

PRODUKTRESUMÉ

1. LÄKEMEDELTS NAMN

Akineton 5 mg/ml injektionsvätska, lösning
Akineton 2 mg tabletter

2. KVALITATIV OCH KVANTITATIV SAMMANSÄTTNING

1 ml injektionsvätska innehåller 5 mg biperidenlaktat.
1 tablett innehåller 2 mg biperidenhydroklorid.

Hjälpämne med känd effekt:

Injektionsvätska, lösning: Natriumlaktat 14 mg.

Tabletter: Laktosmonohydrat 38 mg.

För fullständig förteckning över hjälpämnena, se avsnitt 6.1.

3. LÄKEMEDELFORM

Injektionsvätska, lösning
Tablett

4. KLINISKA UPPGIFTER

4.1 Terapeutiska indikationer

Parkinsonism. Medikamentellt betingade extrapyramidala symtom (akut dystoni och initial dyskinesi).

4.2 Dosering och administreringsätt

Parkinsonism

Oralt: Kontinuerlig ökning från ½ tablett 2 gånger dagligen till individuell optimal dos, vilken som regel uppgår till ½–2 tabletter 3–4 gånger dagligen.

Parenteralt: I svåra fall 2(–4) ampuller [10(–20) mg] intramuskulärt eller långsamt intravenöst, fördelade över dagen.

Medikamentellt betingade extrapyramidala symtom (akut dystoni och initial dyskinesi)

Oral tilläggsmedicinering till neuroleptika ½–1(–2) tabletter 1–4 gånger dagligen. Vid parenteral medicinering (akut dystoni) ges ½–1 ampull (2,5–5 mg) intramuskulärt eller långsamt intravenöst. De extrapyramidala symtomen kan försvinna redan under injektionen. I dessa fall ska injiceringen avbrytas. Vid behov kan den föreskrivna dosen åter ges efter 30 minuter.

Äldre: Lägsta möjliga dos ska väljas vid behandling av äldre patienter, särskilt de med symtom på organisk hjärnsjukdom eller med ökad benägenhet för cerebrala kramper. Vid behov rekommenderas successiv ökning av dosen. Äldre patienter är mer känsliga för antikolinergika.

4.3 Kontraindikationer

Överkänslighet mot den aktiva substansen eller mot något hjälpämne som anges i avsnitt 6.1.

Stenos i magtarmkanalen och megacolon. Trång kammarvinkel med risk för akut glaukom. Tardiv dyskinesi.

4.4 Varningar och försiktighet

Vid prostatahypertrofi, förhöjd krampbenägenhet och takykardi.

Äldre: Behandling av äldre ska ske med försiktighet och behandlingstiden ska vara så kort som möjligt. Effekt och behov av behandling ska utvärderas kontinuerligt.

Akineton injektionsvätska, lösning innehåller mindre än 1 mmol (23 mg) natrium per ampull, d.v.s. är näst intill "natriumfritt".

Akineton tabletter innehåller laktos. Patienter med något av följande sällsynta ärftliga tillstånd bör inte använda detta läkemedel: galaktosintolerans, total laktasbrist eller glukos-galaktosmalabsorption.

4.5 Interaktioner med andra läkemedel och övriga interaktioner

Vid kombination med andra läkemedel med antikolinerg effekt såsom neuroleptika, antihistaminer, antiparkinsonmedel, spasmolytika och kinidin bör man beakta en möjlig förstärkning av de vegetativa eller centrala biverkningarna.

Vid samtidig administrering av Akineton och levodopa kan dyskinesi potentieras.

Som vid alla centralt verkande farmaka bör, under behandling med Akineton, alkohol undvikas.

4.6 Fertilitet, graviditet och amning

Graviditet

Klinisk erfarenhet från gravida kvinnor är begränsad. Djurexperimentella data är ofullständiga.

Amning

Passerar över i modersmjölk i sådana mängder att risk för påverkan på barnet föreligger även med terapeutiska doser.

4.7 Effekter på förmågan att framföra fordon och använda maskiner

Vid behandling med biperiden kan, hos vissa patienter, reaktionsförmågan nedsättas. Detta bör beaktas då skärpt uppmärksamhet krävs, t.ex. vid bilkörning.

4.8 Biverkningar

Följande frekvenser används som grund vid utvärdering av biverkningar:

Mycket vanliga	($\geq 1/10$)
Vanliga	($\geq 1/100, < 1/10$)
Mindre vanliga	($\geq 1/1\ 000, < 1/100$)
Sällsynta	($\geq 1/10\ 000, < 1/1\ 000$)
Mycket sällsynta	($< 1/10\ 000$)
Ingen känd frekvens	(kan inte beräknas från tillgängliga data)

Biverkningar kan uppträda särskilt i början av behandlingen och om dosen ökas för snabbt. Då antalet användare är okänt, kan den procentuella frekvensen av spontant rapporterade biverkningar inte bestämmas exakt.

Infektioner och infestationer

Ingen känd frekvens: Parotit.

Immunsystemet

Mycket sällsynta: Överkänslighet.

Psykiska störningar

Sällsynta: I högre doser excitation, agitation, rädsla, förvirring, delirium, hallucinationer, sömnlöshet. Centralstimulerande effekter är vanliga hos patienter med symtom på mental retardation och kan kräva en minskning av dosen. Det har förekommit rapporter om tillfälligt minskad REM-sömn (sömnfas med snabba ögonrörelser), som kännetecknas av en ökning av den tid som behövs för att nå detta stadium och av en procentuellt minskad längd av denna fas i den totala sömnen.

Mycket sällsynta: Nervositet, eufori.

Centrala och perifera nervsystemet

Sällsynta: Trötthet, yrsel och minnesstörningar.

Mycket sällsynta: Huvudvärk, dyskinesi, ataxi och talsvårigheter, ökad benägenhet för cerebrala kramper och konvulsioner.

Ögon

Mycket sällsynta: Ackommodationsbesvär, mydriasis och ljuskänslighet. Glaukom med stängd kammarvinkel kan uppstå (förhöjt intraokulärt tryck).

Hjärtat

Sällsynta: Takykardi.

Mycket sällsynta: Bradykardi. Blodtryckssänkning (efter parenteral tillförsel).

Magtarmkanalen

Sällsynta: Muntorrhet, illamående, magbesvär.

Mycket sällsynta: Förstoppning

Hud och subkutan vävnad

Mycket sällsynta: Hypohidros, allergiska hudutslag.

Muskuloskeletala systemet och bindväv

Sällsynta: Muskelryckningar.

Njurar och urinvägar

Mycket sällsynta: Miktionsbesvär, särskilt hos patienter med prostataadenom (dosreduktion rekommenderas), mer sällan: urinretention.

Allmänna symtom och/eller symtom vid administreringsstället

Sällsynta: Dåsighet.

Rapportering av misstänkta biverkningar

Det är viktigt att rapportera misstänkta biverkningar efter att läkemedlet godkänts. Det gör det möjligt att kontinuerligt övervaka läkemedlets nytta-riskförhållande. Hälso- och sjukvårdspersonal uppmanas att rapportera varje misstänkt biverkning till (se detaljer nedan):

Läkemedelsverket

Box 26

751 03 Uppsala

Webbplats: www.lakemedelsverket.se

4.9 Överdoser

Psykosliknande tillstånd är oftast tecken på överdosering, som kan förekomma hos patienter med lägre tolerans, t.ex. vid cerebral arterioskleros.

Toxicitet: 20 mg till vuxna gav lindrig, 20 mg till 17-åring och 80-140 mg till vuxna gav måttlig, 180 mg till vuxen gav måttlig till allvarlig intoxikation.

Symtom: Dåsighet, förvirring, ataxi, yrsel, torrhet i munnen, illamående, kräkningar, mydriasis, dimsyn, ansiktsrodnad, hjärtklappning, atoni i urinblåsa och tarmar, ökad kroppstemperatur. Ibland orostillstånd, hallucinationer. Vid massiv intoxikation kramper, andningsdepression, risk för cirkulationskollaps.

Behandling: Om befogat ventrikeltömning, kol. Vid hallucinationer, uttalad excitation och delirium kan fysostigmin provas. Diazepam vid oro och kramper. Syrgas, eventuellt assisterad andning. Mörkt och tyst rum. Symtomatisk behandling.

5. FARMAKOLOGISKA EGENSKAPER

5.1 Farmakodynamiska egenskaper

Farmakoterapeutisk grupp: Medel vid parkinsonism, ATC-kod N04AA02

Akineton innehåller propanolderivatet biperiden, ett antikolinergikum med central effekt.

I jämförelse med atropin är de perifera vegetativa effekterna svagare.

Vid parkinsonism är jämvikten av de kolinerga och dopaminerga funktionerna rubbade, beroende på dopaminbrist i striatum. Biperiden griper in i den störda balansen och påverkar framförallt rigiditet, men även tremor och de vegetativa symtomen samt i mindre grad akinesi.

Medikamentellt betingade extrapyramidala symtom (akut dystoni och initial dyskinesi) svarar i regel på tillförsel av biperiden.

5.2 Farmakokinetiska egenskaper

Absorption

Efter oralt intag av biperidenhydroklorid (4 mg motsv. 3,59 mg biperiden) uppnås maximal plasmakoncentration på ca 4 ng/ml efter omkring 1,5 timmar. Biotillgängligheten är ca 33%.

Distribution

Biperiden har hög plasmaproteinbindning, framförallt till albumin men även till surt α 1-glycoprotein (α 1-AGP). Bindningen är ca 95% hos kaukasier och ca 90% hos japaner.

Metabolism

Biperiden metaboliseras nästan fullständigt efter en oral dos och ingen oförändrad biperiden kan spåras i urinen. Den viktigaste biperidenmetaboliten formas genom hydroxylering vid bicykloheptanringen (60%), men viss hydroxylering sker också vid piperidinringen (40%). De olika metaboliterna (hydroxyleringsprodukter och -konjugat) utsöndras via urin och feces. Inga studier har utförts gällande metabolismen av biperiden efter intravenös administration.

Eliminering

Plasmaclearance är ca 50 l/timme. Efter en intravenös injektion av biperidenlaktat (4 mg motsv. 3,1 mg biperiden) faller plasmakoncentrationskurvan bifasiskt med en terminal halveringstid på 24 timmar.

Efter oral dosering av biperiden 2 mg 2 gånger dagligen i 6 dagar var halveringstiden hos unga frivilliga 16 – 33 timmar och hos äldre patienter 26 – 41 timmar. Äldre patienter uppvisade en signifikant högre AUC (ca 4-5 gånger högre) än unga frivilliga.

Det saknas farmakokinetiska data för patienter med nedsatt lever- och njurfunktion.

5.3 Prekliniska säkerhetsuppgifter

Prekliniska data är ofullständiga. Tillgängliga data visar inte på någon särskild risk för människa baserat på konventionella studier av säkerhetsfarmakologi, toxicitetsstudier med upprepad dosering, genotoxicitet samt reproduktionstoxicitet. Långtidsstudier avseende karcinogenicitet saknas.

6. FARMACEUTISKA UPPGIFTER

6.1 Förteckning över hjälpämnen

Injektionsvätska, lösning:
natriumlaktat
vatten för injektionsvätskor

Tabletter:
majsstärkelse
potatisstärkelse
laktosmonohydrat
kalciumvätefosfatdihydrat
mikrokristallin cellulosa
kopovidon
talk
magnesiumstearat

6.2 Inkompatibiliteter

Då blandbarhetsstudier saknas ska detta läkemedel inte blandas med andra läkemedel.

6.3 Hållbarhet

5 år

6.4 Särskilda förvaringsanvisningar

Inga särskilda förvaringsanvisningar.

6.5 Förpackningstyp och innehåll

Akineton 5 mg/ml injektionsvätska: 5x1 ml, glasampull
Akineton 2 mg tabletter: 100 st i glasburk eller tryckförpackning

Eventuellt kommer inte alla förpackningsstorlekar att marknadsföras.

6.6 Särskilda anvisningar för destruktion och övrig hantering

Ej använt läkemedel och avfall ska kasseras enligt gällande anvisningar.

7. INNEHAVARE AV GODKÄNNANDE FÖR FÖRSÄLJNING

Laboratorio Farmaceutico S.I.T. S.r.l.
Via Cavour, 70
27035 Mede (PV)
Italien

8. NUMMER PÅ GODKÄNNANDE FÖR FÖRSÄLJNING

Akineton 5 mg/ml injektionsvätska, lösning: 6034
Akineton 2 mg tabletter: 6035

9. DATUM FÖR FÖRSTA GODKÄNNANDE/FÖRNYAT GODKÄNNANDE

Datum för det första godkännandet: 30 januari 1960
Datum för den senaste förnyelsen: 15 augusti 2010

10. DATUM FÖR ÖVERSYN AV PRODUKTRESUMÉN

2018-08-24