

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

MEDAZEPAM NINFI МЕДАЗЕПАМ НИХФИ

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО

Приложение към
разрешение за употреба № 1-5345/03.08.02г

6/9/09-04.02 *Мичев*

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Medazepam NINFI

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Medazepam 10 mg в една таблетка.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетки

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Показания

Невротични разстройства и състояния, съпроводени с чувство на страх, тревога, напрегнатост, повишена раздразнителност, безсъние, вегетативна лабилност.

4.2. Дозировка и начин на приложение

Дозите се определят индивидуално. За амбулаторно лечение обикновено по 2 таблетки дневно - сутрин и обед по 1/2 таблетка и 1 таблетка вечер. При тежки състояния до 3 таблетки дневно, а в стационарна обстановка - до 6 таблетки дневно. При по-леки състояния, болни в напреднала възраст и при деца от 12 до 16 години - по 1-2 таблетки дневно.

4.3. Противопоказания

Свръхчувствителност към някоя от съставките на лекарствения продукт или към други бензодиазепини, първите три месеца на бременността, миастения гравис, едновременна употреба с алкохол.

Медазепам не трябва да се прилага при предишна или сега съществуваща зависимост към алкохол, наркотици или медикаменти.

4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

Дозата на лекарствения продукт винаги трябва да се намалява постепенно, като се следи за евентуална проява на психическа зависимост.



Да се избягва прилагането на медазепам при пациенти с депресия и остра дихателна недостатъчност. Много предпазливо да се използва при бъбречни и чернодробни заболявания и при пациенти в напреднала възраст.

Приложението на медазепам при деца до 12 години не се препоръчва, тъй като клиничният опит при тази група пациенти е твърде малък.

Внимание

Този лекарствен продукт съдържа пшенично нишесте и може да представлява опасност за хора с цьолиакия.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

При едновременна употреба на медазепам с други потискащи ЦНС средства - невролептици, транквилизатори, хипнотици, наркотици, аналгетици и алкохол се потенцират техните централни ефекти. Алкохолът повишава резорбцията и токсичните ефекти на медазепам върху ЦНС.

4.6. Употреба при бременност и кърмене

Да не се употребява в първите 3 месеца на бременността. В периода на кърмене да се използва само по строга лекарска преценка, тъй като преминава през плацентарната бариера и се екскретира с млякото.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Поради опасност от намаляване на активното внимание и забавяне на рефлексите, по време на лечение с този лекарствен продукт не трябва да се управляват моторни превозни средства и машини.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

В отделни случаи, особено в началото на лечението, може да се наблюдават леко изразени сънливост, уморяемост, обърканост, които обикновено преминават самостоятелно или при намаляване на дозата. При по-високи дози е възможно нарушение в координацията и понижаване на способността за ориентиране.

При продължителна употреба на лекарствения продукт може да се развие лекарствена зависимост, която се характеризира главно със силно желание за употреба на лекарството, тенденция към повишаване на дозата, физическа и психическа зависимост, абстинентен синдром при прекратяване на приема.



4.9. Предозиране

Може да се наблюдава депресия на ЦНС, сънливост, нарушения на съзнанието. В такива случаи лекарственият продукт се спира. Прилагат се мерки за бързо елиминиране на препарата от организма. Назначават се симптоматични средства - специфичен антагонист на бензодиазепините е флумазенил.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1. Фармакодинамични свойства

Медазепам е бензодиазепинов лекарствен продукт с изразено анксиолитично и незначително миорелаксиращо и хипногенно действие. Високата биологична активност на продукта е свързана с ефекта му върху бензодиазепиновите рецептори в мозъка и подобряване на невроналното предаване, медирано от ГАМК (гама-аминомаслена киселина). Медазепам засилва афинитета на ГАМК към рецепторите ѝ. Продуктът не повлиява екстрапирамидната система. Регулацията на кръвообращението се повлиява благоприятно.

При експерименталните психоневрофармакологични изследвания на Медазепам НИХФИ върху бели мишки линия Н и бели плъхове Вистар се установи, че той притежава изразено централно депресивно действие с транквилизиращ характер без хипнотичен ефект. Потиска естествената и експериментално предизвикана агресивност (при изолационна агресивност средната ефективна доза е 0.25 mg/kg; при клонидинова агресивност ED₅₀ е 5 mg/kg). Медазепам НИХФИ има противогърчов ефект по отношение на пентетразола; оказва миорелаксиращо действие на експериментални животни; има антагонизъм спрямо централното възбудно действие на морфина (ED₅₀ - 28 mg/kg), потенцира силно хексобарбиталовата наркоза (ED₅₀ е 60 mg/kg); има силно антиноцицептивно действие.

Клиничните изследвания доказват, че основните терапевтични свойства на Медазепам НИХФИ са психичната релаксация, премахване на невротичната напрегнатост, страховите изживявания и нормализиране на нарушените вегетативни функции. Премахва многобройните вегетативни и соматични смущения, предизвикани от психогенни фактори. Отличава се от класическите седативни и хипнотични средства по това че притежава



изразено психорелаксиращо действие и незначително миорелаксиращо, противогърчово и сънотворно действие.

5.2. Фармакокинетични свойства

Медазепам се резорбира добре в гастро-интестиналния тракт след перорално приложение, като максимални плазмени концентрации се достигат в рамките на 2 часа. Метаболизира се до редица активни метаболити включително нормедазепам, диазепам и N-дезметилдiazепам (нордазепам) главно в черния дроб. Главният метаболит - глюкоронид на оксазепам се появява в урината до 7 часа след приема в количество 0,05 до 0,24 % от дозата. Плазменият живот на продукта и неговите метаболити е по-дълъг при новородени, при възрастни пациенти над 60 години и при пациенти със заболявания на черния дроб. Медазепам се екскретира от организма с урината главно под формата на метаболити, както в свободна, така и в конюгирана форма. Времето за постигане на максимална плазмена концентрация (T_{max}) е 0,47 часа. Максималната плазмена концентрация (C_{max}) е 627,8 ng/ml, а плазмените концентрации в интервал от 7 часа са в рамките на терапевтичните концентрации - от 100 до 1000 ng/ml. AUC_{0-7} е 1501,74 ng/ml/h. Премахва кръвно-мозъчната бариера. Премахва през плацентарната бариера и се екскретира с млякото.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Острата токсичност на Медазепам НИХФИ е определена върху бели мишки линия Н (18-25 g) и бели плъхове Wistar (140-190 g) от двата пола. Медазепам е прилаган под формата на 10 % суспензия с Твин 80, еднократно сутрин, по два пътя на въвеждане - перорално и интраперитонеално. Острата (LD_{50}) токсичност на медазепам при перорално приложение върху мишки е 1350 (737÷1944) mg/kg т.м., а върху плъхове - 2800 (2314÷3388) mg/kg т.м. При интраперитонеално приложение LD_{50} е 600 (428÷840) mg/kg т.м. за мишки и 2200 (1718÷2816) mg/kg т.м. за плъхове. Според класификацията на Hodge и Sterneг при перорално приложение на плъхове медазепам принадлежи към групата на слабо токсичните вещества. Индексът на резорбция за плъхове е 1,25, а за мишки е 2,25. Не са установени полови различия между използваните експериментални животни по отношение на острата токсичност.



Опитите за определяне на субакутната (30-дневна) токсичност са проведени върху бели плъхове порода Вистар по равен брой от двата пола. Изследваното вещество е прилагано пер ос под формата на 10 % водна суспензия с Твин 80 в дози 5 и 10 mg/kg т.м. Проследени са следните показатели: общо поведение, леталитет, динамика на телесна маса, хематологични изследвания, клинично-химични тестове. Проведените изследвания не установиха статистически значими разлики в стойностите на проучваните показатели извън границите на физиологичната им вариабилност. Тримесечни и шестмесечни хронични експерименти бяха проведени върху бели плъхове по равен брой от двата пола. Медазепам бе прилаган пер ос под форма на 10 % водна суспензия с Твин 80 в дози 0.25 и 0.50 mg/kg т.м.. Не са установени промени в поведението на животните, леталитет и статистически значими разлики в хематологичните и клинично-химичните показатели.

Изследванията за шестмесечна хронична токсичност са проведени върху кучета порода Бийгъл. Препаратът е прилаган перорално в доза 3 mg/kg. Не се установяват данни за токсично увреждане.

Резултатите от патоморфологичните изследвания на експерименталните животни показват, че медазепам не уврежда структурата на вътрешните органи.

Проведените изследвания за ембриотоксично и тератогенно действие на медазепам показват, че той не притежава ембриотоксична активност спрямо изследвания вид животни (бели плъхове порода Вистар). Липсата на видими външни, скелетни и висцерални малформации дава основание да се твърди, че Медазепам НИХФИ няма тератогенен ефект върху плъхове.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества и техните количества в една таблетка

Lactose monohydrate	87,992 mg
Wheat starch	45,000 mg
Talc	4,000 mg
Magnesium stearate	1,500 mg
Gelatin	1,500 mg



6.2. Физико-химични несъвместимости

Няма.

6.3. Срок на годност

4 (четири) години.

6.4. Специални условия на съхранение

При температура под 30°C.

Да се съхранява на места, недостъпни за деца!

6.5. Данни за опаковката

Първична опаковка

Десет (10) броя необвити таблетки се опаковат в блистер от млечно бяло PVC фолио.

Вторична опаковка

3 (три) блистера, заедно с листовка се поставят в единична, сгъваема картонена кутия.

6.6. Препоръки при употреба

Да не се прилага след изтичане срока на годност, посочен върху опаковката!

7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРОИЗВОДИТЕЛЯ И ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА

РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

НИХФИ АД

София 1797

бул. "Кл. Охридски" 3

8. ДАТА НА ИЗГОТВЯНЕ НА ХАРАКТЕРИСТИКАТА

12.2001 год.

