

VALMISTEYHTEENVETO

1. LÄÄKEVALMISTEEN NIMI

Stesolid 2 mg tabletti
Stesolid 5 mg tabletti
Stesolid 10 mg tabletti

2. VAIKUTTAVAT AINEET JA NIIDEN MÄÄRÄT

Yksi tabletti sisältää 2 mg, 5 mg tai 10 mg diatsepaamia.

Ks. apuaineet 6.1.

3. LÄÄKEMUOTO

Tabletti.

Valmisteen kuvaus :

2 mg tabletti: Valkoinen, tasapintainen, jakourteellinen ja päällysteetön tabletti, merkintä ”CCC”.
5 mg tabletti: Valkoinen, tasapintainen, jakourteellinen ja päällysteetön tabletti, merkintä ”CLD”.
10 mg tabletti: Valkoinen, kupera, jakourteellinen tabletti, jossa merkintä CDD.

4. KLIINISET TIEDOT

4.1 Käyttöaiheet

Ahdistuneisuushäiriöiden tavallisiin oireisiin kuten tuskaisuuteen, ahdistuneisuuteen ja levottomuuteen sekä näistä seuraavaan unettomuuteen. Depressioon liittyneinä näitä oireita voidaan hoitaa yhdistettynä antidepressiiviseen lääkitykseen.

Esilääkitys.

Keskushermostoperäiset tai perifeeriset lihasspasmit.

Alkoholiabstinenssioireet, delirium tremens.

4.2 Annostus ja antotapa

Tuskaisuus 2-5 mg x 3/vrk. Vaikeissa tapauksissa sairaalapotilaalle annosta nostetaan tarpeen mukaan 30-60 mg:aan/vrk. Vanhemmat ja heikot potilaat korkeintaan 2 mg x 2/vrk.

Lapset 1-2 mg x 3/vrk.

Unilääkkeenä 2-10 mg iltaisin, vanhuksilla yleensä 2-5 mg. Alle 12-vuotiaille lapsille vain erikoislääkärin valvonnassa. Huolellisesti valvotuissa olosuhteissa unilääkeannosta voidaan nostaa. Hoidon keston tulisi yleensä olla lyhyt. Pääsääntöisesti korkeintaan neljä viikkoa, jolloin hoitajaksoon sisältyy lääkityksen asteittainen lopettaminen. Hoidon tarve olisi arvioitava uudelleen hoidon pitkittyessä tai muodostuessa jatkuvaksi.

4.3 Vasta-aiheet

Myasthenia gravis. Yliherkkyys bentsodiatsepiinille. Vaikea hengitysinsuffiensi. Vaikea uniapnea.

Kts. myös 4.6. Raskaus ja imetys.

4.4 Varoitukset ja käyttöön liittyvät varotoimet

Potilasta tulee informoida siitä, että diatsepaami saattaa vaikuttaa heikentävästi reagoitukykyyn. Lääke voi haitata suorituskykyä liikenteessä. Moottoriajoneuvojen kuljetusta sekä tarkkuutta vaativien ja vaaraa aiheuttavien laitteiden käyttöä tulee välttää varsinkin hoidon alussa.

Diatsepaami alentaa alkoholinsietokykyä ja potentoi muiden sedatiivien ja hypnoottien lamaavaa vaikutusta.

Potilaita on varoitettava mahdollisesta tottumisvaarasta, etenkin jos samanaikaisesti käytetään alkoholia tai muita keskushermostoon vaikuttavia lääkkeitä.

Varovaisuutta tulee noudattaa potilailla, joilla on todettu maksainsuffiensi ja/tai uniapneaa sekä potilailla, joilla on ilmennyt lääkkeisiin liittyvää riippuvuutta tai paradoksaalisia reaktioita bentsodiatsepiinien käytön yhteydessä.

Diatsepaamilääkityksen lopetusvaiheessa on annosta pienennettävä vähitellen vieroitusoireiden ehkäisemiseksi.

4.5 Yhteisvaikutukset muiden lääkevalmisteiden kanssa sekä muut yhteisvaikutukset

Keskushermostoa lamaava vaikutus voimistuu, jos bentsodiatsepiineja käytetään yhdessä alkoholin, antipsykoottien, unilääkkeiden, depressiolääkkeiden, narkoottisten analgeettien, epilepsialääkkeiden ja yleisanestesia-aineiden kanssa. Narkoottisten analgeettien yhteydessä tavattava euforia saattaa voimistua ja lisätä psyykkistä riippuvuutta.

Disulfiraami (Antabus) estää oletettavasti diatsepaamin demetylaation. Tämä saattaa pidentää diatsepaamin puoliintumisaikaa ja aiheuttaa kohenneita pitoisuuksia plasmassa.

Esilääkityksenä annettu diatsepaami pidentää ketamiinin puoliintumisaikaa, jolloin sen vaikutus voimistuu.

Teofylliini heikentää diatsepaamin terapeuttista vaikutusta-

Suoliston motiliteettia lisäävät aineet, kuten metoklopramidi ja sisapridi, nopeuttavat diatsepaamin imeytymistä, jolloin sen vaikutus saattaa väliaikaisesti lisääntyä. Suoliston motiliteettia hidastavat aineet, kuten morfiini ja petidiini, taas hidastavat diatsepaamin imeytymistä.

Ehkäisytabletit, fluvoksamiini, fluoksetiini, erytromysiini, siprofloksasiini, simetidiini, omepratsoli ja esomepratsoli voivat hidastaa diatsepaamin eliminaatiota, jolloin sen pitoisuus plasmassa nousee ja vaikutus voimistuu.

Myös muut sytokromi P450 -entsyymijärjestelmän kautta metaboloituvat aineet voivat vaikuttaa diatsepaamin eliminaatioon.

4.6 Raskaus ja imetys

Diatsepaamia ei suositella käytettäväksi raskauden - etenkin ensimmäisen kolmanneksen -aikana, ellei hoitava lääkäri pidä sitä välttämättömänä.

Eräissä tutkimuksissa on saatu viitteitä lisääntyneestä huulikitalakihalkion esiintymistiheydestä käytettäessä suuria annoksia diatsepaamia toisen ja kolmannen raskauskuukauden aikana. Erityistä

varovaisuutta lääkkeen käytössä on noudatettava myös raskauden kolmen viimeisen kuukauden aikana, koska bentsodiatsepiinien farmakologisten vaikutusten seurauksena saattaa vastasyntyneillä esiintyä haittavaikutuksia, kuten hypotermiaa, hypotoniaa ja lievää tai kohtalaista hengityksen lamaantumista.

Lääkkeen käyttöä ei suositella imettämisen aikana. Äidinmaitoon erittyvät bentsodiatsepiinit voivat väsyttää lasta ja lääkityksen äkillinen lopettaminen voi altistaa lapsen vieroitusoireille.

4.7 Vaikutus ajokykyyn ja koneiden käyttökykyyn

Lääke voi haitata suoriutuskykyä liikenteessä. Mootoriajoneuvojen kuljetusta sekä tarkkuutta vaativien ja vaaraa aiheuttavien laitteiden käyttöä tulee välttää, varsinkin hoidon alussa.

4.8 Haittavaikutukset

Tavallisimpia haittavaikutuksia ovat ihoreaktiot.

Stesolid saattaa aiheuttaa myös uneliaisuutta, lihasheikkouden tunnetta sekä lievää ataksiaa. Nämä oireet häviävät useimmiten hoitoa jatkettaessa tai annosta vähennettäessä. Muistihäiriöt vanhuksilla ovat mahdollisia. Muutama harvinainen paradoksaalinen reaktio on raportoitu.

Harvoissa tapauksissa Stesolid voi aiheuttaa hengityslamaa. Äkillinen hoidon keskeyttäminen pitkäaikaishoidossa isoin annoksin saattaa aiheuttaa withdrawal-syndrooman, joskus vasta 10 vrk hoidon lopettamisen jälkeen. Kuten kaikkia hypnootteja, sedatiiveja ja atarakteja käytettäessä saattaa alttiille potilaille kehittyä pitkäaikaishoidossa ja käytettäessä suuria annoksia lääkeainetoleranssia ja -riippuvuutta.

4.9 Yliannostus

Stesolid on lähes atoksinen terapeuttisina annoksina. Erittäin huomattavat yliannokset aiheuttavat hypotensiota, hengitysdepressiota ja kooman. Yliannostuksen hoitona on vatsahuuhtelu, lääkehiili sekä muuten oireenmukainen hoito.

Antagonisti on flumatseniili.

5. FARMAKOLOGISET OMINAISUUDET

Farmakoterapeuttinen ryhmä: bentsodiatsepiinijohdokset, ATC-koodi: N05BA01

5.1 Farmakodynamiikka

Diatsepaami on bentsodiatsepiinijohdos, jonka farmakologiset vaikutukset kohdistuvat pääasiassa keskushermostoon. Stesolid vaikuttaa anksiolyyttisesti, sedatiivisesti, amnestisesti, hypnoottisesti, antikonvulsiivisesti ja lihaksia relaxoivasti. Sen vaikutus on sentraalinen. Aivoissa Stesolid sitoutuu bentsodiatsepiinireseptoreihin, joita on erityisesti limbisessä järjestelmässä, corpus amygdaloidumissa ja frontaalisisessä korteksissa.

5.2 Farmakokinetiikka

Stesolid imeytyy hyvin gastrointestinaalialueelta, ja seerumin huippupitoisuudet saavutetaan 60-90 minuutissa. Vaikuttava aine jakaantuu kaikkialle elimistöön läpäisten veri-aivoesteen nopeasti. Diatsepaami erittyy äidinmaitoon ja läpäisee istukan. Veressä 96-98 % sitoutuu plasman proteiineihin.

Metaboloituminen tapahtuu maksassa, ja päämetaboliitti, desmetyylidiatsepaami, on farmakologisesti aktiivinen. Metaboliitit erittyvät virtsan kautta glukuronideina tai sulfaatteina. Saperi kautta erittyy vain vähäinen määrä. Puoliintumisaika on yksilöllinen (n.50 h) ja pidentyy iän mukana. Päämetaboliitin, desmetyylidiatsepaamin, puoliintumisaika on melkein kaksi kertaa pidempi.

5.3. Prekliiniset tiedot turvallisuudesta

Ei tietoja.

6. FARMASEUTTISET TIEDOT

6.1 Apuaineet

Laktoosimonohydraatti, perunatärkkelys, esigelatinoitu tärkkelys, polysorbaatti 80, mikrokiteinen selluloosa, magnesiumstearaatti ja talkki.

6.2 Yhteensopimattomuudet

Ei ole.

6.3 Kestoaika

5 vuotta.

6.4 Säilytys

Huoneenlämmössä (+15-25°C)

6.5 Pakkaustyyppi ja pakkauskoot

30 ja 100 tabl. muovipurkissa (PE).

Kaikkia pakkauskokoja ei välttämättä ole myynnissä.

6.6 Käyttö- ja käsittelyohjeet

Ei erityisiä ohjeita.

7. MYYNTILUVAN HALTIJA

Actavis Group hf.
Reykjavikurvegi 76-78
220 Hafnarfjordur
Islanti

8. MYYNTILUVAN NUMERO

2 mg: 9935
5 mg: 9936
10 mg: 9937

9. MYYNTILUVAN MYÖNTÄMISPÄIVÄMÄÄRÄ/UUDISTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ

5.4.1989/9.7.2003

10. TEKSTIN MUUTTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ

3.10.2007