

ZĀĻU APRAKSTS

1. ZĀĻU NOSAUKUMS

TAZEPAM

10 mg apvalkotās tabletes

2. KVALITATĪVAIS UN KVANTITATĪVAIS SASTĀVS

Viena apvalkotā tablete satur 10 mg oksazepāma (*Oxazepamum*).

Pilnu palīgvielu sarakstu skatīt apakšpunktā 6.1.

3. ZĀĻU FORMA

Apvalkotās tabletes.

Ārējais izskats: baltas vai gandrīz baltas, apaļas tabletes, plakanas no abām pusēm, ar viendabīgu virsmu, bez robainām malām un plaisām. Tabletes ir apvalkotas.

4. KLĪNISKĀ INFORMĀCIJA

4.1 Terapeitiskās indikācijas

Tūlītēja, īslaicīga šādu simptomu terapija:

- nervu sistēmas traucējumus, kā arī citus psihosomatiskus traucējumus pavadoša trauksme;
- funkcionālas izcelsmes miega traucējumi.

Uzmanību! Spriedzes un nemiera palielināšanās, kas saistīta ar ikdienas problēmām, nav indikācija, lai lietotu šīs zāles.

4.2 Devas un lietošanas veids

Devas un terapijas ilgumu jānosaka individuāli katram pacientam.

Pieaugušie un bērni, kas vecāki par 12 gadiem

Trauksmes gadījumā – 10 mg līdz 30 mg 3 līdz 4 reizes 24 stundu laikā.

Miega traucējumu gadījumā – 10 mg līdz 30 mg stundu pirms gulētiešanas. Atsevišķos gadījumos devu var palielināt maksimāli līdz 50mg.

Pacienti, kas lieto oksazepāmu miega traucējumu gadījumos, jāinformē, ka šo zāļu lietošana viņiem nodrošinās 7-8 stundu nepārtraukta miega.

Bērni līdz 12 gadu vecumam

Oksazepāmu nedrīkst lietot bērni līdz 12 gadu vecumam.

Devas gados vecākiem pacientiem

Gados vecāki pacienti ir vairāk jutīgi pret zālēm, kas ietekmē centrālo nervu sistēmu. Sākuma deva parasti ir pa 10 mg 3 reizes dienā (24h). Atsevišķos gadījumos, ja nepieciešams, devu var pakāpeniski palielināt līdz 60 mg dienā (24h).

Devas pacientiem, kam ir aknu un nieru mazspēja.

Piesardzīgi jānozīmē oksazepāms pacientiem, kam ir aknu un nieru funkciju traucējumi. Šiem pacientiem var būt nepieciešama devas samazināšana.

Lietošanas ilgums.

Oksazepāmu lieto trauksmes simptomātiskai terapijai. Lietošanas ilgumam jābūt ierobežotam līdz nepieciešamajam minimumam – parasti no dažām dienām līdz 2 nedēļām. Ārstēšanas ilgumam kopā ar pakāpenisku terapijas atcelšanu nevajadzētu pārsniegt 4 nedēļas. Pakāpeniska ārstēšanas atcelšana jānosaka individuāli katram pacientam. Pēkšņa oksazepāma

lietošanas pārtraukšana var novest pie zāļu atcelšanas simptomu attīstības (miega traucējumi, koncentrēšanās un uzmanības traucējumi, paaugstināta uzbudināmība, pat psihiski traucējumi). Pēkšņa ilglaicīgas terapijas pārtraukšana var izrādīties sevišķi bīstama, īpaši, ja oksazepāms tika lietots devās, kas ir lielākas par vidējām. Zāļu atcelšanas simptomi var būt vairāk izteikti.

Atsevišķiem pacientiem, novērtējot viņu stāvokli, ārsts var pagarināt maksimālo terapijas ilgumu. Ilglaicīga šo zāļu lietošana netiek rekomendēta, jo var attīstīties tolerance un atkarības simptomi.

Lietošanas veids

Zāles lieto iekšķīgi, uzdzerot nelielu daudzumu ūdens.

Lai nomāktu trauksmes simptomus, rekomendē lietot mazāko iespējamo efektīvāko devu. Zāļu deva jāpalielina pakāpeniski.

4.3 Kontrindikācijas

- Paaugstināta jutība pret oksazepāmu, 1,4-benzodiazepīna atvasinājumiem un/vai pret jebkuru no zāļu palīgvielām;
- Akūta elpošanas mazspēja, neatkarīgi no cēloņa;
- Smaga aknu un nieru mazspēja;
- *Myasthenia gravis*;
- Glaukoma;
- Akūta porfīrija;
- Saindēšanās ar centrālo nervu sistēmu nomācošiem līdzekļiem;
- Saindēšanās ar alkoholu;
- Apnojas sindroms miega laikā;
- Bērni līdz 12 gadu vecumam;
- Grūtniecība;
- Zīdīšanas periods.

4.4 Īpaši brīdinājumi un piesardzība lietošanā

Izrakstot oksazepāmu, jāņem vērā vispārīgā informācija par benzodiazepīnu un citu miegu izraisošu zāļu iedarbību.

Tolerance

Vairāku nedēļu regulāra benzodiazepīnu vai līdzīgas iedarbības zāļu, ieskaitot oksazepāmu, lietošana, var novest pie šo zāļu efektivitātes samazināšanās.

Atkarība

Benzodiazepīnu vai līdzīgas iedarbības zāļu lietošana var novest pie psihiskas vai fiziskas atkarības. Atkarības veidošanās risks pieaug līdz ar devas un lietošanas ilguma palielināšanos un tas ir lielāks pacientiem, kam jau ir bijusi atkarība no alkohola vai citām zālēm.

Gadījumā, ja attīstās atkarība, tad pēkšņa zāļu lietošanas pārtraukšana var izraisīt zāļu atcelšanas sindromu.

Raksturīgākie šī sindroma simptomi ir galvassāpes, muskuļu sāpes, satraukums, emocionāla spriedze, kustību vājums, nemiers, apmulsums, dezorientācijas stāvoklis, uzbudināmība, bezmiegs. Smagos gadījumos var būt zaudēta realitātes izjūta, personības izmaiņas, paaugstināta jutība uz pieskārieniem, kā arī uz skaņu un gaismu, durstoša sajūta ekstremitātēs, kā arī ekstremitāšu nejūtīgums, halucinācijas vai krampju lēkmes.

Ir pieejami ziņojumi, kuros norādīts, ka, lietojot īsas darbības benzodiazepīnus vai benzodiazepīniem līdzīgas zāles, zāļu atcelšanas sindroms var attīstīties starplaikos starp atsevišķām devām, it sevišķi, ja zāles tiek lietotas lielās devās.

Anterogrādā amnēzija

Oksazepāms, tāpat kā benzodiazepīni un tiem līdzīgās zāles, var izraisīt anterogrādo amnēziju. Biežāk šāds stāvoklis iestājas vairāku stundu laikā pēc zāļu lietošanas, sevišķi, ja zāles tiek lietotas lielās devās. Lai samazinātu anterogrādās amnēzijas iespējamību pacientiem, kas lieto oksazepāmu miega traucējumu gadījumos, tiek rekomendēts lietot oksazepāmu vienu stundu pirms gulētiešanas. Tas nodrošinās 7-8 stundas nepārtraukta miega.

Psihiskas un paradoksālās reakcijas

Oksazepāms, tāpat kā citi benzodiazepīni un tiem līdzīgās zāles, var izraisīt paradoksālas un psihiskas reakcijas. Tās var būt kustību vājums, satraukums, uzbudināmība, agresivitāte, nakts murgi, halucinācijas, psihozes, mēnessērdzība, personības izmaiņas, pieaug bezmiegs, kā arī citas šo zāļu blakusparādības, kas saistītas ar uzvedību. Šādas reakcijas vairāk tika novērotas gados vecākiem pacientiem vai no alkohola atkarīgiem pacientiem.

Ja parādās kāds no šiem simptomiem, oksazepāma lietošana ir jāpārtrauc.

Specifiskas pacientu grupas

Gados vecākiem un fiziski vājiem pacientiem oksazepāmu vajadzētu lietot mazākās devās (skatīt apakšpunktu 4.2.), sakarā ar palielinātu blakusparādību (galvenokārt orientācijas un motorās koordinācijas traucējumi – kritieni, traumas) risku šajā vecuma grupā.

Oksazepāms uzmanīgi jālieto pacientiem ar hronisku respiratoru mazspēju, jo benzodiazepīniem piemīt nomācoša ietekme uz elpošanas centru smadzenēs.

Benzodiazepīnus un tiem līdzīgas zāles nerekomendē pacientiem ar akūtu aknu mazspēju, jo tas var izraisīt aknu encefalopātijas attīstību.

Benzodiazepīnus un tiem līdzīgās zāles nerekomendē pacientiem, kas cieš no psihozēm.

Lietošana depresijas laikā: oksazepāms ļoti uzmanīgi jālieto pacientiem ar endogēnās depresijas simptomiem. Šiem pacientiem piemīt tieksme uz pašnāvību. Pārdozēšanas riska dēļ, oksazepāms šādiem pacientiem jāizraksta mazākā iespējamā devā.

Benzodiazepīnus un tiem līdzīgās zāles nevajadzētu lietot monoterapijai depresijas vai aizdomu par depresiju gadījumā. Monoterapija ar šīm zālēm var pastiprināt pašnāvības tieksmes.

Benzodiazepīnus un tiem līdzīgās zāles ļoti uzmanīgi jālieto pacientiem, kam ir bijusi atkarība no alkohola vai citām zālēm (ieskaitot pārmērīgu zāļu lietošanu). Tādiem pacientiem stingri jākontrolē oksazepāma lietošana, jo viņiem ir augsts risks, ka var attīstīties ieradums un psiholoģiskā atkarība.

Oksazepāms uzmanīgi jālieto porfīrijas gadījumā. Oksazepāma lietošana var izraisīt šīs slimības simptomu paasināšanos.

Tazepāmu nevajadzētu lietot pacientiem ar retu iedzimtu galaktozes nepanesību, *Lapp* laktāzes deficītu vai glikozes – galaktozes malabsorbciju, jo tās satur laktozi.

Ārstēšanas laikā ar oksazepāmu un 3 dienas pēc ārstēšanas kursa beigām nedrīkst lietot nekādus alkoholiskus dzērienus.

4.5 Mijiedarbība ar citām zālēm un citi mijiedarbības veidi

- Oksazepāma nomācošo iedarbību uz centrālo nervu sistēmu pastiprina opioīdie pretsāpju līdzekļi, anestezējošie līdzekļi (anestētiķi), psihotropās zāles, antidepresanti, antihistamīni un asinsspiedienu pazeminošās zāles, kam ir iedarbība uz CNS.
- Disulfirāms, cimetidīns, eritromicīns un ketokonazols darbojas kā citohroma P-450 izoenzīmu inhibitori, kas kavē 1,4-benzodiazepīna atvasinājumu biotransformācijas procesus, līdz ar to palielina tā nomācošo iedarbību uz centrālo nervu sistēmu.
- Zāles, kas palielina citohroma P-450 aktivitāti (tādas kā rifampicīns, fenobarbitāls, fenitoīns, karbamazepīns), ietekmē 1,4- benzodiazepīnu atvasinājumu biotransformācijas procesu, līdz ar to pavājina to farmakoloģisko aktivitāti.

- Vienlaicīga ritanovira lietošana var palielināt oksazepāma koncentrāciju plazmā.
- Alkohola lietošana oksazepāma terapijas laikā pastiprina nomācošo iedarbību uz centrālo nervu sistēmu, kā arī var izraisīt paradoksālas reakcijas, tādās kā psihomotoro stimulāciju, agresīvu uzvedību.
- Oksazepāms, ja to lieto kopā ar zālēm, kas samazina skeleta muskulatūras tonusu, pagarina un pastiprina to darbību.
- Teofilīns un kofeīns var samazināt benzodiazepīnu miegu izraisošo darbību (ieskaitot oksazepāmu), jo tie stimulē centrālo nervu sistēmu un pirmie spēj inducēt aknu enzīmus, kas ir atbildīgi par zāļu metabolismu.
- Oksazepāms, lietojot to kopā ar pretparkinsonisma zālēm (tādām kā levodopa), var pavājināt to iedarbību.
- Perorālie kontraceptīvie līdzekļi, lietojot tos kopā ar oksazepāmu, var pastiprināt tā kavējošo iedarbību uz CNS.

4.6 Grūtniecība un zīdīšana

Kontrindicēts grūtniecības un zīdīšanas periodā.

4.7 Ietekme uz spēju vadīt transportlīdzekļus un apkalpot mehānismus

Oksazepāma terapijas laikā spēja vadīt mehāniskos transporta līdzekļus un apkalpot mehānismus var būt ierobežota iespējamās koncentrēšanās spējas samazināšanās, miegainības un atmiņas zuduma dēļ. Terapijas laikā, kā arī 3 dienas pēc terapijas beigām pacienti nedrīkst vadīt transporta līdzekļus un apkalpot iekārtas.

4.8 Nevēlamās blakusparādības

Nevēlamo blakusparādību daudzums un intensitāte ir atkarīga no katra pacienta jutīguma, kā arī no devas. Zāļu lietošanas pārtraukšana nopietnu nevēlamo blakusparādību dēļ, ir ļoti reta.

- **Nervu sistēmas traucējumi:**
Bieži: miegainība, palēlināta reakcija, galvas reiboņi un galvassāpes, apmulsums, dezorientācijas stāvoklis un ataksija. Šīs reakcijas biežāk sastopamas terapijas sākumā un parasti mazinās, turpinot terapiju. Ja augstākminētās blakusparādības pieaug, tad samazinot zāļu devu, tās kļūst mazāk izteiktas un nav tik bieži sastopamas.
Reti: dizartrijs, ko pavada neskaidra runa un nepareiza izruna, atmiņas traucējumi, libido disfunkcija.
- **Acu slimības:** redzes traucējumi (neskaidra redze, redzes dubultošanās).
- **Kuņģa-zarnu trakta traucējumi:** slikta dūša, gastrointestināli traucējumi, sausuma sajūta mutē.
- **Nieru un urīnceļu traucējumi:** urīna nesaturēšana.
- **Skeleta-muskuļu un saistaudu sistēmas bojājumi:** muskuļu trīce.
- **Asinsvadu sistēmas traucējumi:** neliela arteriālā asinsspiediena samazināšanās.
- **Vispārēji traucējumi un reakcijas ievadišanas vietā:** vispārējs vājums, nejauša burtu izlaišana.
- **Imūnās sistēmas traucējumi:**
Ādas un zemādas audu bojājumi: ādas alerģiskas reakcijas (izsitumi).
- **Aknu un/vai žultsceļu traucējumi:** aknu funkciju traucējumi ar dzelti.
- **Reproduktīvās sistēmas un krūts slimības:** menstruālā cikla traucējumi,
- **Asins un limfatiskās sistēmas traucējumi:** izmaiņas asinsainā (leikopēnija, agranulocitoze),
- **Psihiskie traucējumi:** paradoksālas reakcijas – psihomotorā trauksme, bezmiegs, paaugstināta uzbudināmība un agresivitāte, muskuļu trīce, krampji.
Paradoksālas reakcijas visbiežāk rodas pēc alkohola lietošanas, gados vecākiem pacientiem, kā arī psihiski slimiem pacientiem.

Oksazepāma terapijas laikā var parādīties nediagnosticēts pirmsdepresijas stāvoklis. Lietojot oksazepāmu terapeitiskās devās, var attīstīties fiziska atkarība no šīm zālēm. Pēkšņa šo zāļu lietošanas pārtraukšana var paātrināt zāļu atcelšanas sindroma rašanos. Pacienti, kuri cieš no alkoholisma un narkomānijas, ir sevišķi disponēti, lai attīstītos atkarība no šīm zālēm.

4.9 Pārdozēšana

Oksazepāma pārdozēšanas rezultātā var parādīties šādi simptomi: miegainība, apjukums, neskaidra runa, smagos gadījumos – samaņas zudums un koma. Vienlaicīga oksazepāma un alkohola lietošana vai oksazepāma un citu zāļu, kas nomāc centrālo nervu sistēmu, lietošana apdraud dzīvību. Saindēšanās gadījumā ar oksazepāmu nekavējoties jāizvada vēl neabsorbējušās zāles no organisma vai jāsamazina tā absorbcija no gremošanas trakta (kuņģa skalošana, aktivētās ogles lietošana, vemšanas izraisīšana – tikai pie samaņas esošiem pacientiem), pamata dzīvības funkciju monitorēšana (elpošana, pulss, asinsspiediens) un, ja nepieciešams, simptomātiskas terapijas uzsākšana.

Flumazenils ir specifisks antidots.

Ārstējot jebkuru zāļu pārdozēšanu, jāņem vērā, ka pacients var būt lietojis daudz dažādas zāles.

5. FARMAKOLOĢISKĀS ĪPAŠĪBAS

5.1 Farmakodinamiskās īpašības

Farmakoterapeitiskā grupa: anksiolītisks līdzeklis

ATĶ kods: N05BA04

Oksazepāms pieder pie benzodiazepīna atvasinājumiem. Tas ietekmē vairākas centrālās nervu sistēmas struktūras – sevišķi limbisko sistēmu un hipotalamu, t.i., struktūras, kas saistītas ar emociju kontroli. Tāpat kā citi benzodiazepīni, tas pastiprina GASS-erģisko neironu kavējošo ietekmi garozā, hipokampusā, smadzenītēs, talamā un hipotalāmā. Organismā ir specifiska benzodiazepīnu piesaistes vieta. Tās ir olbaltumvielu membrānu struktūras, kas saistītas ar GASS –A receptoru un hlorīdu kanāla kompleksu. Oksazepāma darbības mehānisms ir balstīts uz GASS- erģiskā receptora „jutības” izmaiņšanu, kas rada receptora afinitātes palielināšanos gamma-aminosviestskābei (GASS), kas ir bremzējošs endogēns neiromediators. Benzodiazepīna vai GASS receptoru stimulācijas rezultātā palielinās hlorīdu jonu ieplūšana neironos caur hlorīdu kanāliem. Tas noved pie šūnas membrānas hiperpolarizācijas, kā rezultātā tiek nomākta neirona aktivitāte. Klīniski tas izpaužas kā prettrauksmes iedarbība ar mazāk izteiktu trankvilizējošo darbību. Oksazepāmam piemīt arī vājas pretepileptiskas īpašības un tas atslābina skeleta muskulatūru.

5.2 Farmakokinētiskās īpašības

Oksazepāms labi absorbējas no gremošanas trakta. Biopieejamība ir 92%. Pēc vienreizējas oksazepāma – 30mg- perorālās devas lietošanas, maksimālā koncentrācija asins serumā – aptuveni 450ng/ml - tika novērota pēc aptuveni 3 stundām. Apmēram 85% oksazepāma saistās ar plazmas proteīniem. Zāles šķērso hemato-encefalopātisko barjeru, placentāro barjeru, kā arī mātes pienā. Oksazepāma eliminācijas pusperiods ir 8,2 stundas. Oksazepāma biotransformācija notiek aknās. Kā rezultātā, tam savienojoties ar glikuronskābi, veidojas neaktīvs metabolīts – oksazepāma glikuronīds.

Oksazepāms galvenokārt izvadās ar urīnu oksazepāma glikuronīda veidā.

5.3 Preklīniskie dati par drošību

Subakūtās toksicitātes pētījumos ar suņiem, kuriem tika dots oksazepāms četras nedēļas 960 mg/kg/diennaktī, parādījās asinsvadu kolapsa simptomi. Hroniskas toksicitātes pētījumos ar

suņiem, kuriem tika dots oksazepāms 52 nedēļas 120 mg/kg/diennaktī, toksiski simptomi netika novēroti.

Oksazepāma toksicitātes pētījumos ar žurkām tika atklāta atgriezeniska aknu lipodistrofija (6 nedēļu ilga diēta saturēja 0.5% oksazepāma).

Kancerogēnitātes pētījumos tika atklāts:

- žurku tēviņiem, kas saņēma oksazepāmu 30 reizes lielākā devā par maksimāli pieļaujamu devu cilvēkam, vairogdziedzerī veidojas labdabīga audzēja mezgliņi.

- pelēm, kas saņēma oksazepāmu 35 – 100 reizes lielākā devā par cilvēka terapeitisku devu, veidojas aknu adenoma.

Par ļaundabīgu audzēju veidošanos gadījumiem pacientiem, kas ārstējas ar oksazepāmu, datu nav.

6. FARMACEITISKĀ INFORMĀCIJA

6.1 Palīgvielu saraksts

Tabletes kodols: kartupeļu ciete, nātrijs karboksimetilciete, želatīns, polisorbāts 80, talks, magnija stearāts, laktoze.

Tabletes apvalks: celulozes acetāta ftalāts, makrogols 6000.

6.2 Nesaderība

Nav piemērojama.

6.3 Uzglabāšanas laiks

3 gadi

6.4 Īpaši uzglabāšanas nosacījumi

Uzglabāt temperatūrā līdz 25°C. Sargāt no gaismas un mitruma.

Uzglabāt bērniem nepieejamā un neredzamā vietā.

6.5 Iepakojuma veids un saturs

50 apvalkotās tabletes (2 blisteri pa 25 tabletēm katrs), kopā ar lietošanas instrukciju ievietotas kartona kastītē.

6.6 Īpaši norādījumi atkritumu likvidēšanai

Nav īpašu prasību.

7. REĢISTRĀCIJAS APLIECĪBAS ĪPAŠNIEKS

Tarchomin Pharmaceutical Works „Polfa” S.A., ul. A.Fleminga 2, 03-176 Warszawa, Polija

8. REĢISTRĀCIJAS NUMURS(I)

96-0447

9. REĢISTRĀCIJAS / PĀRREĢISTRĀCIJAS DATUMS

1996.gada 4.oktobris/2002.gada 4.oktobris

10. TEKSTA PĒDĒJĀS PĀRSKATĪŠANAS DATUMS

2007.gada maijs