

## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

### 1. Наименование на лекарствения продукт

Реладорм  
Reladorm

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-7733 / 09.02.87	
040/10.06.03n	<i>Меню</i>

### 2. Количествен и качествен състав на лекарственото вещество

Diazepam 0,01 g  
Calcium Cyclobarbital 0,10 g

### 3. Лекарствена форма

Таблетки

### 4. Клинични данни

#### 4.1. Показания

Нарушения на съня

- безсъние на фона на емоционални нарушения
- трудности при заспиване
- кратковременен, недълбок сън

#### 4.2. Дозировка и начин на приложение

Обикновено се предписват по ½ - 1 таблетка час преди лягане.

При болни с бъбречна или чернодробна недостатъчност да се редуцират дозите.

**Реладорм може да се употребява в течение само на няколко дни.**

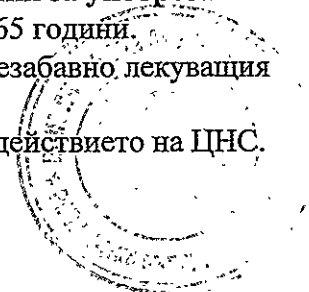
**Продължителната употреба ( в течение на седмици ) може да предизвика психическа и физическа зависимост.**

#### 4.3. Противопоказания

- свръхчувствителност към бензодиазепини или барбитурати
- нарушения на дишането с централен произход, тежки състояния на дихателна недостатъчност, независимо от причината
- нарушени функции на черния дроб и бъбреците
- порфирия
- глаукома
- миастения
- нарушено съзнание и равновесие
- бременност и кърмене
- злоупотреба с алкохол, барбитурати и бензодиазепини

#### 4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

- Не се препоръчва да се приема от деца и лица, с възраст над 65 години.
- В случай на нежелани лекарствени реакции да се уведоми незабавно лекуващия лекар.
- Да не се приема едновременно с препарати, които потискат действието на ЦНС.



#### 4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Сънотворни, наркотични обезболяващи невролептици, противоепилептични, антихистаминови лекарствени продукти усилват действието на Реладорма.

Реладорм намалява ефективността на кумариновите антикоагуланти, пероралните контрацептиви, хипогликемизиращите препарати, доксицилина, гризеофулвина.

Етиловият алкохол усилва депресивното действие на Реладорм върху ЦНС. При едновременна употреба са възможни психосоматична възбужда, агресивност, състояние на патологично опиянение, симптоми на дълбока депресия на психическите и физиологическите функции на мозъка, включително кома и нарушение на вегетативните функции.

#### 4.6. Бременност и кърмене

**Да не се прилага по време на бременност и кърмене**

#### 4.7. Влияние върху способността за шофиране и работа с машини

Реладорм може да предизвика силно нарушение на психомоторните и опознавателните функции. Възможни са нарушения на пространствената оценка – дезориентация, забавени реакции; болният може да реагира недостатъчно бързо и нецелесъобразно. **В процеса на лечение и три дни след приключването му да не се управляват превозни средства и да не се обслужват механични устройства в движение.**

#### 4.8. Нежелани лекарствени реакции

- сънливост през деня, замъглено съзнание
- чувство на умора, мускулна слабост
- нарушена концентрация на вниманието и движенията
- психическа и физическа зависимост
- световъртеж, кожни алергични реакции, хипотония
- констипация и сухота в устата

#### 4.9. Предозиране

След употреба в доза, превишаваща предписаната, могат да се появят симптоми на интоксикация: сънливост, нарушено равновесие и ориентиране. Острите отравяния могат да доведат до загуба на съзнание и кома, с едновременно потискане дихателните функции и кръвообращението.

При едновременна употреба на Реладорм с други лекарствени продукти, потискащи действието на ЦНС, са възможни отравяния, заплашващи живота. Във всеки случай на предозиране да се предизвика повръщане, да се приеме активен въглен (ако болният е в съзнание) и да се извика бърза помощ. Специфичен антидот е флумазенила на ниво бензодиазепинови рецептори...

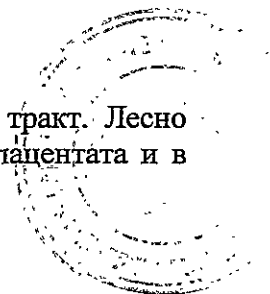
### 5. Фармакологични свойства

АТС: N 05 SA 00

#### 5.1. Фармакокинетични свойства

##### Cyclobarbital

След перорална употреба бързо се резорбира от стомашночревния тракт. Лесно прониква в тъканите и течностите на организма. Премахва през плацентата и в майчиното мляко.



Биотрансформацията на циклобарбитала от микрозомните ферменти се извършва в черния дроб. В резултат на хидроксилиране се образуват хидрофилни, неактивни метаболити.

Циклобарбитал е силен индуктор на микрозомните ферменти, отговарящи за метаболизма на много лекарствени продукти, в това число и за собствения (автоиндуктор). Като резултат се съкращава времето на действие на едновременно прилаганите лекарствени продукти, които се подлагат на биотрансформация от цитохром Р-450 (парацетамол, стероиди).

Циклобарбитал се отделя почти напълно във вид на метаболити чрез бъбреците.

#### **Diazepam**

След перорална употреба лесно се резорбира от стомашночревния тракт. Лесно преминава бариерата кръв-гръбначномозъчна течност. Висока концентрация достига в кората на мозъка, малкия, средния и главния мозък. Диазепам притежава изразена липофилност – натрупва се в мастната тъкан и постепенно се освобождава в кръвта. Този ефект, а също и образуването на активни метаболити, определят продължителността на действието и относително дългия период на полуотделяне в серума.

Диазепам преминава плацентата. Отделя се и в майчиното мляко.

Диазепам е подложен в черния дроб на действието на микрозомните ферменти. В резултат на деметилиране и хидроксилиране се образуват активни метаболити на диазепам, в това число, крайния активен метаболит – оксазепам. Оксазепам притежава собствена биологична активност, която се проявява с по-избирателно противотревно действие.

Диазепам се отделя предимно чрез бъбреците, във вид на метаболити, след конюгация с глюкуроновата киселина.

Едновременната употреба на циклобарбитал и диазепам в Реладорм не влияе върху резорбцията и биодостъпността на двата компонента, само незначително променя коефициента на разпределение на циклобарбитала. Освен това, диазепам измества циклобарбитала от съединенията с кръвните белтъци, увеличава концентрацията на свободния циклобарбитал в серума, което усилва неговото биологично действие.

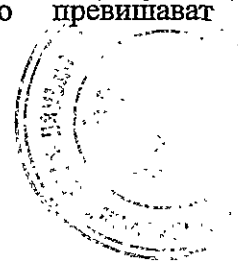
Циклобарбитал потиска биотрансформацията на диазепам чрез блокиране на метаболизма му на етап окисление (общ метаболитен път на двата компонента). 10-кратната концентрация на циклобарбитал пречатства достъпа на диазепам до цитохром Р-450. Това води до намаляване елиминацията на диазепам и осигурява висока концентрация на диазепам в кръвта. В резултат се увеличава свободната, активна фракция на двата компонента.

## **5.2. Фармакодинамични свойства**

### **Cyclobarbital**

Циклобарбитал е производно на барбитуровата киселина със средна продължителност на действие. Упражнява седативен ефект главно върху ЦНС, преди всичко на подкоровата област - хипоталамус, лимбическата структура, някои вегетативни центрове и върху кората на мозъка. Барбитуратите в неголеми дози повлияват световъртежа и действат успокоително, а в по-големи дози - сънотворно и антиепилептично. Големите дози предизвикват хирургична наркоза.

Периферно барбитуратите оказват слабо спазмолитично действие върху гладките мускули, намаляват напрежението на скелетните мускули (курароподобно действие), след използването на дози, които значително превишават предизвикващите успокоителен и сънотворен ефект.



За успокоителното действие основно е влиянието на лимбическата система, а за сънотворния ефект е отговорно сетевидното образувание на мозъка. Барбитуратите силно потискат системата, активизираща мозъчния ствол, повишават прага на неговата възбудимост. Това блокира стимулиращото му влияние върху кората на мозъка и предизвиква сън.

Механизмът на действие на барбитуратите до голяма степен произтича от влиянието върху рецепторния комплекс, съдържащ хлоридния канал. Това действие, в противоположност на бензодиазепините, е неспецифично (отсъстват рецептори). Барбитуратите влияят непосредствено на хлоридния канал, действат независимо от ГАМК, даже в тези случаи, когато хлоридния канал максимално се активира от ГАМК. В резултат се появява повишена активност на лекарствения продукт при увеличаваща се доза, което може да доведе до сериозни токсични усложнения.

### **Diazepam**

Диазепам принадлежи към бензодиазепиновите производни. Действа на много от структурите на ЦНС, преди всичко на лимбическата система и подкорияето. Както всички бензодиазепини и той усилва потискащия ефект върху ГАМК-ергическите неврони в кората на главния мозък, хипокампа, малкия мозък, гръбначния мозък и др. В ЦНС са открити специфични за бензодиазепина точки на присъединяване, явяващи се белтъчни мембранни структури имащи връзка с комплекси, състоящи се от ГАМК-А рецептор и хлориден канал. Действието на диазепам се основава на модулацията на чувствителността на ГАМК-ергическия рецептор, което довежда до повишаване подобие на този рецептор с гама-аминомаслената киселина (ГАМК), която се явява потискащ ендогенен невромедиатор. Вследствие активацията на бензодиазепановия рецептор или рецептора ГАМК-А се повишава преминаването на хлорните йони в неврона през хлоридния канал. Това води до хиперполяризация на мембраните, което предизвиква потискане функцията на невроните в много мозъчни структури.

Клинично, действието на диазепам се състои в противоспазматичен, успокоително-сънотворен, противотревожен и отпускателен скелетните мускули ефекти.

Фармакологичните свойства на Реладорм се основават на синергичното действие на циклобарбитала и диазепам върху комплекса рецептори ГАМК/бензодиазепини. В резултат на сумираното фармакологично действие на двата компонента (хиперполяризация на невроните), а също и на фармакокинетическите взаимодействия между тях, се увеличава депресивното им влияние върху функциите на ЦНС, в резултат се съкращава времето за заспиване, увеличава се продължителността на съня, като едновременно с това той става по-дълбок, отколкото при употреба само на една от съставките.

При болни с нарушен сън, действието на Реладорм е около 2 пъти по-силно, отколкото това на циклобарбитала и диазепам поотделно, приети в дозите, в които са в продукта.

Реладорм предизвиква сън с продължителност 7-8 часа.

### **5.3. Предклинични данни за безопасност**

**LD<sub>50</sub>** при перорален прием на циклобарбитал за мишки е 330,3 mg/ kg. Изследванията върху животни са показали, че барбитуратите давани на мишки и плъхове продължително време в големи дози предизвикват появата на новообразувания. В черния дроб при мишки са наблюдавани доброкачествени или злокачествени тумори, а към края на живота при плъхове- доброкачествени.

При бременни жени барбитуратите предизвикват нарушения в плода.

**LD<sub>50</sub>** на диазепам при мишките е 720 mg/kg, а при плъховете – 1240mg/kg.

Установено е, че доза 100 mg/kg перорално, повишава смъртността при бременните женски и при новородените. Увреждане на плода е наблюдавано само в няколко случая. При употреба на диазепам в дози, непревишаващи 100 mg/kg, не е установено увеличаване смъртността при новородените плъхове. Диазепам, приеман от бременни плъхове в дози, непревишаващи 80 mg/kg в денонощие, не е проявявал тератогенно действие.

## 6. Фармацевтични данни

### 6.1.Списък на помощните вещества и техните количества

mg/tbl

Potato starch	22.80 mg
Talc	13.00 mg
Gelatin	4.20 mg
Sodium starch glycolate	2.00 mg
Lactose до	170.00 mg

Purified water-отстранява се по време на производство

### 6.2. Несъвместимости

В периода на лечение с Реладорм и три дни след приключването му, да не се приема алкохол.

### 6.3. Срок на годност

3 години

### 6.4.Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 25 ° C.

Да се съхранява на място, защитено от светлина и влага.

Да се съхранява на място, недостъпно за деца

### 6.5. Данни за опаковката

Двуслойна лента с 10 таблетки в картонена кутия с всички необходими означения и информационна листовка.

### 6.6. Препоръки при употреба

Да се прилага само по лекарско предписание.

## 7. Име и адрес на производителя и притежателя на регистрацията

Tarchomin Pharmaceutical Works "Polfa" S.A.

2 Fleminga str.,

03-176 Warsaw

Poland

## 8. Регистрационен N°

## 9. Дата на първо разрешение за употреба

## 10. Дата на актуализация на текста

Януари, 2003

