

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

RUDOTEL, 10 mg, tabletki

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Jedna tabletki zawiera 10 mg medazepamu (*Medazepamum*) oraz laktozę jednowodną. Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletka

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Leczenie objawowe ostrych i przewlekłych stanów lękowych, napięcia emocjonalnego i pobudzenia.

Nie wszystkie stany lękowe, napięcia emocjonalne i pobudzenia wymagają stosowania leków. Często są one objawem choroby psychicznej i można je leczyć z zastosowaniem innych środków lub przez zwalczanie choroby podstawowej.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie leku zależy od indywidualnej reakcji na lek, wieku pacjenta, jego płci oraz rodzaju i nasilenia choroby. Obowiązuje zasada, że należy stosować najmniejszą skuteczną dawkę a leczenie powinno trwać jak najkrócej.

O ile lekarz nie zaleci inaczej, należy przestrzegać następujących zaleceń:

Wymagające leczenia farmakologicznego stany napięcia emocjonalnego, pobudzenia lub lęku:

Dawka dobową leku wynosi na ogół 1 do 3 tabletek (10 do 30 mg medazepamu) podawana w 2 - 3 dawkach podzielonych lub jeden raz na dobę, wieczorem. Jeżeli dawka 30 mg na dobę nie powoduje pożądanego wyniku leczenia, lekarz może zalecić stosowanie produktu w dawce do 6 tabletek na dobę.

Zaleca się przyjmowanie leku wieczorem.

Szczególne zalecenia dotyczące dawkowania:

U pacjentów w wieku podeszłym lub w złym stanie ogólnym oraz u pacjentów z niewydolnością serca i (lub) hipotensją, którzy szczególnie silnie reagują na benzodiazepiny oraz u pacjentów z organicznymi schorzeniami mózgu należy starannie rozważyć konieczność stosowania leku. Dotyczy to także pacjentów z zaburzoną czynnością wątroby i nerek.

Tabletki należy przyjmować niezależnie od posiłków, nie rozgryzając, z wystarczającą ilością płynu.

W przypadku stosowaniu leku wieczorem należy go przyjmować około pół godziny przed położeniem się spać i nie bezpośrednio po posiłku, ponieważ wówczas może dojść do opóźnionego wystąpienia działania i w zależności od długości trwania snu - do wystąpienia następnego dnia rano objawów zmęczenia i trudności w koncentracji.

W leczeniu ostrych stanów napięcia emocjonalnego, pobudzenia lub lęku produkt należy stosować w pojedynczych dawkach lub kilka dni.

W leczeniu przewlekłych stanów napięcia emocjonalnego, pobudzenia lub lęku czas trwania kuracji zależy od przebiegu choroby. Po dwóch tygodniach stosowania codziennie lekarz powinien stopniowo zmniejszać dawkę w celu stwierdzenia, czy dalsze stosowanie leku jest konieczne. Kuracja nie może trwać dłużej niż 4 tygodnie.

Po długotrwałym stosowaniu zaleca się kontrolę morfologii krwi i parametrów czynności wątroby.

Po dłuższym stosowaniu (powyżej jednego tygodnia) w razie odstawiania leku, należy dawkę zmniejszać stopniowo. Należy przy tym liczyć się z możliwością wystąpienia objawów odstawienia.

Stosowanie u dzieci i młodzieży w wieku poniżej 18 lat:

Nie zostało określone bezpieczeństwo ani skuteczność leczenia dzieci i młodzieży poniżej 18 lat, dlatego nie należy stosować medazepamu w tej grupie wiekowej.

4.3 Przeciwwskazania

Produktu nie należy stosować w przypadku:

- znanej nadwrażliwości na medazepam, inne benzodiazepiny lub którykolwiek składnik produktu,
- występowania uzależnienia w wywiadzie,
- miastonii,
- ostrego zatrucia alkoholem, środkami nasennymi lub przeciwbólowymi, albo
 - lekami psychotropowymi (leki neuroleptyczne, przeciwdepresyjne lub lit),
- ataksji mózdkowej lub rdzeniowej,
- jaskry z zamkniętym kątem przesączania,
- ciężkiego uszkodzenia wątroby (np. żółtaczka cholestatyczna),
- zespołu bezdechu sennego.

Uwaga:

Produkt nie jest przeznaczony do stosowania u dzieci i młodzieży ze względu na niedostateczne doświadczenie na temat stosowania leku w tej grupie wiekowej.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Grupy ryzyka, środki ostrożności

W początkowym okresie stosowania leku lekarz powinien kontrolować indywidualną reakcję pacjenta na lek, aby odpowiednio szybko rozpoznać ewentualne przedawkowanie. Dotyczy to szczególnie pacjentów w wieku podeszłym lub w złym stanie ogólnym oraz pacjentów ze schorzeniami organicznymi mózgu, niewydolnością krążenia i oddychania oraz zaburzeniem czynności wątroby i nerek.

Należy udzielić pacjentom szczegółowych wyjaśnień odnośnie postępowania w warunkach życia codziennego, z uwzględnieniem szczególnych sytuacji życiowych (np. praca zawodowa).

Podczas stosowania produktu przez wiele tygodni występuje ryzyko rozwoju uzależnienia psychicznego i fizycznego. Dalsze stosowanie jest dopuszczalne jedynie w razie istnienia pilnego wskazania po starannym rozważeniu korzyści terapeutycznych oraz ryzyka rozwoju uzależnienia.

Po zastosowaniu leku w poradni w celu diagnostycznym pacjent może opuścić poradnię dopiero po godzinie i powinien udać się do domu z osobą towarzyszącą. Należy zwrócić uwagę pacjentowi, że nie może spożywać alkoholu.

Tolerancja leku

Zjawisko tolerancji wykazano dla działania uspokajającego benzodiazepin.

Uzależnienie

Długotrwałe zażywanie pochodnych benzodiazepin może doprowadzić do psychicznego i fizycznego uzależnienia. Ryzyko uzależnienia zwiększa się wraz z wydłużonym okresem leczenia. Należy szczególnie ostrożnie stosować lek u pacjentów wykazujących skłonność do uzależnienia lub nadużywania alkoholu, narkotyków i leków.

Objawy odstawienia

Długotrwałe leczenie należy przerywać stopniowo. W przypadku wystąpienia uzależnienia fizycznego, nagłe przerwanie leczenia spowoduje wystąpienie zespołu odstawienia. Po nagłym przerwaniu leczenia obserwowano skrajną postać zaburzeń lękowych, stany napięcia nerwowego, niepokój (zwłaszcza ruchowy), stany splątania i drażliwości. W poważniejszych przypadkach przerwaniu leczenia towarzyszyły także następujące objawy: utrata poczucia własnej rzeczywistości i depersonalizacja, przeculica słuchowa, zdrętwienie i mrowienie kończyn, nadwrażliwość na światło, hałas i dotyk, halucynacje lub napady padaczkowe.

Nawrót bezsenności i zaburzeń lękowych: Po nagłym odstawieniu leku może nastąpić przemijające nasilenie zaburzeń lękowych lub może wystąpić bezsenność. Objawom tym mogą dodatkowo towarzyszyć zmiany nastroju, niepokój, zaburzenia snu, a także niepokój (zwłaszcza ruchowy). Z tego powodu należy unikać nagłego przerywania leczenia i stopniowo zmniejszać dobowe dawki leku.

Niepamięć

Pochodne benzodiazepiny mogą wywoływać amnezję następczą. Objawy amnezji następczej występują najczęściej kilka godzin po zażyciu leku. W takim przypadku należy zapewnić choremu 7 do 8 godzin nieprzerwanego snu (patrz punkt 4.8).

Reakcje psychiczne i paradoksalne

W czasie stosowania benzodiazepin mogą wystąpić następujące reakcje psychiczne i paradoksalne: niepokój (zwłaszcza ruchowy), rozdrażnienie, zwiększenie agresywności, majaczenia i koszmary senne, napady wściekłości, halucynacje, psychoza, niestosowne zachowanie oraz inne działania niepożądane. W przypadku wystąpienia wyżej wymienionych objawów należy przerwać stosowanie leku.

Prawdopodobieństwo wystąpienia powyższych działań niepożądanych jest większe u dzieci i osób w wieku podeszłym.

Ryzyko związane z jednoczesnym stosowaniem z opioidami

Jednoczesne stosowanie produktu leczniczego Rudotel z opioidami może powodować uspokojenie, depresję oddechową, śpiączkę i zgon. Ze względu na te zagrożenia, jednoczesne przepisywanie leków uspokajających, takich jak benzodiazepiny, lub podobnych leków, takich jak Rudotel, z opioidami powinno ograniczać się tylko do pacjentów, u których alternatywne sposoby leczenia są niewystarczające. Jeśli zostanie podjęta decyzja o przepisaniu produktu leczniczego Rudotel jednocześnie z opioidami, należy stosować najmniejszą skuteczną dawkę przez możliwie najkrótszy czas (patrz punkt 4.2 „Dawkowanie i sposób podawania”).

Należy uważnie obserwować pacjentów, czy nie występują u nich objawy podmiotowe i przedmiotowe depresji oddechowej oraz uspokojenia. Z tego względu zdecydowanie zaleca się poinformować pacjentów i ich opiekunów (w stosownych przypadkach) o występującym zagrożeniu, aby byli świadomi tych objawów (patrz punkt 4.5 "Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji").

Specjalne grupy pacjentów

Dzieci i młodzież

Bezpieczeństwo i skuteczność stosowania leku u dzieci nie zostały dotychczas dostatecznie zbadane, dlatego nie należy go stosować w tej grupie wiekowej.

Osoby w podeszłym wieku

U pacjentów w wieku podeszłym należy stosować minimalne dawki skuteczne, ze względu na ryzyko ataksji lub nadmiernego uspokojenia (patrz punkt 4.2 „Dawkowanie i sposób podawania”).

Niewydolność układu oddechowego

Zaleca się stosowanie mniejszych dawek leku u pacjentów z przewlekłą niewydolnością układu oddechowego ze względu na możliwość wystąpienia hipowentylacji.

Niewydolność wątroby

Nie zaleca się stosowania leku u pacjentów z ostrą niewydolnością wątroby, ponieważ może dojść do encefalopatii.

Niewydolność nerek

U pacjentów z niewydolnością nerek lek należy stosować bardzo ostrożnie.

Lek należy ostrożnie stosować u pacjentów z ostrą jaskrą zamkniętego kąta, chorobami płuc oraz pacjentów bardzo osłabionych i wyczerpanych.

Benzodiazepiny powinny być stosowane z ostrożnością u pacjentów wykazujących skłonność do nadużywania alkoholu, narkotyków i leków.

Zwiększone ryzyko samobójstw i zachowań samobójczych

Nie zaleca się stosowania u pacjentów z pierwotnymi objawami depresji w postaci spowolnienia psychoruchowego, z depresją dwubiegunową i u pacjentów z objawami psychiatrycznymi.

Nie zaleca się również stosowania pochodnych benzodiazepiny u pacjentów z cięższymi postaciami depresji z myślami samobójczymi. Zwłaszcza w początkowej fazie leczenia, z powodu zwiększonego ryzyka samobójstwa, konieczne jest, aby pacjent z objawami depresji przebywał pod ścisłą kontrolą lekarską.

Ważne informacje o niektórych składnikach leku Rudotel

Rudotel zawiera laktozę, nie powinien być stosowany u pacjentów z rzadko występującą dziedziczną nietolerancją galaktozy, brakiem laktazy lub zespołem złego wchłaniania glukozy-galaktozy.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Ostrożnie stosować z lekami hamującymi OUN

Pochodne benzodiazepiny podawane jednocześnie z innymi lekami działającymi na ośrodkowy układ nerwowy (barbituranami, opioidami, lekami przeciwpсихotycznymi, przeciwdepresyjnymi, lekami nasennymi, znieczulającymi, przeciwdrgawkowymi, przeciwhistaminowymi, częściowo także z lekami przeciwbólowymi) alkoholem oraz innymi substancjami wpływającymi na OUN mogą nasilać ich działanie depresyjne na ośrodkowy układ nerwowy.

Opioidy

Jednoczesne stosowanie leków uspokajających, takich jak benzodiazepiny lub podobne leki, w tym produktu leczniczego Rudotel, z opioidami zwiększa ryzyko wystąpienia uspokojenia, depresji oddechowej, śpiączki i zgonu z powodu addytywnego działania depresyjnego na ośrodkowy układ nerwowy. Dawka i czas trwania jednoczesnego stosowania powinny być ograniczone (patrz punkt 4.4).

Nie jest zalecane równoczesne stosowanie z alkoholem

Działanie uspokajające produktu nasila alkohol (patrz też punkt 4.7).

Może wystąpić nasilenie działania leków zmniejszających napięcie mięśni.

Po jednoczesnym przyjmowaniu cymetydyny, disulfiramu lub omeprazolu działanie medazepamu może być silniejsze i bardziej długotrwałe.

U osób palących może dojść do przyspieszenia wydalania medazepamu.

Teofilina w małych dawkach znosi działanie uspokajające medazepamu.

Medazepam może hamować działanie lewodopy.

W rzadkich przypadkach medazepam może hamować metabolizm fenytoiny i nasilać jej działanie.

Fenobarbital i fenytoina mogą przyspieszać metabolizm medazepamu.

Do interakcji farmakokinetycznych może dochodzić, kiedy benzodiazepiny stosowane są w skojarzeniu z lekami wpływającymi na ich metabolizm. Leki hamujące niektóre enzymy wątrobowe (w szczególności układ enzymatyczny cytochromu P450) mogą zwiększać stężenie benzodiazepin i nasilać ich działanie.

Ze względu na to, że medazepam jest wolno usuwany z organizmu należy brać możliwość wystąpienia interakcji nawet po zakończeniu jego przyjmowania.

Nie można przewidzieć rodzaju i nasilenia interakcji w przypadku jednoczesnego długotrwałego stosowania innych leków, np. leków przeciw nadciśnieniu tętniczemu o działaniu na ośrodkowy układ nerwowy, beta-adrenolityków, leków przeciwcukrzycowych, glikozydów nasercowych i doustnych leków antykoncepcyjnych. Dlatego zaleca się szczególną ostrożność w razie jednoczesnego stosowaniu tych leków i medazepamu, zwłaszcza w początkowym okresie jego przyjmowania. Przed przepisaniem medazepamu lekarz powinien wyjaśnić, czy pacjent stosuje długotrwałe inne leki.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

Stosowanie pochodnych benzodiazepiny w okresie ciąży może mieć szkodliwy wpływ na płód. Nie zaleca się stosowania produktu Rudotel w okresie ciąży i karmienia piersią. Jeśli pacjentka zajdzie w czasie leczenia w ciążę lub ją podejrzewa, powinna się natychmiast skontaktować z lekarzem.

Lek może być stosowany w ciąży jedynie w sytuacji, gdy jego zastosowanie u matki jest bezwzględnie konieczne, a stosowanie bezpieczniejszego leku alternatywnego jest niemożliwe lub przeciwwskazane.

Wydaje się, że ryzyko wystąpienia zaburzeń rozwojowych w przypadku przyjmowania dawek leczniczych we wczesnej ciąży jest małe, jednak w niektórych badaniach epidemiologicznych wykazano zwiększenie ryzyka wystąpienia rozszczepienia podniebienia.

Istnieją doniesienia o przypadkach wad wrodzonych i opóźnienia umysłowego u dzieci, które w okresie płodowym były narażone na większe dawki leku w następstwie przedawkowania lub zatrucia. W razie przyjmowania medazepamu w ciąży w dużych dawkach lub przez długi okres może dojść do zjawiska uzależnienia i wystąpienia objawów odstawienia u noworodka (nadmierna aktywność, pobudliwość, hipotensja, zaburzenie odruchu ssania itp.)

Po stosowaniu leku w okresie porodu może dojść do wystąpienia tzw. „floppy infant syndrome” (zespół dziecka wiotkiego – obniżone ciśnienie tętnicze krwi noworodka, obniżona temperatura ciała noworodka, zaburzenia oddychania i trudności w przyjmowaniu płynów).

Produkt Rudotel podawany kobiecie w końcowym okresie ciąży lub w czasie porodu w dużych dawkach może być przyczyną wystąpienia hipotermii, hipotonii lub umiarkowanych zaburzeń oddychania u noworodka.

Ponadto noworodki, których matki stosowały pochodne benzodiazepiny w końcowym okresie ciąży mogą być narażone na ryzyko uzależnienia fizycznego lub objawów odstawienia.

Karmienie piersią

Produktu nie należy stosować w okresie karmienia piersią, ponieważ medazepam i jego metabolity przenikają do mleka kobiecego. Stosunek stężeń w mleku i osoczu krwi wykazuje znaczne różnice międzyosobnicze. Niemowlęta metabolizują medazepam znacznie wolniej niż dzieci lub dorośli. W razie pilnych wskazań do stosowania leku należy przerwać karmienie piersią.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Medazepam stosowany w dawkach terapeutycznych może zaburzać szybkość reagowania na bodźce w takim stopniu, że występuje znaczne pogorszenie zdolności do uczestniczenia w ruchu drogowym lub obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu. Niewystarczająca ilość snu podczas leczenia może powodować osłabienie sprawności psychicznej. Po jednoczesnym przyjmowaniu alkoholu następuje dalsze znaczne zaburzenie zdolności prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn.

Należy zaniechać prowadzenia pojazdów, obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu i wykonywania innych niebezpiecznych czynności w okresie przyjmowania medazepamu, szczególnie w pierwszych dniach stosowania leku. Lekarz postanowi na podstawie indywidualnej reakcji i *stosowanej dawki w każdym indywidualnym przypadku, czy możliwe jest dopuszczenie danej osoby do prowadzenia pojazdów lub obsługiwanie maszyn.*

4.8 Działania niepożądane

Działania niepożądane występują zazwyczaj na początku leczenia i ustępują w miarę jego kontynuowania.

Działania niepożądane medazepamu podano poniżej z podziałem na układy i narządy, których dotyczą i z częstotliwością występowania, jeżeli była ona dostępna.

Częstość określa się następująco: bardzo często ($\geq 1/10$); często ($\geq 1/100$ do $< 1/10$); niezbyt często ($\geq 1/1000$ do $< 1/100$); rzadko ($\geq 1/10000$ do $< 1/1000$); bardzo rzadko ($\geq 1/10000$, w tym pojedyncze przypadki).

Zaburzenia serca

Rzadko: bradykardia, niedociśnienie

Zaburzenia krwi i układu chłonnego

Rzadko: agranulocytoza

Zaburzenia układu nerwowego

Często: senność, uczucie pustki w głowie, zawroty głowy, uczucie zmęczenia

Niezbyt często: ból głowy, depresja, drżenie, zmiana masy ciała, zaburzenia pamięci, niepamięć, zaburzenia koncentracji, dezorientacja, zaburzenia koordynacji, objawy wegetatywne.

Rzadko: reakcje paradoksalne, takie jak drażliwość, pobudzenie, gniew, zachowania agresywne lub wrogie, zwiększone pobudzenie psychoruchowe, nerwowość, lęk, bezsenność, omamy, skłonność do samobójstwa, skurcze mięśni. W razie wystąpienia reakcji paradoksalnych należy przerwać stosowanie leku (w porozumieniu z lekarzem).

W wielu przypadkach pacjenci wykazujący wymienione objawy przyjmowali też inne leki o działaniu ośrodkowym i (lub) występowały u nich zaburzenia psychiczne. W jednym przypadku wysunięto hipotezę, iż pacjenci z zaburzeniami osobowości typu „borderline”, zachowaniami agresywnymi w wywiadzie, nadużywaniem alkoholu lub leków, pacjenci cierpiący na zespół stresu pourazowego są najprawdopodobniej narażeni na zwiększone ryzyko wystąpienia powyższych działań niepożądanych.

Bardzo rzadko: dystonia, ataksja, osłabienie siły mięśniowej, zaburzenia motoryki, padaczka, zaburzenia mowy, objawy paranoi, depersonalizacja, zbyt silne działanie uspokajające podczas dnia.

U pacjentów z występującą wcześniej depresją może dojść do jej nasilenia.

Zaburzenia oka

Rzadko: zaburzenia widzenia (podwójne widzenie, oczopląs, nieostre widzenie), podwyższone ciśnienie wewnątrzgałkowe.

Zaburzenia układu oddechowego, klatki piersiowej i śródpiersia

Rzadko: ból w klatce piersiowej, zahamowanie czynności ośrodka oddechowego (szczególnie u pacjentów ze zwężeniem dróg oddechowych oraz u pacjentów z uszkodzeniem mózgu), skurcz głośni. Należy pamiętać o możliwości wystąpienia tego działania niepożądanego w razie jednoczesnego stosowania medazepamu z innymi lekami działającymi na ośrodkowy układ nerwowy

Zaburzenia żołądka i jelit

Rzadko: zaburzenia czynności żołądka i jelit, nudności, wymioty, bóle brzucha, zaparcia, biegunka, suchość jamy ustnej

Zaburzenia nerek i dróg moczowych

Rzadko: nietrzymanie lub zatrzymanie moczu

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej

Rzadko: skórne reakcje alergiczne (świąd, zaczerwienienie skóry, wysypka)

Zaburzenia endokrynologiczne

Rzadko: hiperprolaktynemia.

Zaburzenia metabolizmu i odżywiania

Rzadko: zwiększenie apetytu, jadłowstręt

Zaburzenia układu immunologicznego

Rzadko: reakcje alergiczne, anafilaksja

Zaburzenia wątroby i dróg żółciowych

Rzadko: zaburzenia czynnościowe wątroby, cholestaza, żółtaczka.

Zaburzenia układu rozrodczego i piersi

Rzadko: zaburzenia czynności płciowych, obniżenie libido, zaburzenia miesiączkowania i owulacji, ginekomastia, bóle piersi.

Po dłuższym lub wielokrotnym stosowaniu produktu jego działanie może być słabsze.

Podczas stosowania leku Rudotel codziennie przez kilka tygodni występuje ryzyko rozwoju uzależnienia. Dotyczy to nie tylko nieprawidłowego przyjmowania zbyt dużych dawek, lecz także stosowania dawek leczniczych.

Opisywano przypadki nadużywania benzodiazepin.

Ze względu na działanie produktu polegające na rozluźnianiu mięśni, może wystąpić, szczególnie u osób w wieku podeszłym, ryzyko upadku.

Działania niepożądane na ogół ustępują po zmniejszeniu dawki. Zazwyczaj można im zapobiec poprzez staranne indywidualne ustalanie dawki leku.

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych

Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych Al. Jerozolimskie 181C, 02-222 Warszawa, tel.: + 48 22 49 21 301, faks: + 48 22 49 21 309, e-mail: ndl@urpl.gov.pl

Działania niepożądane można zgłaszać również podmiotowi odpowiedzialnemu.

4.9 Przedawkowanie

Badając pacjenta, który przedawkował medazepam, należy brać pod uwagę możliwość przyjęcia większej liczby leków, w celu samobójstwa.

Objawy przedawkowania występują z większym nasileniem po spożyciu alkoholu lub innych środków o działaniu hamującym na ośrodkowy układ nerwowy.

Objawy przedawkowania

Do objawów niewielkiego przedawkowania należą m.in. oszołomienie, senność, ataksja, dyzartria, obniżenie ciśnienia tętniczego krwi, osłabienie mięśni.

W przypadku ciężkiego zatrucia może dojść do ośrodkowego zaburzenia czynności układu sercowo-naczyniowego i oddechowego (zasiniwienie skóry i błon śluzowych, utrata przytomności aż do zatrzymania oddychania, zatrzymanie akcji serca). W takich przypadkach konieczna jest intensywna terapia!

W okresie ustępowania objawów może wystąpić stan silnego pobudzenia.

Leczenie przedawkowania

W początkowym okresie po zatruciu należy wykonać płukanie żołądka i (lub) sprowokować wymioty oraz podać środki zmniejszające wchłanianie z przewodu pokarmowego (np. węgiel aktywowany). Oprócz kontrolowania oddychania, częstotliwości akcji serca, ciśnienia krwi i temperatury ciała należy podać dożylnie płyny oraz zastosować środki wspomagające i przygotować środki do leczenia ewentualnej niedrożności dróg oddechowych.

W przypadku hipotensji można podać leki sympatykomimetyczne.

W przypadku wystąpienia niewydolności oddechowej, wywołanej przez działanie rozluźniające mięśnie, należy stosować wspomaganie oddechu. Leki z grupy antagonistów morfiny są przeciwwskazane.

Ze względu na silne wiązanie medazepamu z białkami osocza i dużą objętość dystrybucji medazepamu i jego metabolitów, skuteczność wymuszonej diurezy lub hemodializy po zatruciu wyłącznie medazepamem jest mała.

W celu zniesienia hamującego wpływu benzodiazepin na ośrodkowy układ nerwowy można zastosować flumazenil – lek z grupy antagonistów benzodiazepin.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

Grupa farmakoterapeutyczna w kodzie ATC: N05B A03
anksjolityki, pochodne benzodiazepiny

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Mechanizm działania

Medazepam jest substancją psychotropową z grupy 1,4-benzodiazepin o silnych właściwościach łagodzenia napięcia emocjonalnego, pobudzenia i lęku oraz o działaniu sedatywnym i nasennym. Ponadto medazepam w większych dawkach zmniejsza napięcie mięśni oraz działa przeciwdrgawkowo.

Medazepam wiąże się w niewielkim stopniu ze swoistymi receptorami w ośrodkowym układzie nerwowym oraz w poszczególnych narządach obwodowych. Receptory dla benzodiazepin w ośrodkowym układzie nerwowym są ściśle czynnościowo związane z receptorami GABA-ergicznego układu przekaźników. Po związaniu się z receptorem dla benzodiazepin medazepam nasila hamujące działanie przekaźnictwa GABA-ergicznego.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Po podaniu doustnym medazepam jest szybko wchłaniany. Maksymalne stężenie leku w osoczu krwi występuje po 1 - 2 godzinach. W osoczu krwi występuje do 0,2% dawki medazepamu w postaci wolnej.

Medazepam charakteryzuje się krótkim okresem półtrwania, wynoszącym 2 godziny, jest szybko przekształcany do metabolitów.

Działanie medazepamu w znacznym stopniu jest związane z działaniem jego czynnych metabolitów. Czynnymi metabolitami medazepamu są desmetylmedazepam, diazepam, desmetylodiazepam i oksazepam. Po długotrwałym stosowaniu codziennie (5 dni, 50 mg na dobę, doustnie) następuje kumulacja desmetylodiazepamu, który staje się głównym metabolitem.

Rozkład medazepamu następuje głównie w wątrobie, przy czym powstają czynne metabolity, desmetylmedazepam, temazepam i oksazepam. Diazepam wykazuje okres półtrwania fazy eliminacji wynoszący od 20 do 100 godzin. Jest wydalany głównie przez nerki, częściowo z żółcią.

Okres półtrwania fazy eliminacji czynnego metabolitu desmetylodiazepamu wynosi około 50 - 80 godzin.

Czynny metabolit oksazepam podlega glukuronizacji w wątrobie, jest wydalany głównie przez nerki. Ostateczny okres półtrwania w osoczu krwi wynosi od 6 do 25 godzin.

Przenikanie przez łożysko i do mleka

Nie przeprowadzono badań na temat przenikania medazepamu przez łożysko. Ze względu na to, że medazepam jest metabolizowany do diazepam, desmetylodiazepam oraz oksazepam i stwierdzono przenikanie tych benzodiazepin przez łożysko, można mieć pewność, że czynne metabolity przenikają z kompartmentu matczynego do kompartmentu płodowego. Na ogół benzodiazepiny przenikają w większym stopniu przez łożysko w późnej niż we wczesnej ciąży.

Medazepam i jego czynne metabolity przenikają do mleka kobiecego.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Toksyczność ostra

Badania na temat toksyczności ostrej nie wskazują na występowanie szczególnej wrażliwości na lek. Objawy przedawkowania podano w rozdz. 4.9.

Toksyczność przewlekła

Badania na różnych gatunkach zwierząt nie wskazywały na występowanie zmian wywołanych przez medazepam.

Działanie mutagenne lub karcynogenne

W wielu badaniach na zwierzętach medazepam podawany w dawkach znacznie większych od dawek terapeutycznych stosowanych u ludzi, wykazywał działanie mutagenne.

Działanie teratogenne

Badania doświadczalne na zwierzętach wskazują na zaburzenia zachowania u potomstwa matek, którym podawano medazepam przez długi okres.

Ryzyko powstania wad wrodzonych w czasie przyjmowania dawek leczniczych benzodiazepin jest, jak się wydaje, małe, chociaż w niektórych badaniach epidemiologicznych stwierdzono zwiększenie ryzyka rozszczepu podniebienia.

Opisywano przypadki wystąpienia wad wrodzonych i opóźnienia umysłowego u dzieci, które w okresie życia płodowego były narażone na duże dawki medazepamu w następstwie przedawkowania lub zatrucia.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Laktoza jednowodna, skrobia ziemniaczana, żelatyna, talk, magnezu stearynian, żółcień pomarańczowa

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie stwierdzono.

6.3 Okres ważności

5 lat

Nie stosować leku po upływie daty ważności.

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Chronić od światła.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Opakowanie bezpośrednie: butelka ze szkła oranżowego z korkiem z polietylenu.

Opakowanie zewnętrzne: pudełko tekturowe.

Wielkość opakowania : 20 tabletek.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania

Brak specjalnych zaleceń.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Teva Pharmaceuticals Polska Sp. z o.o.
ul. Emilii Plater 53, 00-113 Warszawa

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Pozwolenie R/3068

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU I DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 05.11.1988

Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 30.07.2014

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO