

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

OXAZEPAM ESPEFA, 10 mg, tabletki

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Jedna tabletki zawiera 10 mg oksazepamu (*Oxazepamum*).

Substancje pomocnicze o znanym działaniu: laktoza jednowodna, sacharoza

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletka

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

- Stany lękowe
- Niepokój związany z depresją
- Podniecenie związane z ostrym alkoholowym zespołem abstynencyjnym

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Oxazepam Espefa stosuje się doustnie, niezależnie od posiłków. Dawkę należy dostosowywać indywidualnie. Należy stosować najmniejszą możliwą dawkę (zwłaszcza u pacjentów w podeszłym wieku, osłabionych i pacjentów z niskim stężeniem albuminy w osoczu) w celu uniknięcia nadmiernej sedacji.

Dorośli: wielkość dawki i schemat dawkowania zależy od indywidualnej wrażliwości i objawów klinicznych.

Niepokój o nasileniu łagodnym do umiarkowanego: 10 mg do 20 mg 3 do 4 razy na dobę.

Niepokój o znacznym nasileniu: 20 mg do 30 mg 3 do 4 razy na dobę, większa dawka w porze spoczynku.

U pacjentów w podeszłym wieku lub osłabionych, ze zmniejszoną masą ciała, z obniżonym ciśnieniem tętniczym, niewydolnością krążenia lub oddechową, osłabieniem mięśniowym zaleca się podawanie najmniejszej efektywnej dawki (zwykle 10 mg 3 razy na dobę).

Podniecenie związane z ostrym alkoholowym zespołem abstynencyjnym: 20 mg do 30 mg podawane 3 lub 4 razy na dobę.

Wieczorem nie należy przyjmować produktu leczniczego bezpośrednio po posiłku, z powodu opóźnienia działania i możliwości wystąpienia objawów zmęczenia i zaburzeń koncentracji następnego dnia rano.

W ostrych przypadkach należy stosować pojedynczą dawkę lub kilka dawek w ciągu kilku dni.

Czas leczenia

Czas leczenia należy ograniczyć do minimum – zwykle wynosi od kilku dni do 2 tygodni. Po dwóch tygodniach podawania oksazepamu wskazania do dalszego stosowania powinny zostać ponownie ocenione.

Czas leczenia łącznie z okresem stopniowego odstawiania nie powinien przekraczać 4 tygodni.

Stopniowe odstawianie produktu leczniczego należy dostosować indywidualnie dla każdego pacjenta. Nagłe odstawienie oksazepamu może spowodować zespół odstawienny (zaburzenia snu, koncentracji i uwagi, wzmożoną drażliwość, a nawet zaburzenia psychiatryczne). Szczególnie niebezpieczne może okazać się gwałtowne przerwanie terapii prowadzonej przez dłuższy czas, podczas której stosowane są większe niż przeciętne dawki oksazepamu. Objawy odstawienne są wtedy bardziej nasilone (patrz punkt 4.4).

Długotrwałe stosowanie produktu leczniczego nie jest zalecane ze względu na niebezpieczeństwo wystąpienia zjawiska tolerancji i objawów uzależnienia.

Dawkowanie u pacjentów z niewydolnością wątroby

Należy zachować ostrożność podczas stosowania oksazepamu u pacjentów z zaburzeniami czynności wątroby. Może być konieczne zmniejszenie dawki produktu leczniczego.

Dzieci i młodzież

Oksazepamu nie należy stosować u dzieci w wieku poniżej 6 lat. U dzieci i młodzieży w wieku od 6 do 18 lat nie zaleca się stosowania oksazepamu, ze względu na brak zaleceń dotyczących dawkowania w tej grupie wiekowej.

4.3 Przeciwwskazania

- Nadwrażliwość na substancję czynną, inne pochodne benzodiazepiny lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1;
- Ciężka niewydolność oddechowa, zespół bezdechu sennego;
- Ciężka niewydolność wątroby;
- Uzależnienie od leków, narkotyków lub alkoholu;
- Nie należy stosować w przypadku ostrego zatrucia alkoholowego, zatrucia środkami nasennymi, opiatami, środkami przeciwpsychotycznymi (neuroleptykami, lekami przeciwdepresyjnymi, solami litu);
- *Myasthenia gravis*;
- Nie należy stosować u kobiet w okresie ciąży i karmienia piersią oraz u dzieci w wieku poniżej 6 lat.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Tolerancja

Regularne stosowanie benzodiazepin lub produktów leczniczych działających podobnie do benzodiazepin, w tym oksazepamu, przez kilka tygodni może prowadzić do zmniejszenia skuteczności ich działania.

Uzależnienie

Stosowanie benzodiazepin lub produktów leczniczych działających podobnie do benzodiazepin może prowadzić do uzależnienia psychicznego i fizycznego. Ryzyko wystąpienia uzależnienia zwiększa się wraz z dawką i czasem trwania leczenia oraz jest większe u pacjentów uzależnionych od alkoholu lub leków w wywiadzie.

W przypadku wystąpienia uzależnienia, nagłe odstawienie produktu leczniczego może prowadzić do wystąpienia objawów zespołu odstawiennego.

Objawami charakterystycznymi dla zespołu odstawiennego są: ból głowy, bóle mięśni, pobudzenie i napięcie emocjonalne, niepokój ruchowy, stany splątania, dezorientacji, drażliwość, bezsenność.

W ciężkich przypadkach mogą pojawić się: utrata poczucia rzeczywistości, zaburzenia osobowościowe, nadwrażliwość na dotyk, bodźce akustyczne i świetlne, mrowienie i drętwienie kończyn, omamy lub napady drgawek.

Istnieją doniesienia, że w przypadku krótko działających benzodiazepin i produktów leczniczych działających podobnie do benzodiazepin, objawy zespołu odstawiennego mogą wystąpić nawet w przerwach pomiędzy poszczególnymi dawkami, zwłaszcza, jeśli produkt leczniczy jest podawany w dużych dawkach.

Niepamięć następcza

Oksazepam, tak jak inne benzodiazepiny i produkty lecznicze działające podobnie do benzodiazepin, może wywołać niepamięć następczą. Objawy najczęściej występują kilka godzin po przyjęciu produktu leczniczego, zwłaszcza w dużej dawce. U pacjentów stosujących oksazepam z powodu zaburzeń snu, w celu zminimalizowania ryzyka wystąpienia niepamięci, zaleca się stosowanie oksazepamu godzinę przed snem i zapewnienie warunków do ciągłego, nieprzerywanego 7 - 8 godzinnego snu.

Reakcje psychiczne i paradoksalne

Oksazepam, tak jak inne benzodiazepiny i produkty lecznicze działające podobnie do benzodiazepin, może wywołać reakcje psychiczne i paradoksalne, do których należą: niepokój ruchowy, pobudzenie, drażliwość, agresywność, koszmary senne, omamy, psychozy, somnambulizm, zaburzenia osobowości, nasiloną bezsenność oraz inne behawioralne działania niepożądane. Reakcje te znacznie częściej obserwuje się u pacjentów w podeszłym wieku.

W przypadku pojawienia się takich objawów oksazepam należy odstawić.

Specjalne grupy pacjentów

Oksazepam należy stosować z dużą ostrożnością u pacjentów w podeszłym wieku (powyżej 65 lat) i osłabionych, ze względu na możliwość nasilenia się działań niepożądanych, głównie zaburzeń orientacji i koordynacji ruchowej (patrz punkt 4.2). W tej grupie pacjentów nie należy długotrwale stosować oksazepamu i przerywać terapii w sposób nagły. Produkt leczniczy należy odstawiać stopniowo, poprzez zmniejszanie dawki.

Benzodiazepin i produktów leczniczych działających podobnie do benzodiazepin nie zaleca się stosować u pacjentów z psychozami.

Stosowanie w depresji: oksazepam należy stosować z dużą ostrożnością u pacjentów z objawami depresji. U pacjentów tych mogą występować skłonności samobójcze. Ze względu na możliwość celowego przedawkowania, pacjentom tym oksazepam należy zalecać w możliwie najmniejszej dawce.

Benzodiazepiny i produkty lecznicze działające podobnie do benzodiazepin nie powinny być stosowane w monoterapii depresji lub lęku związanego z depresją. Monoterapia tymi lekami może nasilić tendencje samobójcze.

Oksazepam należy ostrożnie stosować u pacjentów z przewlekłą niewydolnością oddechową, ponieważ, jak stwierdzono w przypadku benzodiazepin, wykazują one hamujący wpływ na ośrodek oddechowy.

Oksazepam należy ostrożnie podawać pacjentom z porfirią. Podawanie oksazepamu może spowodować nasilenie objawów tej choroby.

Oksazepam należy ostrożnie stosować u pacjentów, u których obniżenie ciśnienia tętniczego mogłoby prowadzić do powikłań kardiologicznych.

Ostrożność należy również zachować u pacjentów z niewydolnością nerek.

Benzodiazepin i produktów leczniczych działających podobnie do benzodiazepin nie zaleca się stosować u pacjentów z niewydolnością wątroby, ponieważ mogą przyspieszać rozwój encefalopatii (patrz także punkty 4.2 i 4.3). Podczas leczenia należy kontrolować czynność wątroby i morfologię krwi. Benzodiazepiny i produkty lecznicze działające podobnie do benzodiazepin należy stosować z dużą ostrożnością u pacjentów uzależnionych od alkoholu lub leków (w tym narkotyków) w wywiadzie.

Pacjenci tacy powinni pozostawać pod ścisłą kontrolą podczas przyjmowania oksazepamu, ponieważ są oni w grupie ryzyka wystąpienia uzależnienia fizycznego i psychicznego.

W trakcie stosowania oksazepamu i do 3 dni po zakończeniu jego zażywania nie należy pić napojów alkoholowych.

Produkt leczniczy nie powinien być stosowany u pacjentów z rzadko występującą dziedziczną nietolerancją galaktozy, niedoborem laktazy (typu Lapp) lub zespołem złego wchłaniania glukozy-galaktozy.

Pacjenci z rzadkimi dziedzicznymi zaburzeniami związanymi z nietolerancją fruktozy, zespołem złego wchłaniania glukozy-galaktozy lub niedoborem sacharazy-izomaltazy, nie powinni przyjmować produktu leczniczego.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Jednoczesne podawanie oksazepamu z innymi produktami leczniczymi wpływającymi depresyjnie na OUN (np. znieczulającymi, przeciwdepresyjnymi, przeciwhistaminowymi, przeciwnadciśnieniowymi, przeciwpyschotycznymi) zwiększa zarówno działania uspokajające oksazepamu, jak i inne działania stosowanych produktów leczniczych.

Podczas jednoczesnego stosowania oksazepamu i opioidowych leków przeciwbólowych może wystąpić nasilona euforia, co prowadzi do nasilenia uzależnienia psychicznego.

Środki zmniejszające napięcia mięśniowe (miorelaksacyjne) mogą również wzmacniać działanie uspokajające oksazepamu.

Podczas leczenia oksazepamem należy unikać picia alkoholu, ponieważ zgłaszano indywidualne przypadki reakcji paradoksalnych.

Teofilina i kofeina mogą osłabiać nasenne działanie benzodiazepin (również oksazepamu).

Oksazepam podawany jednocześnie z produktami leczniczymi stosowanymi w leczeniu parkinsonizmu (np. lewodopa) może osłabiać ich działanie.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

Przypuszcza się, że oksazepam stosowany w okresie ciąży może wywoływać ciężkie wady wrodzone. Oksazepam Espefa jest przeciwwskazany do stosowania w okresie ciąży (patrz punkt 4.3).

Benzodiazepin nie należy podawać kobietom w ciąży, zwłaszcza w I i III trymestrze. Długotrwałe stosowanie oksazepamu u kobiet w ciąży może spowodować wystąpienie zespołu abstynencyjnego u noworodka. Podawanie produktu leczniczego w ostatniej fazie ciąży lub podczas porodu może wywołać u noworodka hipotermię, hipotonię, zaburzenia oddychania, bezdech i osłabienie odruchu ssania.

Pacjentki w okresie rozrodczym, które stosują oksazepam, należy poinformować aby natychmiast skontaktowały się z lekarzem, jeśli podejrzewają, że są w ciąży.

Karmienie piersią

Oksazepam i jego metabolity przenikają do mleka kobiecego, dlatego nie należy karmić piersią podczas jego przyjmowania.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Oksazepam wywiera znaczny wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn. Podczas stosowania oksazepamu zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych może być ograniczona z powodu wystąpienia zaburzenia zdolności koncentracji, senności, niepamięci.

4.8 Działania niepożądane

Częstość występowania i nasilenie działań niepożądanych zależy od indywidualnej wrażliwości pacjenta oraz podanej dawki leku. Przerwanie stosowania leku z powodu działań niepożądanych zdarza się rzadko.

Działania niepożądane pogrupowano ze względu na układy narządów, w obrębie których je obserwowano. Częstość występowania działań niepożądanych została określona w następujący sposób: bardzo często ($\geq 1/10$); często ($\geq 1/100$ do $< 1/10$); niezbyt często ($\geq 1/1000$ do $< 1/100$); rzadko ($\geq 1/10\ 000$ do $< 1/1000$); bardzo rzadko ($< 1/10\ 000$); nieznana (częstość nie może być określona na podstawie dostępnych danych).

Zaburzenia układu nerwowego

Często: senność, spowolnienie reakcji, zawroty głowy, stany splątania i dezorientacji, osłabienie mięśni, ataksja.

Rzadko: ból głowy.

Działania te występują najczęściej na początku leczenia, u pacjentów w podeszłym wieku (patrz punkt 4.4) i z reguły ustępują w czasie trwania dalszej terapii. W przypadku nasilenia tych reakcji odpowiednie zmniejszenie dawki zwykle zmniejsza nasilenie i częstość ich występowania.

Częstość nieznana: dyzartria z mową zamazaną i nieprawidłowym wymawianiem, zaburzenia pamięci (niepamięć następcza), zaburzenia libido.

Ryzyko pojawienia się tych działań niepożądanych jest większe przy wyższych dawkach benzodiazepin.

Zaburzenia oka

Często: zamazane podwójne widzenie.

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej

Częstość nieznana: reakcje alergiczne.

Zaburzenia żołądka i jelit

Częstość nieznana: dyspepsja.

W przypadku wystąpienia dyspepsji dawkę należy zmniejszyć lub odstawić lek.

Zaburzenia nerek i dróg moczowych

Częstość nieznana: zatrzymanie moczu, nietrzymanie moczu.

Zaburzenia mięśniowo-szkieletowe i tkanki łącznej

Częstość nieznana: drżenie mięśni, zwiotczenie mięśni.

Zaburzenia krwi i układu chłonnego

Częstość nieznana: leukopenia, małopłytkowość i agranulocytoza.

Zaburzenia układu immunologicznego

Częstość nieznana: reakcje anafilaktyczne.

Zaburzenia wątroby i dróg żółciowych

Częstość nieznana: zaburzenia czynności wątroby, żółtaczką.

Zaburzenia układu rozrodczego i piersi

Częstość nieznana: zaburzenia miesiączkowania.

Zaburzenia metabolizmu i odżywiania

Częstość nieznana: brak apetytu.

Zaburzenia naczyniowe

Częstość nieznana: niewielkie obniżenie ciśnienia tętniczego krwi.

Zaburzenia ogólne i stany w miejscu podania

Częstość nieznana: ogólne osłabienie, omdlenia.

Zaburzenia psychiczne

Częstość nieznana: reakcje paradoksalne - niepokój psychoruchowy, pobudzenie i agresywność, splątanie, omamy, koszmary senne, urojenia, psychozy, drażliwość, nieodpowiednie zachowanie. Reakcje paradoksalne najczęściej występują po spożyciu alkoholu, u pacjentów w podeszłym wieku i u pacjentów z chorobami psychicznymi.

Uzależnienie fizyczne i psychiczne może rozwinąć się podczas leczenia oksazepamem w dawkach terapeutycznych. Nagłe przerwanie leczenia może wywołać objawy odstawienne tj.: drgawki, drżenia, kolkę jelitową i skurcze mięśniowe, bezsenność, wymioty oraz nadmierną potliwość i bezsenność z odbicia.

Pacjenci nadużywający alkoholu lub leków są bardziej podatni na rozwinięcie się uzależnienia. Podczas leczenia oksazepamem może ujawnić się wcześniej istniejąca, niezdiagnozowana depresja ze skłonnościami samobójczymi.

Ponadto mogą wystąpić: osłupienie, zaburzenia orientacji, gorączka i euforia.

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych

Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych

{aktualny adres, nr telefonu i faksu ww. Departamentu}

e-mail: ndl@urpl.gov.pl

4.9 Przedawkowanie

Objawy łagodnego zatrucia są następujące: senność, splątanie, letarg, ataksja, dyzartria, hipotonia, dyskinezyja; sporadycznie płytkie i krótkotrwałe utraty przytomności.

Objawy ciężkiego zatrucia (zwłaszcza podczas jednoczesnego picia alkoholu lub stosowania produktów leczniczych działających depresyjnie na ośrodkowy układ nerwowy) to: zahamowanie czynności ośrodka oddechowego i układu krążenia, śpiączka a nawet zgon.

Postępowanie: należy wywołać wymioty – tylko u przytomnych pacjentów i (lub) przeprowadzić płukanie żołądka, można podać węgiel aktywny. Następnie należy wdrożyć leczenie objawowe, monitorować podstawowe czynności życiowe i dokładnie obserwować pacjenta. Obniżone ciśnienie tętnicze należy opanować poprzez dożylną podanie płynów i jeśli będzie to wskazane - sympatomimetyków (unikając adrenaliny i jej pochodnych). Antagonistą benzodiazepin jest flumazenil.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: leki przeciwlękowe, pochodne benzodiazepiny, kod ATC: N05BA04.

Oksazepam należy do grupy pochodnych 1,4-benzodiazepiny. Działa na wiele struktur ośrodkowego układu nerwowego, przede wszystkim na układ limbiczny i podwzgórze, czyli struktury związane z regulacją czynności emocjonalnych. Jak wszystkie benzodiazepiny nasila on hamujące działanie neuronów GABA-ergicznych w obrębie kory mózgowej, hipokampu, mózdzku, wzgórza i podwzgórza. Stwierdzono istnienie specyficznych dla benzodiazepin miejsc wiązania, będących białkowymi strukturami błonowymi, mającymi związek z kompleksem złożonym z receptora GABA - A oraz kanału chlorkowego. Działanie oksazepamu polega na zmianie „czułości” receptora GABA ergicznego, co powoduje zwiększenie powinowactwa tego receptora do kwasu gamma aminomasłowego (GABA), który jest endogennym neuroprzekaznikiem hamującym. Następnym efektem aktywacji receptora benzodiazepinowego lub GABA-A jest zwiększenie napływu jonów chlorkowych do wnętrza neuronu przez kanał chlorkowy. Prowadzi to do hiperpolaryzacji błony komórkowej, a w efekcie do zahamowania czynności neuronów. Klinicznie objawia się to działaniem przeciwlękowym i słabiej zaznaczonym działaniem nasennym. Oksazepam wykazuje również słabe działanie rozluźniające napięcie mięśni szkieletowych i przeciwdrgawkowe.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Wchłanianie

Oksazepam dobrze wchłania się z przewodu pokarmowego, biodostępność wynosi 90-95%. Po podaniu pojedynczej dawki doustnej najwyższe stężenie w surowicy osiągnięte jest w ciągu 2,5 godziny.

Dystrybucja

Oksazepam w mniej więcej 87% wiąże się z białkami osocza, objętość dystrybucji w stanie stabilnym wynosi 0,5-1,0 l/kg.

Metabolizm

Oksazepam ulega biotransformacji w wątrobie tworząc połączenia z kwasem glukuronowym, powstają też niewielkie ilości chinazoliny i dihydroksypochodnych wydalanych z moczem. Nie stwierdzono, by metabolity odznaczały się aktywnością farmakologiczną.

Eliminacja

Okres półtrwania oksazepamu wynosi około 8 godzin. Ponad 95% pojedynczej dawki wydalane jest z moczem w postaci metabolitów, mniej niż 2% wydalane jest w postaci niezmienionej.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Brak informacji o przeprowadzeniu długookresowych badań na zwierzętach dotyczących mutagennych i rakotwórczych właściwości oksazepamu.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Laktoza jednowodna
Skrobia ziemniaczana
Sacharoza
Powidon
Wapnia stearynian

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

4 lata

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C.
Przechowywać w oryginalnym opakowaniu w celu ochrony przed światłem i wilgocią.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Blistry z folii PVC/Aluminium w tekturowym pudełku.

10 szt. (1 blister po 10 szt.)
20 szt. (2 blistry po 10 szt.)

6.6 Szczególne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania produktu leczniczego do stosowania

Bez specjalnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Chemiczno-Farmaceutyczna Spółdzielnia pracy ESPEFA
ul. J.Lea 208
30-133 Kraków, Polska
tel. 12 639 27 27

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Pozwolenie nr 10875

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU I DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 22.04.2004 r.
Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 07.07.2014 r.

**10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU
CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO**

07.07.2014 r.