

SOUHRN ÚDAJŮ O PŘÍPRAVKU

1. NÁZEV PŘÍPRAVKU

Akineton 2 mg tablety

2. KVALITATIVNÍ A KVANTITATIVNÍ SLOŽENÍ

Biperideni hydrochloridum 2 mg v jedné tabletě

Pomocná látka se známým účinkem: monohydrát lakózy 38 mg v jedné tabletě.

Úplný seznam pomocných látek viz bod 6.1.

3. LÉKOVÁ FORMA

Tableta

Popis přípravku: bílé, kulaté tablety s dělicím křížem na jedné straně, na druhé straně hladké.

Tabletu lze rozdělit na stejné dávky.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikace

Přípravek se užívá k léčbě parkinsonismu, rigidity a tremoru, k léčbě extrapyramidových symptomů, např. časně dyskineze, akatizie a obtíží podobných Parkinsonově nemoci navozených neuroleptiky a obdobně působícími léky. Dále se přípravek užívá k léčbě jiných extrapyramidových poruch pohybu, jako jsou např. dystonie, Meigeho syndrom, blefarospasmus nebo spastická šíje.

4.2 Dávkování a způsob podání

Dávkování

Léčba přípravkem Akineton se stanoví individuálně, zahajuje se obvykle nejnižší dávkou a ta se pozvolna zvyšuje až k dosažení očekávaných léčebných účinků. Zkušenosti s použitím přípravku Akineton u pediatrických pacientů jsou omezené a vztahují se hlavně ke krátkodobé léčbě léky vyvolané dystonie.

Parkinsonova nemoc

Terapie dospělých se zahajuje dávkou 1 mg 2x denně. Dávka se může zvýšit až o 2 mg denně. Obvyklá dávka je 2 mg 3 - 4krát denně. Maximální denní dávka je 16 mg. Denní dávka by se měla rozdělit rovnoměrně v průběhu dne.

Extrapyramidové poruchy vyvolané léky

Dospělí užívají podle stupně poruchy jako doprovodnou medikaci k neuroleptiku 1 – 4 mg 1 až 4krát denně.

Děti ve věku 3 až 15 let užívají jako doprovodnou medikaci k neuroleptiku 1 – 2 mg 1 až 3krát denně.

Způsob podání

Akineton se užívá s trochou tekutin v průběhu jídla nebo nejlépe těsně po něm. Podle onemocnění a jeho průběhu se může jednat buď o terapii krátkodobou (např. při extrapyramidových příznacích navozených

centrálně působícími léky) nebo o terapii dlouhodobou (Parkinsonova nemoc). Léčba přípravkem Akineton by měla být ukončena pozvolna.

4.3 Kontraindikace

Hypersenzitivita na léčivou látku nebo na kteroukoli pomocnou látku uvedenou v bodě 6.1.
Pacienti s neléčeným glaukomem s úzkým úhlem, stenózami v oblasti gastrointestinálního traktu, megakolonem nebo s neprůchodností střev (ileus).
Akineton se nesmí podávat kojícím ženám.

4.4 Zvláštní upozornění a opatření pro použití

Jen s opatrností je možno Akineton podávat nemocným s adenomem prostaty, retencí moči, thyreotoxikózou, srdečním selháním a s onemocněními, která mohou vést k závažné tachykardii.

U starších nemocných, zejména u nemocných s organickým poškozením mozku, se doporučuje pečlivá kontrola. Při léčbě se doporučuje pravidelně kontrolovat nitrooční tlak.

Přípravek obsahuje laktózu. Pacienti se vzácnými dědičnými problémy s intolerancí galaktózy, úplným nedostatkem laktázy nebo malabsorpcí glukózy a galaktózy nemají tento přípravek užívat.

4.5 Interakce s jinými léčivými přípravky a jiné formy interakce

Kombinace s jinými anticholinergně působícími léky jako jsou např. některá psychofarmaka, antihistaminika, antiparkinsonika a spasmolytika mohou vést k zesílení centrálních i periferních nežádoucích účinků. Při současném užívání chinidinu může dojít k zesílení anticholinergního účinku (zejména na AV převod). Dyskineze může být při současném podání levodopy a biperidenu zesílena, při současném užívání levodopy/karbidopy byly hlášeny generalizované choreatické pohyby.

Při léčbě neuroleptiky mohou být tardivní dyskineze přípravkem Akineton zesíleny. Občas jsou parkinsonské příznaky při výskytu tardivních dyskinezi tak závažné, že anticholinergní léčba zůstává nadále nezbytná. Anticholinergika mohou zvýšit nežádoucí účinky petidinu na centrální nervovou soustavu.

Vlivem přípravku Akineton může dojít ke zvýšení účinku alkoholu.

Účinek metoklopramidu je biperidenem zeslaben.

4.6 Fertilita, těhotenství a kojení

Těhotenství

Není známo, zda může biperiden způsobit poškození plodu, pokud je podáván těhotné ženě, nebo zda může ovlivnit schopnost reprodukce. Biperiden se má těhotné ženě podávat pouze, pokud je to nezbytně nutné. Pro nedostatečné zkušenosti v těhotenství, zejména v prvních třech měsících, se indikuje Akineton pouze v případě, že jeho přínos pro matku převýší možné riziko pro plod.

Kojení

Anticholinergika mohou snížit tvorbu a sekreci mateřského mléka. O přípravku Akineton nejsou v tomto směru dosud k dispozici žádné údaje. Protože léčivá látka přípravku Akineton přechází do mateřského mléka a může zde dosahovat stejných koncentrací jako v plazmě matky, je nutné při podávání přípravku Akineton přerušit kojení.

4.7 Účinky na schopnost řídit a obsluhovat stroje

Nežádoucí účinky na centrální nervový systém i na periférii mohou vést - zejména v kombinaci s jinými centrálně působícími léky, jinými anticholinergiky nebo alkoholem - ke snížení schopnosti řídit motorová vozidla a obsluhovat stroje. O vykonávání těchto činností rozhodne lékař individuálně.

4.8 Nežádoucí účinky

Nežádoucí účinky uvedené v následujícím soupisu jsou seřazeny podle tříd orgánových systémů a frekvence podle databáze MedDRA. Skupiny frekvencí jsou definovány podle následující konvence:

Velmi časté	($\geq 1/10$)
Časté	($\geq 1/100$ až $< 1/10$)
Méně časté	($\geq 1/1000$ až $< 1/100$)
Vzácné	($\geq 1/10000$ až $< 1/1000$)
Velmi vzácné	($< 1/10000$)
Není známo	(z dostupných údajů nelze určit)

Nežádoucí účinky se mohou vyskytnout zejména na začátku léčby, a v případě příliš rychlého zvyšování dávky. Vzhledem k tomu, že počet uživatelů není znám, procento výskytu spontánně hlášených nežádoucích účinků nelze přesně určit.

Infekce a infestace

Není známo: Parotitida.

Poruchy imunitního systému

Velmi vzácné: Hypersenzitivita.

Psychiatrické poruchy

Vzácné: Rozrušení, neklid, strach, zmatenost, delirium, halucinace a nespavost ve vyšších dávkách. Centrální excitační účinky jsou často pozorovány u pacientů s příznaky cerebrální nedostatečnosti a mohou vyžadovat snížení dávky. Hlášeno bylo přechodné zkrácení doby REM fáze spánku (fáze spánku s rychlými očními pohyby) s charakteristickým prodloužením doby nutné k dosažení této fáze a procentuálním zkrácením délky této fáze během celkové doby spánku.

Velmi vzácné: Nervozita, euforie.

Poruchy nervového systému

Vzácné: Únava, závrať a poruchy paměti.

Velmi vzácné: Bolest hlavy, dyskineze, ataxie a poruchy řeči, zvýšené sklony k mozkovým záchvatům a křečím.

Poruchy oka

Velmi vzácné: Poruchy akomodace, mydriáza a fotosenzitivita. Může se vyskytnout i glaukom s uzavřeným úhlem (ovlivňující nitrooční tlak).

Srdeční poruchy

Vzácné: Tachykardie

Velmi vzácné: Bradykardie. Po parenterálním podání může dojít k poklesu krevního tlaku.

Gastrointestinální poruchy

Vzácné: Sucho v ústech, nauzea, žaludeční obtíže.

Velmi vzácné: Zácpa

Poruchy kůže a podkožní tkáně

Velmi vzácné: Snížení perspirace, alergická vyrážka.

Poruchy svalové a kosterní soustavy a pojivové tkáně

Vzácné: Svalové záškuby.

Poruchy ledvin a močových cest

Velmi vzácné: Poruchy močení, zejména u pacientů s adenomem prostaty (snížení dávky), vzácněji: retence moči.

Celkové poruchy a reakce v místě aplikace

Vzácné: Ospalost.

Hlášení podezření na nežádoucí účinky

Hlášení podezření na nežádoucí účinky po registraci léčivého přípravku je důležité. Umožňuje to pokračovat ve sledování poměru přínosů a rizik léčivého přípravku. Žádáme zdravotnické pracovníky, aby hlásili podezření na nežádoucí účinky na adresu:

Státní ústav pro kontrolu léčiv

Šrobárova 48

100 41 Praha 10

Webové stránky: www.sukl.cz/nahlasit-nezadouci-ucinek

4.9 Předávkování

Symptomy:

Symptomy předávkování jsou např. rozšířené zornice, suchá sliznice, zarudnutí v obličeji, zvýšená srdeční frekvence, atonie střev a močového měchýře, zvýšená teplota (obzvláště u dětí) a poruchy centrálního nervového systému (agitovanost, delirium, zmatenost, zastřené vědomí a/nebo halucinace). Při velmi závažném předávkování je riziko selhání krevního oběhu a dýchání.

Léčba předávkování:

Měla by být zvážena gastrická laváž nebo zvracení. Jako antidotum se doporučuje inhibitor acetylcholinesterázy (fysostigmin), který také ovlivňuje centrálně vyvolané příznaky.

V případě potřeby je nutná podpora kardiovaskulárních a respiračních funkcí (inhalace kyslíku), snižování tělesné teploty a katetrizace močového měchýře.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: antiparkinsonika; anticholinergika

ATC kód: N04AA02

Anticholinergikum působící především na CNS, na periferii má vliv relativně malý. Váže se kompetitivně na muskarinové receptory, zejména typu M1. Ovlivňuje především tremor a rigiditu.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Po perorálním podání 4 mg biperidenu 6 zdravým dobrovolníkům ve věku 20 – 33 let došlo k rychlé absorpci se střední prodlevou 27 minut. Maximální plazmatické koncentrace 5,1 ng/ml bylo dosaženo v průměru po 1,5 hodině. V dalších studiích byla plazmatická koncentrace 1,01 – 6,53 za 1/2 – 2 hodiny po podání léku. Ve srovnávací studii byla podána 10 mladým zdravým dobrovolníkům (24 + 7 let) a 8 starším nemocným (77 + 4,8 let) s Parkinsonovou nemocí jednorázová dávka 4 mg biperidenu a poté po sedmi dnech dvakrát denně 2 mg po dobu 6 dnů. Obsah biperidenu v plazmě se zjišťoval 1 a 15 den.

Maximální koncentrace u mladých dobrovolníků byla 1. den 4,3+2,6 ng/ml (po 0,9 hodiny) a 15. den 2,5+1,4 ng/ml (po 0,8 hodiny). Je nutno přihlídnout k tomu, že 15. den terapie byly před odběrem krve podány 2 mg biperidenu. Maximální plazmatická koncentrace 7,2+4,4 resp. 4,2+2,2 ng/ml u starších pacientů byla naměřena po 1,6+0,7 resp. 1,6+0,3 hodiny.

Biperiden se váže na plazmatické proteiny z 94 % u žen a 93 % u mužů.

Biperiden se metabolizuje téměř plně, v nezměněné podobě nebyl v moči zjištěn. Metabolity se vylučují přibližně z jedné poloviny moči, z druhé poloviny stolicí. Biologický poločas byl 11 až 21,3 hodiny po jednorázovém podání 4 mg biperidenu zdravým dobrovolníkům a 23,8 až 36,6 hodin u starších nemocných. V rovnovážném stavu (2 mg biperidenu dvakrát denně po dobu 6 dnů) byl poločas 15,7 až 33,3 hodiny u zdravých dobrovolníků a 26,3 až 40,7 u starších nemocných.

Plazmatická clearance byla 11,6+0,8 ml/min/kg tělesné hmotnosti. Biologická dostupnost po perorálním podání je pouze 33 %±5 %.

5.3 Předklinické údaje vztahující se k bezpečnosti

Chronická toxicita nebyla zjištěna.

Mutagenita a kancerogenita - ke stanovení genotoxického potenciálu biperidenu se používají následující testy: salmonela/mikrozomový test, HPRT test na čínských křečcích, chromozómová aberace na lidských lymfocytech *in vitro* a *in vivo* chromozómová aberace na kostní dřeni potkanů. Dlouhodobé testy na zvířatech mutagenitu ani kancerogenitu neprokázaly.

6. FARMACEUTICKÉ ÚDAJE

6.1 Seznam pomocných látek

hydrogenfosforečnan vápenatý, kopovidon, bramborový škrob, monohydrát laktózy, magnesium-stearát, kukuřičný škrob, mikrokrystalická celulóza, mastek

6.2 Inkompatibility

Neuplatňuje se.

6.3 Doba použitelnosti

5 let

6.4 Zvláštní opatření pro uchovávání

Uchovávat při teplotě do 30°C.

6.5 Druh obalu a obsah balení

Průhledný, perforovaný (jednodávkový) Al/PVC blistr, krabička Velikost balení: 20 a 50 tablet.

Na trhu nemusí být všechny velikosti balení.

6.6 Zvláštní opatření pro likvidaci přípravku

Žádné zvláštní požadavky.

Veškerý nepoužitý léčivý přípravek nebo odpad musí být zlikvidován v souladu s místními požadavky.

7. DRŽITEL ROZHODNUTÍ O REGISTRACI

Laboratorio Farmaceutico S.I.T. Srl
Via Cavour 70
27035 Mede
Itálie

8. REGISTRAČNÍ ČÍSLO

27/1343/93-C

9. DATUM PRVNÍ REGISTRACE/PRODLOUŽENÍ REGISTRACE

Datum první registrace: 29. 12. 1993
Datum posledního prodloužení registrace: 4.4.2012

10. DATUM REVIZE TEXTU

27. 6. 2018