

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Сибазон, 5 мг, таблетки.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: диазепам.

Каждая таблетка содержит 5 мг диазепама (сибазона).

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактоза (см. раздел 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки.

Двояковыпуклые таблетки белого или белого со слабым желтоватым оттенком цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Лекарственный препарат Сибазон показан к применению взрослыми пациентами с 18 лет для кратковременного лечения невротических и неврозоподобных расстройств с проявлением тревоги, которые могут быть также связаны с бессонницей; купирования психомоторного возбуждения, связанного с тревогой; купирования эпилептических припадков и судорожных состояний различной этиологии (в сочетании с другими противосудорожными препаратами); для применения при состояниях, сопровождающихся повышением мышечного тонуса (столбняк, при острых нарушениях мозгового кровообращения и т.п.); купирования абстинентного синдрома; для премедикации и атаралгезии в сочетании с анальгетиками и другими нейротропными препаратами при различных диагностических процедурах, в хирургической практике.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования и продолжительность курса лечения определяется врачом в зависимости от состояния и реакция пациента.

Режим дозирования

В качестве анксиолитика: 5-10 мг в сутки, в 2-4 приема. Продолжительность лечения не должна превышать 4 недель, в тяжелых случаях допускается продление лечения до 8-12 недель, включая время постепенного прекращения приема препарата.

При бессоннице: 5-15 мг в разовой дозе перед сном. Продолжительность лечения не должна превышать 4 недель.

Как противосудорожное средство: 5-10 мг в сутки, в 2-4 приема. Продолжительность лечения не должна превышать 4 недель.

Для снятия спазмов скелетных мышц: 5-10 мг в сутки, в 3-4 приема. Продолжительность лечения не должна превышать 4 недель.

При алкогольном абстинентном синдроме: 10 мг 3-4 раза в первые 24 часа, затем (если необходимо) 5 мг 3-4 раза в сутки. Продолжительность лечения не должна превышать 4 недель.

Для премедикации: 5-20 мг в разовой дозе или в разделенных дозах в течение 1-2 дней перед хирургическим вмешательством.

Максимальная суточная доза 60 мг/сутки (в комплексной терапии эпилепсии, часто при спастических состояниях).

Продолжительность лечения

Продолжительность лечения диазепамом следует ограничить до минимума; она не должна превышать 4 недель, в случае состояний тревоги в тяжелых случаях допускается продление лечения до 8-12 недель, включая время постепенного прекращения приема препарата. Не следует продлевать лечение без повторной оценки состояния пациента.

Наиболее безопасным способом отмены бензодиазепинов является применение лекарственного препарата в постепенно уменьшающихся дозах строго под наблюдением врача.

Схема дозирования при постепенной отмене терапии бензодиазепинов:

У пациентов, принимающих менее 40 мг диазепама в сутки, следует действовать по схеме уменьшения дозы бензодиазепамина, предназначенной «для низких доз»

Пациенты, применяющие диазепам в дозе менее 40 мг/сутки				
	Время приема дозы диазепама			Общая суточная доза
	8:00	12:00	20:00	
Исходная доза	5 мг	5 мг	5 мг	15 мг
1 уменьшение дозы	5 мг	2,5 мг	5 мг	12,5 мг
2 уменьшение дозы	5 мг	-	5 мг	10,0 мг
3 уменьшение дозы	2,5 мг	-	5 мг	7,5 мг
4 уменьшение дозы	-	-	5 мг	5 мг
5 уменьшение дозы	-	-	2,5 мг	2,5 мг

У пациентов, принимающих 40 мг диазепама в сутки или более, следует действовать по схеме уменьшения дозы бензодиазепамина, предназначенной «для высоких доз»

Пациенты, применяющие диазепам в дозе 40 мг/сутки или более					
	Время приема дозы диазепама				Общая суточная доза
	8:00	12:00	17:00	21:00	
Исходная доза	10 мг	10 мг	10 мг	10 мг	40 мг
1 уменьшение дозы	10 мг	5 мг	5 мг	10 мг	30 мг
2 уменьшение дозы	5 мг	-	5 мг	10 мг	20 мг
3 уменьшение дозы	-	-	-	10 мг	10 мг
4 уменьшение дозы	-	-	-	5 мг	5 мг

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Диазепам необходимо применять с осторожностью у пациентов пожилого возраста. Лицам пожилого возраста следует назначать не более половины обычной дозы, рекомендованной взрослым. Если необходимо, дозу можно постепенно увеличить (при условии хорошей переносимости препарата).

Пациенты с нарушением функции почек или печени

Рекомендуется уменьшение дозы препарата. Доза подбирается индивидуально в зависимости от степени печеночной или почечной (клиренс креатинина) недостаточности.

Дети

Противопоказан у детей в возрасте до 18 лет.

Способ применения

Внутрь, запивая небольшим количеством воды.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к диазепаму, другим бензодиазепинам или любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.;
- кома;
- шок;
- острая алкогольная интоксикация с ослаблением жизненно важных функций, острые интоксикации лекарственными средствами, оказывающими угнетающее действие на центральную нервную систему (в том числе наркотические анальгетики и снотворные лекарственные средства);
- острые заболевания печени и почек;
- тяжелая печеночная недостаточность;
- тяжелая миастения;
- закрытоугольная глаукома (острый приступ или предрасположенность);
- порфирия;
- нарушение дыхания и сознания центрального происхождения;
- синдром ночного апноэ;
- тяжелая хроническая обструктивная болезнь легких (опасность прогрессирования дыхательной недостаточности);
- острая или тяжелая дыхательная недостаточность;
- гипертрофия предстательной железы;
- диазепам не должен применяться в качестве монотерапии у пациентов с депрессивными или тревожными расстройствами, так как применение диазепама может спровоцировать суицидальное поведение;
- наследственная непереносимость галактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- беременность (особенно I, II триместры);
- период грудного вскармливания;
- детский возраст до 18 лет.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

- эпилепсия или эпилептические припадки в анамнезе (начало лечения диазепамом или его резкая отмена могут ускорять развитие припадков или эпилептического статуса);
- печеночная и/или почечная недостаточность (при длительном лечении необходим контроль картины периферической крови и активности «печеночных» ферментов);
- церебральные и спинальные атаксии;
- гиперкинезы;
- аддиктивные расстройства (алкогольная зависимость, лекарственная зависимость) в том числе в анамнезе;
- органические заболевания головного мозга;
- психоз (возможны парадоксальные реакции);
- гипопротеинемия;
- пожилой возраст.

Особые указания

Общая информация, касающаяся наблюдаемых эффектов после лечения бензодиазепинами и другими препаратами подобного действия, которую следует учитывать при назначении диазепама.

Толерантность

Регулярное применение бензодиазепинов (в том числе диазепама) может привести к ослаблению их действия.

Лекарственная зависимость

Применение бензодиазепинов может привести к развитию психической и физической лекарственной зависимости. Риск развития лекарственной зависимости увеличивается вместе с дозой и продолжительностью лечения, и возрастает у пациентов с алкогольной зависимостью, а также у пациентов с зависимостью к лекарственным препаратам в анамнезе.

Синдром «отмены»

Резкое прекращение применения диазепама может привести к возникновению синдрома «отмены», характерными проявлениями которого являются: головные и мышечные боли, тревожность, напряженность, спутанность сознания, раздражительность, бессонница, а в тяжелых случаях – дереализация, деперсонализация, гиперacusия, светобоязнь, тактильная гиперчувствительность, парестезии конечностей, галлюцинации и приступы судорог.

Бессонница по типу «рикошета»

После окончания лечения может наступить преходящий рецидив симптомов в более выраженной форме, чем те, которые были причиной первоначального лечения (так называемая бессонница по типу «рикошета»). Этим симптомам часто сопутствуют изменения настроения, тревога, беспокойство, расстройства сна и бессонница.

Пациент должен быть проинформирован о возможности возникновения бессонницы по типу «рикошета». Эта информация уменьшит его беспокойство в случае, если такие симптомы появятся после прекращения применения препарата.

Вероятность развития синдрома «отмены» или появления бессонницы по типу «рикошета» возрастает при резком прекращении применения препарата. Для уменьшения риска развития этих симптомов рекомендуется постепенное уменьшение дозы.

Антероградная амнезия

Диазепам, также как другие бензодиазепины и подобные препараты, может вызвать антероградную амнезию. Такое состояние возникает чаще всего через несколько часов после приема препарата, особенно в большой дозе. Симптомы амнезии могут сопровождаться неадекватным к ситуации поведением. Для снижения риска возникновения антероградной амнезии рекомендуется принимать препарат за полчаса до сна и обеспечить условия для непрерывного сна в течение 7-8 часов.

Психические и парадоксальные реакции

Применение диазепама может вызывать неправильные (противоположные ожидаемым) психические и парадоксальные реакции, такие как: беспокойство, возбуждение, раздражительность, агрессивность, озлобление, ночные кошмары, галлюцинации, психозы, сомнамбулизм, нарушения личности и другие поведенческие расстройства. Эти реакции значительно чаще наблюдаются у пожилых пациентов и у пациентов с алкогольной зависимостью.

В случае появления таких симптомов необходимо сразу же прекратить прием препарата.

Специфические группы пациентов

Пациентам пожилого возраста рекомендуется назначать меньшие дозы, в связи с возможным усилением нежелательных реакций, главным образом расстройств ориентации и координации движений (падения, травмы).

Не рекомендуется применять бензодиазепины у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью, так как они могут ускорять развитие печеночной энцефалопатии. Необходимо с осторожностью применять препарат у пациентов с хронической дыхательной недостаточностью, так как установлено, что бензодиазепины могут оказывать угнетающее влияние на дыхательный центр.

Начало лечения диазепамом или его резкая отмена у пациентов с эпилепсией или с эпилептическими припадками могут ускорять развитие припадков или эпилептического статуса.

Не рекомендуется применять бензодиазепины и подобные препараты у пациентов с психозами.

Диазепам следует применять с большой осторожностью у пациентов с симптомами депрессии. У этих пациентов могут проявляться суицидальные наклонности. В связи с возможностью умышленной передозировки, этим пациентам следует назначать бензодиазепины настолько это возможно, в наименьших дозах.

Бензодиазепины не должны применяться в монотерапии депрессии или тревоги, связанной с депрессией. Мототерапия этими препаратами может усилить суицидальные тенденции.

В случае потери близких или траура бензодиазепины могут замедлять психологическое осознание и принятие ситуации.

Бензодиазепины и подобные препараты необходимо с большой осторожностью применять у пациентов с алкогольной, лекарственной и наркотической зависимостью в анамнезе. Такие пациенты во время лечения должны находиться под строгим контролем, т.к. входят в группу риска развития привыкания и психической зависимости.

Диазепам необходимо с осторожностью применять у пациентов с порфирией. Применение диазепама может вызвать усиление симптомов этой болезни.

С осторожностью следует применять диазепам у пациентов с глаукомой (возможно применение у пациентов с открытоугольной формой глаукомы, которые получают соответствующее лечение, но противопоказан при закрытоугольной форме глаукомы).

Во время продолжительной терапии показаны периодические исследования крови (морфология с мазком) и функциональные пробы печени.

Во время лечения диазепамом и в течение 3 дней после его завершения нельзя употреблять никаких спиртных напитков.

Вспомогательные вещества

Препарат содержит лактозу. Пациентам редко с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот препарат.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Диазепам усиливает угнетающее действие на центральную нервную систему этанола, седативных и антипсихотических лекарственных средств (нейролептиков), антидепрессантов, наркотических анальгетиков, лекарственных средств для общей анестезии, миорелаксантов.

Премедикация диазепамом позволяет снизить дозу фентанила, требующуюся для вводной общей анестезии, и уменьшить время, необходимое для «выключения» сознания с помощью индукционных доз.

Ингибиторы микросомальных ферментов печени (в том числе циметидин, пероральные контрацептивы, эритромицин, дисульфирам, флуоксетин, изониазид, кетоконазол, метопролол, пропранолол, пропоксифен, вальпроевая кислота) удлиняют $T_{1/2}$ и усиливают действие диазепама.

Индукторы микросомальных ферментов печени (рифампицин, карбамазепин, кофеин) уменьшают эффективность диазепама.

Ингибиторы моноаминоксидазы, аналептики, психостимуляторы снижают эффективность диазепама.

Наркотические анальгетики усиливают эйфорию, приводя к нарастанию психической зависимости.

Антацидные лекарственные средства уменьшают скорость всасывания диазепама из желудочно-кишечного тракта, но не его полноту.

Омепразол удлиняет время выведения диазепама.

Гипотензивные лекарственные средства могут усиливать выраженность снижения артериального давления.

На фоне одновременного применения клозапина возможно усиление угнетения дыхания.

При одновременном применении с низкополярными сердечными гликозидами (дигитоксин) возможно увеличение концентрации последних в сыворотке крови и развитие гликозидной интоксикации (в результате конкуренции за связь с белками плазмы).

Снижает эффективность леводопы у пациентов с паркинсонизмом.

Диазепам может повышать токсичность зидовудина.

Рифампицин может усиливать выведение диазепама и понижать его концентрации в плазме.

Теофиллин (применяемый в низких дозах) может уменьшать или даже извращать седативное действие.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Применение препарата в период беременности допускается только в том случае, если использование у матери имеет абсолютные показания, а применение более безопасного, альтернативного средства невозможно или противопоказано.

Диазепам оказывает токсическое действие на плод и увеличивает риск развития врожденных пороков при применении в I триместре беременности. Прием терапевтических доз в более поздние сроки беременности может привести к физической зависимости – возможен синдром «отмены» у новорожденного.

При применении Сибазона в дозах более 30 мг в течение 15 часов до родов или во время родов может вызывать у новорожденного угнетение дыхания (до апноэ), снижение мышечного тонуса, снижение артериального давления, гипотермию, слабый акт сосания (синдром «вялого ребенка»).

Лактация

Препарат противопоказан в период лактации. При необходимости применения диазепама у женщин в период грудного вскармливания следует прекратить кормление грудью для предотвращения развития нежелательных реакций у младенцев.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

В период лечения следует воздержаться от вождения автотранспорта и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Частота возникновения побочных эффектов определялась в соответствии с классификацией Всемирной Организации Здравоохранения: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

очень редко: нарушения морфологического состава крови – нейтропения (при длительном применении рекомендуется периодический контроль состава крови), лейкопения, агранулоцитоз, анемия, тромбоцитопения.

Нарушения со стороны иммунной системы

очень редко: анафилактические реакции.

Нарушения метаболизма и питания

нечасто: отсутствие аппетита.

Психические нарушения

очень редко: парадоксальные реакции – психомоторное возбуждение, бессонница, повышенное возбуждение и агрессивность, мышечный тремор, судороги. Парадоксальные

реакции чаще всего наблюдаются после употребления алкоголя, у пожилых пациентов и у пациентов с психическими заболеваниями.

Психическая и физическая зависимость может развиваться при лечении диазепамом в терапевтических дозах в течение 2-3 недель. Резкое прекращение приема препарата может привести к синдрому «отмены». Пациенты, злоупотребляющие алкоголем или лекарственными средствами, более предрасположены к развитию лекарственной зависимости.

Во время лечения диазепамом может выявиться имеющаяся недиагностированная депрессия.

Нарушения со стороны нервной системы

часто: сонливость, замедление реакции, головная боль и головокружение, спутанность сознания и дезориентация, атаксия. Эти эффекты чаще всего наблюдаются в начале лечения, у пациентов пожилого возраста (см. раздел 4.4.) и, как правило, исчезают в течение продолжающейся терапии. В случае усиления этих реакций, соответствующее уменьшение дозы обычно снижает их выраженность и частоту.

редко: после приема препарата в больших дозах – дизартрия с невнятной речью и неправильным произношением, нарушения памяти, каталепсия, гипорефлексия.

Нарушения со стороны органа зрения

нечасто: нарушения зрения (нечеткое зрение, диплопия, нистагм).

Нарушения со стороны сердца

нечасто: боль в грудной клетке, брадикардия.

Нарушения со стороны сосудов

нечасто: незначительное снижение артериального давления.

Желудочно-кишечные нарушения

нечасто: запор, тошнота, желудочные расстройства, чувство сухости во рту, гастралгия.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

очень редко: желтуха (при длительном применении рекомендуется периодический контроль функции печени), нарушения функции печени, незначительное повышение активности аланинаминотрансферазы (АЛТ), аспартатаминотрансферазы (АСТ) и щелочной фосфатазы.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

редко: кожные аллергические реакции (сыпь, зуд, крапивница).

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани

нечасто: мышечный тремор, мышечная слабость.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

нечасто: недержание мочи, задержка мочи, нарушения функции почек.

Беременность, послеродовой период и перинатальные состояния

частота неизвестна: тератогенность (особенно I триместр), угнетение центральной нервной системы (ЦНС), нарушение дыхания и подавление сосательного рефлекса у новорожденных, матери которых применяли препарат.

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез

нечасто: нарушения менструального цикла, повышение или снижение либидо.

Общие нарушения и реакции в месте введения

часто: общая слабость, утомляемость, ощущение усталости, обморок.

Описание отдельных нежелательных реакций

При длительном применении бензодиазепинов изменяется переносимость этих препаратов; могут развиваться признаки психической или физической зависимости. Риск развития зависимости выше при использовании высоких доз и длительном применении препаратов.

При резком прекращении применения диазепама развиваются симптомы синдрома «отмены» (судороги, тремор, спазмы в животе и мышцах, рвота, потливость). Чаще всего эти симптомы развиваются после длительного применения высоких доз. Более легкие симптомы (дисфория, бессонница) отмечаются после внезапной отмены бензодиазепинов, принимавшихся в терапевтических дозах в течение нескольких месяцев.

Следует избегать резкой отмены препарата при его длительном применении, при этом суточная доза должна уменьшаться постепенно.

При развитии тяжелых побочных эффектов лечение должно быть прекращено.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, строение 1

Телефон: 8 (800) 550-99-03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:
<https://www.roszdravnadzor.gov.ru>

4.9. Передозировка

Симптомы

Сонливость, спутанность сознания, нарушение координации движений, дизартрия, нарушение зрения (нистагм), а в случае значительной передозировки: атаксия, снижение рефлексов, снижение артериального давления, угнетение сердечной и дыхательной деятельности, апноэ, кома.

Опасными для жизни могут оказаться отравления, вызванные одновременным применением диазепама с другими лекарственными средствами, угнетающими ЦНС, или прием диазепама с алкоголем.

Лечение

Мониторинг основных жизненных функций (дыхание, пульс, артериальное давление), мероприятия, направленные на быструю элиминацию из организма еще невсосавшегося лекарственного препарата или уменьшение его всасывания в пищеварительном тракте (промывание желудка, прием активированного угля, рвота – только у пациентов в сознании). При необходимости, в случае возникновения симптомов сердечной и дыхательной

недостаточности, применяют симптоматическое лечение. Специфическим антидотом является флумазенил (антагонист бензодиазепиновых рецепторов). Флумазенил не рекомендуется применять у пациентов с эпилепсией (может спровоцировать развитие эпилептических припадков).

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: психолептики; анксиолитики; производные бензодиазепина.

Код АТХ: N05BA01.

Механизм действия, фармакодинамические эффекты

Диазепам относится к группе производных бензодиазепина. Препарат действует на многие структуры центральной нервной системы.

Клиническое действие диазепама проявляется выраженным анксиолитическим и противосудорожным действием; несколько слабее выражен снотворный и центральный миорелаксирующий эффект.

Механизм действия диазепама тесно связан с тормозным эндогенным нейромедиатором гамма-аминомасляной кислотой (ГАМК) и рецептором ГАМК-А, через который нейромедиатор реализует свои эффекты в центральной нервной системе.

Как и все другие бензодиазепины, диазепам усиливает тормозное влияние ГАМК-ергических нейронов в центральной нервной системе. Стимулирует бензодиазепиновые рецепторы, расположенные в аллостерическом центре постсинаптических ГАМК-рецепторов восходящей активирующей ретикулярной формации ствола головного мозга и вставочных нейронов боковых рогов спинного мозга (лимбическая система, таламус, гипоталамус), тормозит полисинаптические спинальные рефлексy.

Анксиолитическое действие обусловлено влиянием на миндалевидный комплекс лимбической системы и проявляется в уменьшении эмоционального напряжения, ослаблении тревоги, страха, беспокойства.

Седативный эффект обусловлен влиянием на ретикулярную формацию ствола головного мозга и неспецифические ядра таламуса и проявляется уменьшением симптоматики невротического происхождения (тревоги, страха).

Основной механизм снотворного действия заключается в угнетении клеток ретикулярной формации ствола головного мозга.

Противосудорожное действие реализуется путем усиления пресинаптического торможения. Подавляется распространение эпилептогенной активности, но не снимается возбужденное состояние очага.

Центральное миорелаксирующее действие обусловлено торможением полисинаптических спинальных афферентных тормозящих путей (в меньшей степени и моносинаптических). Возможно и прямое торможение двигательных нервов и функции мышц.

Обладая умеренной симпатолитической активностью, может вызывать снижение артериального давления и расширение коронарных сосудов. Повышает порог болевой чувствительности. Подавляет симпатoadреналовые и парасимпатические (в т.ч. вестибулярные) пароксизмы. Снижает ночную секрецию желудочного сока.

Действие препарата наблюдается к 2-7 дню лечения.

На продуктивную симптоматику психотического генеза (острые бредовые, галлюцинаторные, аффективные расстройства) практически не влияет, редко наблюдается уменьшение аффективной напряженности, бредовых расстройств.

При абстинентном синдроме при хроническом алкоголизме вызывает ослабление ажитации, тремора, негативизма, а также алкогольного делирия и галлюцинаций.

Терапевтический эффект у пациентов с кардиалгиями, аритмиями и парестезиями наблюдается к концу 1 недели.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Абсорбция высокая. После приема внутрь всасывается около 75 %. Клинические эффекты проявляются через полчаса после приема препарата, а максимальная концентрация (C_{max}) в плазме достигается через 2 часа, равновесная концентрация (C_{ss}) достигается при постоянном приеме через 1-2 недели. Диазепам действует длительное время в течение около 12 часов. Биодоступность – 90 %.

Распределение

Связывание с белками плазмы крови составляет 94-99 %, причем у мужчин обычно выше, чем у женщин.

Диазепам и его метаболиты проникают через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, обнаруживаются в грудном молоке в концентрациях, соответствующих 1/10 части концентраций в плазме.

Биотрансформация

Диазепам метаболизируется в печени с участием изоферментов CYP2C19, CYP3A4, CYP3A5 и CYP3A7. 98-99 % до фармакологически высокоактивного производного (десметилдiazепама) и менее активных (темазепам и оксазепам).

Элиминация

Выводится почками – 70 % (в виде глюкуронидов), в неизменном виде – 1-2 % и менее 10 % – с каловыми массами. Выведение имеет двухфазный характер: за первоначальной фазой быстрого и активного распределения ($T_{1/2}$ – 3 часа) следует продолжительная фаза ($T_{1/2}$ – 20-70 часов). Период полувыведения ($T_{1/2}$) десметилдiazепама – 30-100 часов, темазепам – 9,5-12,4 часа и оксазепам – 5-15 часов.

При повторном применении накопление диазепамa и его активных метаболитов значительное. Диазепам относится к бензодiazепинам с длительным периодом полувыведения, выведение после прекращения лечения – медленное, так как метаболиты сохраняются в крови в течение нескольких дней или даже недель.

Почечная недостаточность

Период полувыведения может удлиняться у пациентов с почечной недостаточностью (до 4 суток).

Печеночная недостаточность

Период полувыведения может удлиняться у пациентов с печеночной недостаточностью (до 4 суток).

Лица пожилого возраста

Период полувыведения может удлиняться у пациентов пожилого и старческого возраста (до 100 часов).

Дети

Период полувыведения может удлиняться у новорожденных (до 30 часов).

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Лактозы моногидрат

Крахмал картофельный

Повидон (поливинилпирролидон низкомолекулярный медицинский)

Кальция стеарата моногидрат

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

5 лет.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Препарат относится к Списку III перечня наркотических средств, психотропных веществ и их прекурсоров, подлежащих контролю в Российской Федерации.

Хранить в оригинальной упаковке (пачке) при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной или гибкой упаковки на основе алюминиевой фольги.

1, 2 или 5 контурных ячейковых упаковок с листком-вкладышем в пачку из картона.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Препарат подлежит предметно-количественному учету.

Весь оставшийся лекарственный препарат и отходы следует уничтожить в установленном порядке.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

Федеральное государственное унитарное предприятие «Московский эндокринный завод»

109052, г. Москва, вн.тер.г. муниципальный округ Нижегородский, ул. Новохохловская, д. 25, стр. 1

Тел.: +7 (495) 678-00-50

Факс: +7 (495) 911-42-10

Адрес электронной почты: mez@endopharm.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

Федеральное государственное унитарное предприятие «Московский эндокринный завод»

109052, г. Москва, вн.тер.г. муниципальный округ Нижегородский, ул. Новохохловская,
д. 25, стр. 1

Тел.: +7 (495) 678-00-50

Факс: +7 (495) 911-42-10

Адрес электронной почты: pv@endopharm.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Сибазон доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <https://ees.eaeunion.org/>.