

Ally

## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

### 1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Myolastan®  
Миоластан

### 2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Една таблетка съдържа tetrazepam 50.00 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) на 2 или 3 приема, като 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.

#### При пациенти в напреднала възраст:

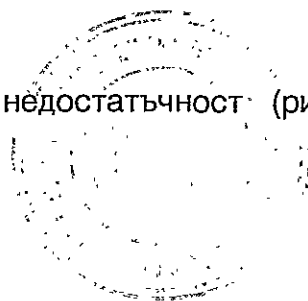
Препоръчително е да се прилагат по-ниски дози (половината от ефективната доза обикновено е достатъчна).

#### 4.3 Противопоказания

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

- Известна алергия към активното вещество или към някое от помощните вещества,
- Тежка дихателна недостатъчност,
- апнея по време на сън (sleep apnea),
- остра или хронична тежка чернодробна недостатъчност (риск от енцефалопатия),
- миастения.

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № И-11494/04.10.05	
681/13.09.05	<i>Менел</i>



#### 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 и подобни субстанции може да доведе до развитие на физическа и психическа зависимост, особено при по-продължителна употреба.

Някои фактори повлияват появата на зависимост:

- продължителност на лечението,
- дозировка,
- анамнеза за наличието на различни типове зависимости, лекарствена или друга зависимост, включително и към алкохол.

Лекарствена зависимост може да се развие и при терапевтични дози и/или при пациенти без индивидуални рискови фактори.

Прекъсване на лечението може да доведе до т.н. синдром на отнемането.

Някои от симптомите са стандартни: безсъние, главоболие, изразено безпокойство, мигалгия, повишен мускулен тонус, раздразнителност.

Други се срещат по-рядко: тревожност и дори епизоди на объркване, парестезия на крайниците, свръхчувствителност към светлина, шум или физически контакт, деперсонализация, загуба на чувство за реалност, халюцинации, епилептични припадъци.

Синдрома на отнемането се появява няколко дни след прекъсване на лечението. За бензодиазепини с кратко действие и особено ако се употребяват във високи дози, симптомите могат да се появят дори и през отделните интервали на два приема.

Независимо от индикацията, едновременната употреба на няколко бензодиазепини може да увеличи риска от лекарствена зависимост.

###### **„REBOUND“ ФЕНОМЕН**

Този преходен синдром може да влоши симптомите, характерни при лечение с бензодиазепини и сходни субстанции.

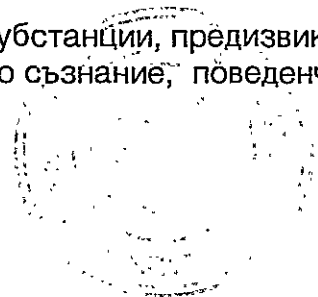
###### **АМНЕЗИЯ И НАРУШЕНА ПСИХОМОТОРНА ФУНКЦИЯ**

Антероградна амнезия и промени в психомоторните функции могат да се появят няколко часа след приема.

###### **ПОВЕДЕНЧЕСКИ НАРУШЕНИЯ**

При някои пациенти бензодиазепините и сходни субстанции, предизвикват в различна степен комбинирани прояви на нарушено съзнание, поведенчески нарушения и нарушения на паметта.

Наблюдават се следните прояви:



- засилване на безсънието, кошмари, възбудимост, нервност,
- бълнуване, халюцинации, объркване, онеироиден синдром, психотични симптоми,
- импулсивност,
- еуфория, раздразнителност,
- антероградна амнезия,
- податливост към внушения.

Тези прояви, придружени от следните нарушения са опасни за пациентите, и те са:

- необичайни нарушения в поведението на пациента,
- агресивност към себе си и околните, особено при забрана за извършване на някаква дейност,
- начин на поведение, последвано от амнезия.

При наличието на тези симптоми, лечението се преустановява.

### *АКУМУЛАЦИОНЕН РИСК*

Бензодиазепините и сходни субстанции (подобно на всички лекарствени продукти) остават в човешкото тяло за период от около пет „полу-живота“ (виж т.5.2).

При пациенти в напреднала възраст или пациенти с бъбречна или чернодробна недостатъчност, времето за елиминационен полуживот може да е значително по-дълго. При повторна употреба, лекарственият продукт и неговите метаболити достигат плазмена „steady-state“ концентрация много по-бавно и с много по-високи нива. Оценяването на ефикасността и безопасността на лекарственият продукт е възможно само при достигане на „steady-state“ плазмена концентрация. При необходимост дозата се коригира (виж т. 4.2).

### *ПАЦИЕНТИ В НАПРЕДНАЛА ВЪЗРАСТ*

Особено внимание се изисква при предписването на бензодиазепини и сходни субстанции при пациенти в напреднала възраст поради риск от седация и/или отслабване на мускулите, водещи до наранявания със сериозни последици.

### Специални предпазни мерки при употреба

Специално внимание се препоръчва при наличие на алкохолизъм или други видове зависимости (виж т.4.5).

### *ПАЦИЕНТИ С ГОЛЯМ ДЕПРЕСИВЕН СИНДРОМ*

Бензодиазепините или сходни субстанции не трябва да се предписват самостоятелно за лечение на депресия, тъй като дават възможност за развитие или увеличаване на риска от суицидални прояви.

### *МЕТОДИ ЗА ПОСТЕПЕННО СПИРАНЕ НА ЛЕЧЕНИЕТО*

Обяснява се много внимателно на пациента.

Пациентът трябва да бъде предупреден за постепенно спиране на лечението поради риск от развитието на „rebound феномен“, както и от появата на раздразнителност. Пациентът се предупреждава за трудностите през тази фаза.

## ДЕЦА

Поради липсата на достатъчно клинични данни за безопасната му употреба при деца, този лекарствен продукт се прилага само за възрастни.

## ПАЦИЕНТИ В НАПРЕДНАЛА ВЪЗРАСТ, ПАЦИЕНТИ С БЪБРЕЧНА ИЛИ ЧЕРНОДРОБНА НЕДОСТАТЪЧНОСТ

Дозировката се намалява наполовина поради риск от акумулация (виж т. 4.4).

## ДИХАТЕЛНА НЕДОСТАТЪЧНОСТ

При пациенти с дихателна недостатъчност, подтискащия ефект на бензодиазепините и сходни субстанции трябва да се вземат предвид (особено появата на безпокойство и възбудимост, които са признаци за дихателна недостатъчност, изискваща хоспитализация на пациента в интензивно отделение).

## 4.5 Лекарствени и други форми взаимодействия

### 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 противокашлечни и други заместителни терапии, с изключение на buprenorphine), невролептици, барбитурати, други анксиолитици, хипнотици, седативни антидепресанти, N1 антихистаминови препарати, антихипертензивни препарати, баклофен, талидомид.

Засилването на депресията може да има сериозни последици, особено за управляващите превозни средства или машини поради нарушена бдителност.

Производните на морфина (аналгетици, подтискащи кашлицата лекарствени продукти, и други заместителни терапии), барбитурати увеличават риска от подтискане на дихателните функции, което може да е фатално при предозиране.

#### **+ Buprenorphine**

Увеличен риск от подтискане на дихателните функции, което може да има фатален изход.

Внимателна оценка на съотношението риск/полза при тази комбинация. Информирайте пациента да спазва предписанието внимателно.

## **4.6 Бременност и кърмене**

### Бременност

При хора, тератогенният риск, ако съществува е изключително нисък. При някои бензодиазепини тератогенния ефект е възможен, но не 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 управляване на превозни средства и при работа с машини поради сънливост. Да не се комбинира с други седативни лекарствени продукти по време на шофиране и работа с машини.

#### **4.8 Нежелани лекарствени реакции**

Свързани са с приеманата доза и индивидуалната чувствителност на пациента:

**Неврологични и психиатрични нежелани лекарствени реакции (виж т.4.4):**

- антероградна амнезия, която се появява при терапевтични дози, като рискът нараства пропорционално с дозата,
- поведенчески нарушения, замъглено съзнание, раздразнителност, агресивност,
- възбуда, физическа и психическа зависимост, дори и при терапевтични дози; могат да се наблюдават синдром на отнемането и „rebound“ феномен след прекъсване на лечението,
- чувство на замаяност, главоболие, атаксия,
- объркване, нарушена бдителност, или дори сънливост (по-специално при възрастни пациенти), безсъние, кошмари, напрежение,
- промени в либидото.

#### **Кожни реакции**

- Алергични реакции, като еритема, сърбеж, обрив, оток на Квинке,
- Редки случаи на еритема мултиформе,
- Много редки случаи на синдром на Steven Johnson и Lyell's. Тези реакции се появяват след комбинирането на лекарствени продукти, причиняващи такива реакции.

#### **Общи нежелани лекарствени реакции**

- мускулна хипотония, астения.

#### **Очни реакции**

- диплопия

#### **4.9 Предозиране**

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 предозирание е подтискане на централната нерва система, сънливост, понякога до кома в зависимост от приетото количество.

Признаците при леките случаи на предозирание са объркване и летаргия.

По-сериозните случаи се характеризират с атаксия, хипотония, подтискане на дихателната функция, в изключителни случаи и смърт.

При перорално предозирание и ако пациентът е в съзнание в следващия един час се провокира повръщане. В противен случай се прави промивка на стомаха, като се предпазват дихателните пътища.

Извън този период, се прилага активен въглен за намаляване на абсорбцията.

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

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

Флумазенил антагонизма на бензодиазепините може да провокира развитието на неврологични нарушения (конвулсии), особено при епилептици.

## **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).

Времето на 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, чийто 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**

#### Core:

Microcrystalline cellulose	113.00 mg
Pregelatinised starch	30.00 mg
Magnesium stearate	2.00 mg
Copovidone	5.00 mg

*За една необвита таблетка с тегло 200.00 mg*

#### Coating:

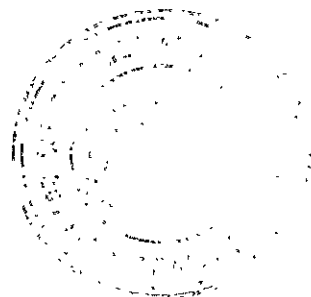
Hydroxypropylmethylcellulose	0.935 mg appr.
Talc	0.390 mg appr.
Titanium dioxide	0.430 mg appr.
Triacetin	0.245 mg appr.

### **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°C, 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 – SYNTHELABO FRANCE

174, AVENUE DE FRANCE

PARIS, FRANCE

**8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР**

20000339

**9. ДАТА НА ПОСЛЕДНА РЕДАКЦИЯ НА ТЕКСТА**

Февруари 2005

