

## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

**Lexotan**  
**Лексотан**

### 1. ТЪРГОВСКО НАИМЕНОВАНИЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Lexotan таблетки 3 mg.

### 2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа 3 mg bromazepam.

### 3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетки.

Розови, цилиндрични таблетки с надпис Roche 3.

### 4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

#### 4.1. Терапевтични показания

За краткотрайно лечение на интензивна тревожност.

#### 4.2. Дозировка и начин на приложение

##### *Тревожност*

Лечението трябва да бъде колкото е възможно по-кратко. Общата продължителност на лечение обикновено не трябва да бъде повече от 8-12 седмици, включително процеса на намаляване на дозата.

Пациентът трябва да се проверява редовно в началото на лечението, за да се намали до минимум дозировката и/или честотата на приложение за предотвратяване на предозиране, дължащо се на кумулиране.

Тези количества са общи препоръки и дозировката трябва да бъде определена индивидуално. Лечението на амбулаторните пациенти трябва да започне с ниски дози, като те постепенно се покачват до оптимално ниво. Състоянието на пациента трябва да се подлага редовно на преоценка, като трябва да се оценява нуждата от продължаване на лечението, особено когато пациентът няма симптоми.

В някои случаи може да се наложи продължаване на терапията отвъд максималния период за лечение. В такъв случай това не трябва да става без преоценка на състоянието на болния след специален преглед.

##### *Възрастни*

Трябва да се прилага най-ниската доза, с която може да се контролират симптомите.

|                                                             |             |
|-------------------------------------------------------------|-------------|
| МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВООПАЗВАНЕТО                            |             |
| Приложение към<br>разрешение за употреба № 11-7705/30.06.03 |             |
| 639/27.05.03                                                | <i>Меню</i> |



Оптималната дозировка и честота на приложение на Lexotan трябва да се определят индивидуално при всеки пациент, в зависимост тежестта на симптомите и анамнезата за предишно прилагане на психотропни лекарства.

Обичайната доза в общата практика е от 3 до 18 mg дневно в разделени приеми.

В изключителни случаи, при хоспитализирани болни, може да се приложи доза до 60 mg дневно, разделена на няколко приема.

Лечението трябва винаги да се прекъсва постепенно. Пациентите, които са приемали бензодиазепини продължително време, може да имат нужда от по-дълъг период на намаляване на дозата. Може да бъде подходящо използването на специална помощ.

#### ***Пациенти в напреднала възраст и/или изтощени болни***

Пациентите в напреднала възраст изискват по-ниски дози поради индивидуалните вариации в чувствителността и фармакокинетиката. Дозите не трябва да надвишават половината от обичайно препоръчваната доза (виж раздел 5.2. *Фармакокинетика при специални популации*).

Пациентите с увредена чернодробна и/или бъбречна функция изискват по-ниски дози поради индивидуалните вариации в чувствителността и фармакокинетиката.

При пациентите в напреднала възраст и болните с увредена бъбречна и/или чернодробна функция е препоръчително да се преоценява лечението редовно и да се преустанови колкото е възможно по-рано.

#### ***Деца***

Lexotan не е предназначен за приложение при деца под 12-годишна възраст.

### **4.3 Противопоказания**

#### ***Myasthenia gravis***

Свръхчувствителност към бензодиазепини

Тежка дихателна недостатъчност

Тежка чернодробна недостатъчност (бензодиазепините не са показани за лечение на пациенти с тежка чернодробна недостатъчност, тъй като те могат да предизвикат енцефалопатия).

### **4.4 Специални предпазни мерки**

#### ***Толерантност***

След многократна употреба в продължение на няколко седмици може да се развие известна загуба на ефективността на бензодиазепините.

#### ***Зависимост***

Употребата на бензодиазепини може да доведе до развитие на физическа и психическа зависимост към тези продукти (виж раздел 4.8. *Нежелани ефекти*). Рискът от зависимост се увеличава с дозата и продължителността на лечението. Той е по-голям при пациенти с анамнеза за злоупотреба с алкохол и лекарства.



След като веднъж е развита физическа зависимост, внезапното прекратяване на лечението ще се придружава със симптоми на отнемане. Те може да се състоят в главоболие, мускулна болка, крайна тревожност, напрежение, безпокойство, объркване и раздразнителност. В тежки случаи може да се наблюдават следните симптоми: дереализация, деперсонализация, хиперакузис, изтръпване и мравучкане на крайниците, свръхчувствителност към светлина, шум и физически контакт, халюцинации или епилептични гърчове (виж раздел 4.8. *Нежелани ефекти*).

*Rebound безсъние и тревожност:* При прекратяване на лечението може да се наблюдава преходен синдром, при който симптомите, довели до лечението с бензодиазепина, се появяват отново в по-изразена форма. Той може да се придружава от други реакции, включващи промени в настроението, тревожност или нарушение на съня и безпокойство. Тъй като рискът от явления на отнемане/rebound явления е по-голям след внезапно прекъсване на лечението, препоръчва се дозата да се намалява постепенно.

### **Продължителност на лечение**

Продължителността на лечение трябва да е колкото е възможно по-кратка (виж раздел 4.2. *Дозировка и метод на приложение*). Общата продължителност на лечение обикновено не трябва да бъде повече от 8-12 седмици, включително процеса на намаляване на дозата. Този период не трябва да се удължава, без да се преоцени положението.

Може да е полезно в началото на лечението да се уведоми пациента, че продължителността му ще бъде ограничена и да се обясни точно как дозата ще се намалява постепенно. Освен това е важно пациентът да знае за възможността от възникване на rebound явления, като по този начин ще се намали тревогата при поява на такива симптоми след прекъсване на лечението с лекарствения продукт.

Има данни, че при бензодиазепини с кратка продължителност на действието явленията на отнемане може да се манифестират в интервала между дозите, особено когато дозата е висока. Когато се използват бензодиазепини с продължително действие, важно е да се предупреди пациента да не преминава към лечение с бензодиазепин с кратко действие, тъй като може да се развият симптоми на отнемане.

### **Амнезия**

Бензодиазепините може да индуцират антероградна амнезия. Антероградна амнезия може да се появи при високи терапевтични дози (съобщена е при 6 мг), като рискът се увеличава с по-високите дози. Ефектите на амнезия може да се съпровождат с неподходящо поведение. Това състояние се наблюдава по-често няколко часа след приема на продукта и поради това, за да намалят риска, пациентите трябва да си осигурят 7-8 часа непрекъснат сън (виж раздел 4.8. *Нежелани ефекти*).

### **Психични и "парадоксални" реакции**

Известно е, че при употреба на бензодиазепини може да възникнат реакции като безпокойство, ажитация, раздразнителност, налудности, гняв, кошмари.



халюцинации, психози, неподходящо поведение и други нежелани поведенчески ефекти. Ако това стане, употребата на лекарството трябва да се преустанови.

По-вероятно е те да възникнат при деца и пациенти в напреднала възраст.

#### ***Специфични групи пациенти***

Бензодиазепините не трябва да се прилагат при деца без внимателна преценка на необходимостта от това. Продължителността на лечението трябва да бъде минимална. На пациентите в напреднала възраст трябва да се дава намалена доза (виж раздел 4.2. *Дозировка и метод на приложение*). По-ниска доза се препоръчва и при пациенти с хронична белодробна недостатъчност поради риск от респираторна депресия. Бензодиазепините не са показани за лечение на пациенти с тежка чернодробна недостатъчност, тъй като те може да предизвикат енцефалопатия.

Бензодиазепините не се препоръчват за първично лечение на психотични заболявания.

Бензодиазепините не трябва да се прилагат самостоятелно за лечение на депресия или тревожност, свързана с депресия (при такива пациенти може да отключат суицидни намерения). Пациенти с известна или предполагаема зависимост от алкохол или лекарства не трябва да вземат бензодиазепини, с изключение при редки ситуации под лекарски контрол.

#### **4.5 Взаимодействие с други лекарства и други форми на взаимодействие**

##### ***Не препоръчителни:***

##### ***Едновременна употреба на алкохол.***

Седативните ефекти може да се засилят, когато продуктът се употребява в комбинация с алкохол. Това може да засегне способността да се шофира и да се работи с машини.

##### ***Взаимодействия, които трябва да се имат предвид:***

##### ***Комбинация с депресанти на ЦНС***

При едновременна употреба с антипсихотици (невролептици), хипнотици, анксиолитици/седативни средства, антидепресанти, наркотични аналгетици, антиепилептични средства, анестетици и седативни антихистамини може да се наблюдава засилване на централния подтискащ ефект.

При наркотичните аналгетици може да се наблюдава и засилване на еуфорията, което да доведе до увеличаване на физическата зависимост.

Съединения, които инхибират чернодробните ензими (особено цитохром P450), може да засилят активността на тези бензодиазепини, които се метаболизират от тези ензими. В по-малка степен това се отнася и до бензодиазепините, които се метаболизират само чрез конюгация.

Едновременното приложение на циметидин може да удължи времето на полуелиминиране на бромазепам.



#### 4.6 Бременност и кърмене

Бензодиазепините трябва да се прилагат по време на бременност или кърмене само ако лекарят счита това за важно. Проучванията на бензодиазепините върху животни са показали малки ефекти върху плода, а няколко изследвания съобщават за късни поведенчески нарушения на потомството, изложено *in utero*.

Когато лекарството се предписва на жена във фертилна възраст, тя трябва да бъде предупредена да се свърже с лекаря относно прекъсване на лечението, ако възнамерява да забременее или се съмнява, че е бременна.

Ако по наложителни медицински причини лекарството се приложи в късната фаза на бременността или по време на раждане, може да се очакват ефекти върху новороденото като хипотермия, хипотония и умерено потискане на дишането, дължащи се на фармакологичното действие на съединението.

Освен това новородени от майки, приемали продължително бензодиазепини през по-късните стадии на бременността, могат да развият физическа зависимост и могат да бъдат подложени на риск от развитие на симптоми на отнемане в постнаталния период.

Тъй като бензодиазепините се откриват в кърмата, те не трябва да се дават на кърмачки.

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

Седацията, амнезията, влошената концентрация и влошената мускулна функция може да се отразят неблагоприятно на способността за шофиране или работа с машини. При недостатъчна продължителност на съня вероятността от влошена бдителност може да се увеличи (виж раздел 4.5. *Взаимодействия с други лекарства и други форми на взаимодействие*). Освен това пациентите трябва да знаят, че алкохолът може да увеличи степента на увреждане и поради това по време на лечението трябва да се избягва.

#### 4.8 Нежелани лекарствени реакции

Сънливост (когато продуктът се прилага като сънотворно, трябва ясно да се каже сънливост през деня), притъпени емоции, намалена бдителност, объркване, умора, главоболие, замайване, мускулна слабост, атаксия или двойно виждане. Тези явления се появяват предимно в началото на лечението и обикновено изчезват при многократно приложение.

Понякога се съобщават други нежелани ефекти като стомашно-чревни нарушения, промени в либидото или кожни реакции.

##### *Амнезия*

Антероградна амнезия може да се наблюдава при терапевтични дози, като рискът се увеличава при по-високите дози. Ефектите на амнезия може да се съпровождат с неподходящо поведение (виж раздел 4.4. *Предупреждения и специални предпазни мерки при употреба*).



## **Депресия**

Налична депресия може да се разкрие по време на употреба на бензодиазепини.

## **Психични и “парадоксални” реакции**

Известно е, че при употреба на бензодиазепини или бензодиазепин-подобни лекарства, може да възникнат реакции като безпокойство, ажитация, раздразнителност, агресивност, налудности, гняв, кошмари, халюцинации, психози, неподходящо поведение и други нежелани поведенчески ефекти. (виж раздел 4.4. *Специални предупреждения и специални предпазни мерки при употреба*). Ако това стане, употребата на лекарството трябва да се преустанови. По-вероятно е те да възникнат при деца и пациенти в напреднала възраст, отколкото при другите пациенти.

## **Зависимост**

Употребата (дори в терапевтични дози) може да доведе до развитие на физическа зависимост. Преустановяването на лечението може да предизвика явления на отнемане или rebound явления. (виж раздел 4.4. *Специални предупреждения и специални предпазни мерки при употреба*). Може да възникне психическа зависимост. Има съобщения за злоупотреба с бензодиазепини.

## **4.9 Предозиране**

Както при другите бензодиазепини, предозирането не би трябвало да представлява опасност за живота, освен ако лекарството не е комбинирано с други депресанти на ЦНС (включително алкохол).

При лечението на предозиране с всеки лекарствен продукт, трябва да се има предвид, че може да са използвани множество лекарства.

След предозиране на всеки лекарствен продукт трябва да се предизвика повръщане (до един час), ако пациентът е в съзнание или да се направи стомашна промивка със защита на дихателните пътища, ако болният е в безсъзнание. Ако няма полза от изпразването на стомаха, трябва да се даде активиран въглен за намаляване на резорбцията. Специално внимание трябва да се отдели в интензивно отделение на дихателната и сърдечно-съдовата функция.

Предозирането на бензодиазепините обикновено се проявява с подтискане на централната нервна система, вариращо от сънливост до кома. В леките случаи симптомите включват сънливост, психическо объркване и летаргия. В повечето случаи е достатъчно да се проследяват жизнените функции и да се изчака възстановяването. По-високите дози, особено в комбинация с други лекарства с централно действие, може да предизвикат атаксия, хипотония, хипотензия, респираторна депресия, рядко кома и много рядко – смърт.

Flumazenil може да бъде от полза като антидот. Пациентите, които се нуждаят от такава интервенция, трябва да се наблюдават внимателно в болница (виж отделна информация за предписване). Приложението на flumazenil не се препоръчва при пациенти с епилепсия, които са били лекувани с бензодиазепини. Антагонизмът при такива болни може да предизвика гърчове.



## 5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

### 5.1 Фармакодинамични свойства

Бромазепам е пиридилбензодиазепиново съединение с анксиолитични свойства.

### 5.2 Фармакокинетични свойства

#### *Резорбция*

Lexotanil се абсорбира бързо в стомашно-чревния тракт. Максимални плазмени концентрации обикновено се достигат след 2 часа след перорално приложение на бромазепам. Абсолютната (срещу венозен разтвор) и относителната (срещу перорален разтвор) бионаличност на таблетката е 60% и 100% съответно.

#### *Разпределение*

Средно 70% от бромазепам се свързва с плазмените протеини. Обемът на разпределение е 50 литра. Равновесните плазмени концентрации се достигат след около 5-9 дни.

#### *Метаболизъм*

Бромазепам се метаболизира в черния дроб. Количествено преобладават два метаболита: 3-hydroxy-bromazepam и 2-(2-amino-5-bromo-3-hydroxybenzoyl) pyridine. Метаболитите на Lexotanil не допринасят значимо за ефектите на лекарството.

#### *Елиминиране*

Отделянето в урината на интактен бромазепам и глюкуронови конюгати на 3-hydroxy-bromazepam и 2-(2-amino-5-bromo-3-hydroxybenzoyl) pyridine е 2%, 27% и 40% от приложената доза. Бромазепам има време на полуелиминиране от около 20 часа (между приблизително 16 и 30 часа). Клирънсът е 40 ml/min.

#### *Фармакокинетика при специални популации*

Времето на полуелиминиране може да бъде удължено при пациенти в напреднала възраст (виж раздел 4.2. *Дозировка и метод на приложение*).

### 5.3 Предклинични данни за безопасност

Няма допълнителна информация от предклиничните изследвания, които биха могли да имат значение за предписването на лекарството, и които не са били включени в другите раздели на кратката характеристика на продукта.

## 6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

### 6.1 Списък на помощните вещества

Microcrystalline cellulose, lactose, magnesium stearate, Erythrosine aluminium lake (E127)

### 6.2 Несъвместимости



Не са известни.

### **6.3. Срок на годност**

*PVC блистерни опаковки:* 5 години

### **6.4 Специални предпазни мерки при съхранение**

Да не се съхранява при температура над 25°C. Да се съхранява в добре затворена опаковка на сухо място, защитен от светлина.

### **6.5 Вид и съдържание на първичната опаковка**

PVC блистерни опаковки от 30 таблетки.

### **6.6 Инструкции за употреба / работа с продукта**

Няма специални изисквания.

## **7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА ПРОИЗВОДИТЕЛ**

F. Hoffmann – La Roche Ltd., Basel, Switzerland  
Балканфарма – Дупница АД, ул. “ Самоковско шосе “ 3, 2600 Дупница –  
България.

## **8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР**

РА 50/49/2

## **9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТРЕБА / ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

31 октомври, 1980 г. / 31 октомври, 2000 г.

## **10. ДАТА НА (ЧАСТИЧНА) КОРЕКЦИЯ НА ТЕКСТА**

м. февруари, 2001 г.

Lexotan е запазена търговска марка.

