

14

ВІPERIDEN/БІPERИДЕН

biperiden
таблети

1. ИМЕ НА ЛЕКОТ
ВІPERIDEN/БІPERИДЕН
biperiden
АТС N04A A02

2. КВАЛИТАТИВЕН И КВАНТИТАТИВЕН СОСТАВ

Таблети 2 mg

Состав:

1 таблета содржи 2 mg бипериден хидрохлорид, помошни супстанции.

*За целосна листа на ексципиенси види точка 6.1

3. ФАРМАЦЕВТСКА ФОРМА

Таблета.

4 КЛИНИЧКИ ПОДАТОЦИ

4.1 Терапевтски индикации

Паркинсонизам.

Екстрапирамидално заболување предизвикано од лекови и од друго потекло (спастични состојби).

4.2. Дозирање и начин на употреба

Паркинсонизам

Почетната доза изнесува 2 mg на ден, поделена во две поединечни дози. Дозата постепено се зголемува до оптималната дневна доза која за најголем број пациенти изнесува 3-12 mg, поделена во 3-4 поединечни дози. Максималната дневна доза изнесува 16 mg.

Екстрапирамидално заболување

Вообичаена доза за возрасни, за контрола на екстрапирамидалните реакции предизвикани од лекови (невролептици), е 2 mg, 1-3 пати на ден.

При спастични состојби се дава поединечна доза од 2 mg, 2-3 пати на ден.

4.3. Контраиндикации

Преосетливост на бипериден.
Мијастенија гравис.
Глауком со затворен агол.



Опструктивно гастроинтестинално заболување.
Паралитичен илеус или интестинална атонија.
Рефлуксен езофагитис.
Улцеративен колитис или токсичен мегаколон.
Нестабилан кардиоваскуларен статус при акутна хеморагија.
Опструктивна уропатија (аденом на простатата).

4.4. Мерки на претпазливост и посебни предупредувања

Посебни мерки на претпазливост се потребни кај постари лица, кај лица со срцева инсуфициенција, аритмија, тахикардија, аденом на простатата и кај лица со зголемена тенденција кон конвулзии.

Кај осетливи пациенти е забележана појава на ментална конфузија, еуфорија, агитација и нарушување на однесувањето (централен антихолинергичен синдром), при соодветно препишана антихолинергична терапија.

Бипериден може да го намали потењето. Тоа може да доведе до топлотен удар при топло време или при тежок физички напор.

Дозирањето не треба нагло да се менува, и почетокот на терапијата и прекинот на терапијата треба да бидат постепени.

Сигурноста и ефикасноста кај деца не се утврдени.

Експципиенси: Бипериден таблетите содржат лактоза. Пациенти со ретки наследни проблеми во однос на неподносливост на галактоза, Lapp лактоза дефицит или глукозо-галактозна малапсорпција, не може да го употребуваат овој лек.

4.5. Интеракции со други лекови или други форми на интеракции

Централен антихолинергичен синдром може да се појави кога бипериден се употребува истовремено со лекови кои имаат секундарни антихолинергични дејства, како што се одредени наркотични аналгетици (меперидин), фенотијазини и други антипсихотици, трициклични антидепресиви, антиаритмици (кинидин) и антихистаминици.

Истовремената примена на леводопа и бипериден може да ја потенцира дискинезијата. Генерализирани хорeatични движења биле забележани кај пациенти со Паркинсонова болест при истовремена примена на карбидопа/леводопа и бипериден. Тардивната дискинезија предизвикана од невролептици може да се интензивира при земање бипериден. Паркинсоновите симптоми во присуство на постојна тардивна дискинезија понекогаш се многу сериозни, така што е неопходно да се продолжи со антихолинергичната терапија.

Ефектот на метоклопрамид и на лекови со слична активност на гастроинтестиналниот тракт е променет при земање антихолинергици, како што е бипериден. Како и кај сите други лекови кои дејствуваат на централниот нервен систем, при терапија со бипериден треба да се избегнува конзумирање алкохол.

4.6. Бременост и лактација

Досега не се направени анимални репродуктивни студии со бипериден. Не е познато дали бипериден може да предизвика фетално оштетување или дали ја засега репродуктивната способност. Лекот може да се употребува за време на бременоста само ако е неопходно потребен.



Потребна е претпазливост кога се применува кај доилки, бидејќи излачениот лек во мајчиното млеко може да доведе до непријатни антихолинергични ефекти кај детето.

4.7 Влијание врз способноста за возење или за ракување со машини

Лекот може да предизвика сонливост. Пациентите кои се лекуваат не треба да возат или да ракуваат со машини, освен ако се покаже дека лекот нема влијание врз физичката или врз менталната способност.

4.8. Несакани дејства

Несаканите дејства кои се пријавени се категоризирани по MedDRA фреквенција и по системи: многу чести ($\geq 1/10$), чести ($\geq 1/100$, $< 1/10$), не многу чести ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), ретки ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$), многу ретки ($< 1/10000$), непозната фреквенција (не може да биде пресметана од достапните податоци).

Нарушувања на имунолошкиот систем

Ретки: алергиски исип на кожата.

Непозната фреквенција а: преосетливост.

Психијатриски нарушувања

Непозната фреквенција: намалување на РЕМ-спиенето кое се карактеризира со зголемена РЕМ-латенција и со намален процент на РЕМ-спиене, толеранција кон овој ефект, анксиозност, еуфорично расположение, дезориентација, агитација, нарушено однесување, конфузија, делириум, а во ретки случаи халуцинации. Овие несакани дејства се реверзибилни симптоми на предозирање кои може да се појават дури и со доза во терапевтски опсег, кај пациенти со ниска толеранција (на пример, кај пациенти со церебрална артериосклероза). Слични симптоми може да се појават ако дозите на бипериден брзо се зголемуваат или ако истовремено се даваат други антихолинергици со централно дејство, како што се антидепресиви или невротлептици во големи дози.

Нарушувања на нервниот систем

Чести: сонливост.

Не многу чести: замор, вртоглавица.

Ретки: атаксија, нарушена меморија, конвулзии и дискинезија.

Нарушувања на видот

Чести: нарушена акомодација, мидријаза, заматен вид.

Срцеви заболувања

Невообичаено: тахикардија.

Ретки: брадикардија.

Непозната фреквенција: постурална хипотензија.

Гастроинтестинални нарушувања

Чести: запек, сува уста.

Не многу чести: гастрични симптоми.



Нарушувања на кожата и на поткожното ткиво

Чести: хипохидроза.

Бубрежни и уринарни нарушувања

Чести: уринарна ретенција.

4.9. Предозирање

Симптомите на труење со бипериден се слични како оние при труење со атропин. Во клиничката слика доминираат симптоми од блокадата на периферните мускарински рецептори: мидријаза, топла и сува кожа, црвенило на лицето, сува уста и горни респираторни патишта, зголемена телесна температура, тахикардија, срцеви аритмии, намален мотилитет на цревата, ретенција на урината.

Поради блокада на централните мускарински рецептори може да се појават невропсихијатриски знаци како делириум, дезориентација, анксиозност, халуцинации, конфузија, хиперактивност, атаксија, агресивност и конвулзии.

При тешко труење може да дојде до ступор, кома, парализа, респираторен и кардијален арест и до смрт.

Терапијата на предозирањето се состои од лаважа и симптоматско лекување на хиперпирексијата, респираторната и кардиоваскуларната дисфункција. Може да се даде физостигмин, како специфичен антагонист, во доза од 1 mg интрамускулно или како бавна интравенска инфузија. Оваа доза може да се повторува на секои 20 минути до вкупна доза од 4 mg. Кај деца и кај повозрасни се дава половина од вообичаената доза. Бидејќи физостигминот брзо се разградува, понекогаш се потребни дополнителни дози физостигмин, на секои 1-2 часа. Пациентот треба да биде под контрола на доктор најмалку 8-12 часа од последното влошување на симптомите.

5. ФАРМАКОЛОШКИ СВОЈСТВА

5.1. Фармакодинамика

Бипериденот е централно активен антихолинергичен препарат со слаби периферни ефекти. Освен антиспазмодично, антисекреторно и мидријатично дејство, поседува и антеникотинско дејство, околу шест пати појако од тоа на атропин и пет пати појако од трихексифенидил, што е докажано во испитувања на анимални модели. Паркинсонизмот настанува како резултат на нерамнотежа на ексцитаторниот (холинергичниот) и на инхибиторниот (допаминергичниот) систем во Corpus striatum. Механизмот на дејство на централно активните антихолинергични препарати, како што е бипериден, се базира на компетитивниот антагонизам со ацетилхолинот на холинергичните рецептори во Corpus striatum. На тој начин се воспоставува рамнотежа меѓу двата система и се остваруваат повољните ефекти при паркинсонизам и при екстрапираמידални реакции.

Бипериден се користи како додатна терапија при сите форми на Паркинсонов синдром, при што изгледа дека подобри ефекти се остваруваат кај постенцефалитичната и кај идиопатската отколку кај артериосклеротичната форма. Бипериден ја намалува мускулната ригидност, го редуцира потењето и саливацијата и го подобрува одот и треморот. Повољно дејствува кај екстрапираמידалните



реакции од медикаментозно (неуролептици) и од немедикаментозно потекло. Иако се користи како дополнителна терапија при спастични состојби од различно потекло (мултиплекс склероза, церебрална парализа, повреди на рбетниот мозок), се уште примената за овие индикации бара дополнителни испитувања.

5.2. Фармакокинетика

Направени се мал број фармакокинетски студии за бипериден кај луѓе. Бипериденот брзо се апсорбира од гастроинтестиналниот тракт, но биорасположивоста изнесува само околу 30 %, што укажува на екстензивен метаболизам при првото преминување во црниот дроб. По примена на орална доза од 4 mg, серумската концентрација на бипериден изнесува 4-5 ng/ml и се постигнува по 1 - 1,5 ч.

Врзувањето на бипериден за плазматските протеини изнесува 93 %, додека волуменот на дистрибуција е $24 \pm 4,1$ l/kg.

Метаболизмот на бипериденот не е комплетно разјаснет, но се знае дека е инволвиран процесот на хидроксилација.

Полуживотот на елиминација на бипериден е околу 20 часа, така што плазматски концентрации (0,1-0,2 ng/ml) можат да се одредат и 48 часа по апликацијата.

5.3. Предклинички податоци за безбедноста

Вредностите на LD₅₀ за бипериден кај глувци изнесуваат 545 mg/kg (орално), 195 mg/kg (супкутано) и 56 mg/kg (интравенски). Кај стаорци истата вредност изнесува 750 mg/kg. Кај кучиња при интравенска доза од 33 mg/kg се јавува респираторен арест, а циркулаторен арест при 45 mg/kg. Вредноста на LD₅₀ при орална апликација изнесува 340 mg/kg.

Не се направени испитувања за можните ефекти на бипериден врз репродукцијата кај животни. Не е познато дали бипериден може да доведе до оштетување на фетусот кога се аплицира кај бремени жени и дали влијае на репродуктивниот капацитет.

6. ФАРМАЦЕВТСКИ ПОДАТОЦИ

6.1. Листа на ексципиенси

Лактоза монохидрат, микрокристална целулоза, коповидон, натриум кроскармелоза, магнезиум стеарат.

6.2 Инкомпатибилност

Не е позната.

6.3 Рок на употреба

3 години во оригинално пакување.

Да не се употребува после истекот на рокот на употреба!

6.4 Начин на чување

Да се чува на температура до 25°C, во оригинално пакување.

ЛЕКОТ ДА СЕ ЧУВА НА МЕСТА НЕДОСТАПНИ ЗА ДЕЦА!



6.5 Пакување

Кутија со 60 таблети од 2 mg во блистер пакување.

6.6 Упатство за употреба/ракување

За орална употреба само.

6.7 Начин на издавање

Лекот се издава во аптека со рецепт.

7. ПОДАТОЦИ ЗА НОСИТЕЛОТ НА РЕШЕНИЕТО ЗА ПРОМЕТ

РЕПЛЕК ФАРМ ДООЕЛ Скопје, ул: Козле бр. 188, 1000 Скопје, Р. Македонија

8. БРОЈ НА РЕШЕНИЕТО ЗА СТАВАЊЕ ВО ПРОМЕТ

9. ДАТУМ НА ПРВОТО РЕШЕНИЕ ЗА СТАВАЊЕ ВО ПРОМЕТ

Датум на I-во решение: 30.10.2007

10. ДАТУМ НА ПОСЛЕДНАТА РЕВИЗИЈА НА ТЕКСТОТ

10.2015

