6.4 Посебни предупредувања за складирање

Производот треба да се чува на температура до 25°C.

6.5 Пакување

PVC/ Алуминиумски блистери

Пакување со 20 филм-обложени таблети

Пакување со 50 филм-обложени таблети

6.6 Упатство за употреба

Нема посебни препораки

7. ИМЕ И АДРЕСА НА ПРОИЗВОДИТЕЛОТ И НОСИТЕЛОТ НА ОДОБРЕНИЕТО ЗА ПРОМЕТ

Производител:

Sanofi Aventis S.a.

Ctra. La batlloria a Hostalric, Km 1,4

Riells i Viabrea-GIRONA

Spain

Носител на одобрението за промет во Република Македонија:

САНОФИ-АВЕНТИС Македонија Дооел-Скопје, Ленинова бр.5, Скопје,
Република Македонија

8. БРОЈ НА РЕШЕНИЕ ЗА ПУШТАЊЕ ВО ПРОМЕТ

9. ДАТУМ НА ПРВОТО РЕШЕНИЕ ЗА ПУШТАЊЕ ВО ПРОМЕТ/ОБНОВА НА РЕШЕНИЕТО

10. ДАТУМ НА ПОСЛЕДНАТА РЕВИЗИЈА НА ТЕКСТОТ

Јули 2012

