

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА**1. Име на лекарственото средство**

Дормикум®

Dormicum®

2. Количествен и качествен съставАктивна съставка:

Една таблетка Dormicum® съдържа като фармацевтично активна съставка midazolam maleate, еквивалент на 7,5 mg midazolam.

Помощни вещества:

Lactose (anhydrous) - 92.6mg;

Microcrystalline cellulose - 70.3mg;

Pregelatinized starch - 25.0mg;

Magnesium stearate - 1.9mg;

Methylhydroxypropylcellulose - 2.5mg;

Talc - 1.25mg;

Titanium dioxide - 1.25mg;

3. Лекарствена форма

Таблетки за перорално приложение в опаковки от 10бр, 30бр и 100бр само за болнична употреба.

4. Клинични данни**4.1 Показания**

Краткотрайно лечение на безсъние.

Седиране при премедикация преди хирургични или диагностични процедури.



4.2. Дозировка и начин на приложение

4.2.1 Дозировка

Лечението трябва да бъде колкото е възможно по-кратко. Обикновено продължителността на лечението варира от няколко дни до максимум две седмици. Дозировката трябва да се адаптира съобразно индивидуалните нужди. В някои случаи може да се наложи удължаване, надхвърлящо границите на максималното времетраене на лечението; в такива случаи пациентът отново трябва да се прегледа. Поради бързото начало на действие, Dozmicum таблетки трябва да се приемат непосредствено преди лягане, като таблетките се поглъщат цели с течност.

Стандартна дозировка

Възрастни: Дозировка в границите: 7,5-15 mg.

При възрастни и увредени пациенти препоръчваната доза е 7,5 mg.

Лечението трябва да започне с най-ниската препоръчвана доза. Максималната доза не трябва да се превишава поради повишен риск от нежелани реакции от страна на централната нервна система (ЦНС).

Специални инструкции за дозиране

При пациенти с увредена чернодробна функция препоръчваната доза е 7,5 mg. Dozmicum може да се приема по всяко време на денонощието, като на пациента се осигурява поне 7-8 часа спокоен сън.

Премедикация

При премедикация Dozmicum трябва да се приема 30-60 минути преди процедурата.

4.3 Противопоказания

- Остра дихателна недостатъчност;
- остра чернодробна недостатъчност;
- синдром на Пикуик;
- деца;
- известна свръхчувствителност към бензодиазепини;
- миастения гравис.



4.4 Специални предупреждения и специални предпазни мерки при употреба.

Бензодиазепините са предназначени само когато нарушенията са тежки, пречат на нормалния начин на живот или когато лицето е подложено на изключителен стрес.

Поносимост

Известна загуба на ефикасност по отношение на хипнотичните ефекти при краткодействащите бензодиазепини може да се развие след повторна употреба за няколко седмици.

Зависимост

Употребата на бензодиазепини и бензодиазепиноподобни средства може да доведе до развиване на физическа и психологична зависимост от тези продукти. Рискът от зависимост се увеличава с дозата и продължителността на лечението; рискът е по-голям при пациенти, злоупотребявали с алкохол и наркотици. След като е развита физическа зависимост, остро прекъсване на лечението се съпровожда от симптоми на отнемане. Те могат да се изразят в главоболие, мускулни болки, силна тревога, напрежение, безпокойство, объркване и раздразнителност. В тежки случаи могат да се появят следните симптоми: загуба на чувството за реалност, деперсонализация, хиперакузис, безчувственост и изтръпване на крайниците, свръхчувствителност към светлина, халюцинации или конвулсии.

Rebound безсъние: преходен синдром, при който симптомите довели до лечение с бензодиазепини или бензодиазепиноподобни лекарства се появяват отново в по-силно изразена форма, могат да се появят при прекратяване на хипнотичното лечение. Може да бъде придружено с други реакции, включително промени в настроението, тревога или безпокойство.

Тъй като рискът от феномена на прекратяване/rebound феномен е по-силно изразен след прекъсване на лечението, препоръчва се дозировката да се намалява постепенно.



Продължителност на лечението

Продължителността на лечението с бензодиазепинови сънотворни трябва да бъде колкото се може по-кратка (вижте Дозировка) и не трябва да превишава 2 седмици. Дозировката трябва да се адаптира съобразно индивидуалните нужди. Удължаване над този период не трябва да се предприема без преоценка на ситуацията. Полезно е в началото на лечението пациентът да се информира, че то е с ограничена продължителност и му се обясни точно как дозата ще бъде намалена постепенно. Освен това е важно пациентът да бъде уведомен за възможността от rebound ренотема, като по този начин се намалява безпокойството от тези симптоми в случай, че възникнат след като лекарството не се прилага. Има данни, че при бензодиазепините с кратко действие, синдромът на отнемане може да се изяви в интервала между дозите, специално когато дозировката е висока.

Амнезия

Domicum може да причини антероградна амнезия. Най-често това състояние се получава през първите няколко часа след приемане на лекарството, и следователно за да се намали риска, пациентите трябва да са сигурни, че могат да си осигурят непрекъснат 7-8-часов сън (вижте Нежелани реакции).

Психични и "парадоксални" реакции

Парадоксални реакции като безпокойство, възбуда, раздразнителност, агресивност и в по-редки случаи чувство на заблуда, ярост, кошмари, халюцинации, психози, неадекватно поведение или други нежелани ефекти върху поведението могат да се появят при употреба на бензодиазепини. В такива случаи употребата на лекарството трябва да бъде спряна.

Много вероятно е тези реакции да се проявят при пациенти в напреднала възраст.



Специфични групи пациенти

При изтощени и пациенти в напреднала възраст препоръчаната доза е 7,5 mg. Пониската доза се препоръчва и при пациенти с хронична дихателна недостатъчност поради опасност от потискане на дишането.

Бензодиазепините не се препоръчват за първоначално лечение на психични заболявания.

Бензодиазепините не трябва да се използват самостоятелно за лечение на депресии или потиснатост, свързана с депресии, тъй като такива пациенти могат да развият склонност към самоубийство.

Бензодиазепините трябва да се използват изключително внимателно при пациенти с анамнестични данни за злоупотреба с алкохол или наркотици.

4.5 Взаимодействия с други медикаменти и други форми на взаимодействие

Трябва да се избягва едновременно приемане с алкохол. Седативният ефект може да бъде усилен, когато продуктът се използва в комбинация с алкохол. Това засяга способността за шофиране и работа с машини. Повишаване на централния депресивен ефект може да се появи в случаи на едновременна употреба с антипсихотици (невролептици), хипнотици, анксиолитици/седатива, антидепресанти, наркотични аналгетици, антиепилептични лекарства, анестетици и седативни антихистаминови препарати.

В случая с наркотичните аналгетици може също да се появи повишаване на еуфорията, което води до нарастване на психологичната зависимост.

Проучванията показват, че ранитидинът може да доведе до по-високи плазмени концентрации, като по този начин повишава клиничния ефект на мидазолам. Тези данни могат да бъдат отнесени до увреждания на стомашното рН (причинено от приложението на ранитидин) и неговото влияние върху приема на лекарства.

Има потенциално важно взаимодействие между мидазолам и веществата, които инхибират или индуцират определени чернодробни ензими (специално цитохром Р 450 3А4). Данните ясно показват, че тези компоненти повлияват



фармакокинетиката на мидазолам и по този начин водят до увредена степен и/или продължителност на седирането. По настоящем е известно, че ин виво индукция се явява с рифампицин, карбамазепин и фенитоин, ензимна инхибиция се наблюдава при циметидин, еритромицин, дилтиазем, верапамил, кетоконазол, флуконазол и итраконазол. Следователно предписването на мидазолам на пациенти, получаващи горните лекарства или други, инхибиращи Р 450 3 А, трябва да се избягва, когато е възможно. В противен случай дозата на Dormicum трябва да бъде коригирана. В тези случаи пациентът трябва да бъде под внимателен контрол.

4.6 Бременност и кърмене

Няма достатъчно данни за безопасността на мидазолам по време на бременност. Употребата на бензодиазепини по време на бременност трябва да се избягва, освен ако няма по-безопасна алтернатива. Ако продуктът е предписан на жена в детеродна възраст, тя трябва да се консултира със своя лекар във връзка със спирането на лекарството в случай, че възнамерява да забременее или подозира, че е бременна. Ако в отделни случаи лекарят прецени, че прилагането на лекарственото средство през последните три месеца от бременността или по време на работа е необходимо, то при новороденото могат да се наблюдават симптоми като хипотермия, хипотония, недохранване или умерена депресия на дихателната система, които могат да се очакват във връзка с фармакологичното действие на продукта.

Освен това новородени от майки, които през последния етап от бременността са взимали хронично бензодиазепини, могат вече да са развили физическа зависимост и да са изложени на известен риск от развитие на симптоми на отнемане в послеродовия период.

Тъй като мидазоламът прониква в майчиното мляко, Dormicum не трябва да се прилага при майки кърмачки.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини



Седиране, амнезия, увредена способност за концентриране и увредена мускулна функция могат да повлияят неблагоприятно способността да се шофира или да се използват машини. Ако продължителността на съня не е достатъчна, вероятността от сънливост през деня може да бъде повишена (вижте също Взаимодействия).

4.8 Нежелани реакции

Следните нежелани реакции могат да се появят във връзка с Dormicum таблетки:

Сънливост през деня, изтръпване, намалена бдителност, объркване, отпадналост, главоболие, световъртеж, мускулна слабост, атаксия или двойно виждане. Тези симптоми се явяват главно в началото на лечението и обикновено изчезват при повторно приложение.

Понякога се срещат и други нежелани реакции като стомашночревни нарушения, промени в либидото или кожни реакции.

Когато се използва като премедикация, този продукт може да допринесе за удължаване на постоперативното седиране.

Реакции на свръхчувствителност могат да се появят при възприемчиви индивиди.

Амнезия

Антероградна амнезия може да се появи при лечебни дози, рискът се повишава при по-високи дози. Амнестичните ефекти могат да се свържат с необичайно поведение (вижте Предпазни мерки).

Депресия

По време на употребата на бензодиазепини може да се разкрие съществуваща преди депресия.

Психични и "парадоксални" реакции

Известно е, че при употреба на бензодиазепини или бензодиазепиноподобни средства могат да се появят парадоксални реакции като безпокойство, възбуда, раздразнителност, агресивност, чувство на заблуда, ярост, кошмари, халюцинации, психози, необичайно поведение или други нежелани поведенчески реакции. В такива случаи употребата на лекарството трябва да бъде спряна.

Тези реакции е по-вероятно да се проявят при пациенти в напреднала възраст.



Зависимост

Употребата (дори на лечебни дози) може да доведе до развитие на физическа зависимост: прекъсване на лечението може да доведе до симптоми на отнемане или rebound феномен (вижте Предпазни мерки). Може да се появи психическа зависимост. Зависимост е съобщена при пациенти, злоупотребяващи с много други лекарства.

4.9 Предозиране

Обикновено предозирането при бензодиазепини се изразява в различна степен на депресия на централната нервна система, варираща от сънливост до кома. Симптомите на предозирането с Doanicum се извяват предимно в интензифициране на фармакологичните ефекти напр. сънливост, психична обърканост, летаргия или парадоксално възбуждане. Както другите бензодиазепини, предозирането е животозастрашаващо, ако е комбинирано с други потискащи ЦНС депресанти (включително алкохол). В леките случаи симптомите включват сънливост, психична обърканост, летаргия или парадоксално възбуждане, в по-сериозните случаи симптомите включват атаксия, хипотония, хипотензия, арефлексия, потискане на сърдечната и дихателна система, апное и рядко кома.

Лечение

При лечение на предозиране с лекарства трябва да се има пред вид, че има вероятност да са приети няколко препарати.

След предозиране с перорални бензодиазепини трябва да се предизвика повръщане (до 1 час), ако пациентът е в съзнание или стомашна промивка с обдишване, ако пациентът е в безсъзнание. Ако няма полза от изпразването на стомаха, трябва да се приложи активен въглен за да се редуцира абсорбцията. Специално внимание трябва да се отдели на дихателните и сърдечно-съдовите функции в отделение за интензивна терапия.



Специфичният бензодиазепинов антагонист флумазенил може да бъде използван като антагонист.

5. Фармакологични данни

5.1 Фармакодинамични свойства

Dormicum е сънотворно средство, характеризиращо се с бързо настъпващ ефект и краткотрайно действие. Контролните клинични изследвания и лабораторните тестове са показали, че Dormicum скъсява времето за заспиване и удължава продължителността на съня без количествено повлияване на REM фазата. Фазите на събуждане се скъсяват и качеството на съня се подобрява.

Dormicum също така притежава анксиолитичен, антиконвулсивен и миорелаксиращ ефект.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция

Мидазолам се абсорбира бързо и напълно след перорално приложение. Поради ефекта на първото преминаване, бионаличността е около 40%.

При доза 15 mg стойностите на максималните плазмени концентрации от 70-120 ng/ml се постигат след 0,5-1,5 часа.

Разпределение

Концентрациите в плазмата се понижават в две фази, с полуживот от 0,3-0,5 часа (фаза на разпределение) и 1,5-3,5 часа (фаза на елиминиране). Обемът на разпределение варира между 0,7-1,2 l/kg. 96-98 % от мидазолам се свързва с плазмените протеини. Има данни, че при хора и животни мидазоламът преминава през плацентата и навлиза във феталното кръвообръщение. Малки количества мидазолам са установени в майчиното мляко.

Метаболизъм

Мидазоламът се метаболизира бързо и напълно.



30-50 % от активната съставка е вече метаболизирана по време на първото преминаване през черния дроб. Основният фармакологично активен метаболит е α -хидрокси-мидазолам, чийто полуживот на елиминиране е по-кратък от този на основната субстанция. Дори след продължително приложение на основната субстанция по един път през нощта не настъпва кумулиране на активната съставка и фармакокинетичният профил и метаболизъм остават постоянни.

Елиминиране

Мидазоламът се елиминира след метаболизиране. Образуваните метаболити претърпяват бърза конюгация с глюкуронова киселина и се отделят под формата на глюкурониди през бъбреците.

Фармакокинетика при специални клинични състояния

Компенсираната чернодробна дисфункция и напредналата възраст не влияят или оказват незначително влияние върху фармакокинетиката на пероралния мидазолам.

6. Фармацевтични свойства

6.1 Несъвместимости

Едновременното приемане с алкохол трябва да се избягва. Седативният ефект може да бъде усилен, когато лекарственото средство се използва в комбинация с алкохол. Това засяга способността за шофиране и работа с машини.

6.2 Срок на годност

5 години.

Да не се употребява след изтичане срока на годност, отбелязан върху опаковката.

6.3 Специални условия за съхранение

Няма.



6.4 Данни за опаковката

Специфична за всяка страна.

6.5 Препоръки за употреба

При условия на съхранение под 30°C.

7. Производител и притежател на разрешението за употреба.

F-Hoffmann - La Roche, Ltd., Basel, Switzerland.

8. Номер на регистрацията – 112

9. Дата на първата регистрация-28.02.1994г.

10. Дата на (частична) ревизия на текста – октомври 2003г.

