



AKINETON[®] **cloridrato de biperideno**

I) IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO

AKINETON[®]

cloridrato de biperideno

Formas Farmacêuticas, apresentações e vias de administração:

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido 2 mg: embalagem com 80 comprimidos, (Lista nº N 277) – Via oral

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido revestido retard 4 mg: embalagem com 30 comprimidos, (Lista nº N 280) – Via oral

USO PEDIÁTRICO E ADULTO

Composição:

Cada comprimido contém:

Cloridrato de biperideno 2 mg

(equivalente a 1,8mg de biperideno)

Excipientes: amido de milho, celulose microcristalina, estearato de magnésio, lactose, povidona e talco.

Cada comprimido revestido retard contém:

Cloridrato de biperideno 4 mg

(equivalente a 3,59mg de biperideno)

Excipientes: água purificada, amido de milho, celulose microcristalina, cera de carnaúba, dióxido de silício, docusato de sódio, estearato de magnésio, lactose, hiprolose, hipromelose, polietilenoglicol, povidona, talco, e corantes: dióxido de titânio e óxido de ferro amarelo.

INFORMAÇÕES AO PACIENTE

AÇÃO DO MEDICAMENTO

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) contém como princípio ativo o biperideno. O biperideno é indicado para tratamento do Parkinsonismo e dos efeitos colaterais causados pelos medicamentos que agem no cérebro (neurolépticos) e por outros medicamentos que bloqueiam os receptores de



uma substância chamada dopamina, ou que fazem com que a dopamina fique com a sua função diminuída.

INDICAÇÕES DO MEDICAMENTO

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) é indicado para: Síndrome parkinsoniana, especialmente para controlar sintomas de rigidez e tremor; sintomas extrapiramidais como contorções (torções) musculares agudas, sensação de tremor muscular, inquietação motora e síndromes parkinsonianas induzidas por medicamentos neurolépticos e outros medicamentos similares.

RISCOS DO MEDICAMENTO

Contra-indicações

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) é contra-indicado a pacientes com hipersensibilidade ao biperideno ou a qualquer um dos excipientes da fórmula. AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) é contra-indicado para pacientes portadores de glaucoma de ângulo estreito, estenose ou obstrução mecânica do trato gastrointestinal e megacólon.

Não há contra-indicação relativa a faixas etárias.

Advertências

Habilidade de dirigir e operar máquinas: o paciente não deve realizar tarefas que exijam atenção ou dirigir veículos e operar máquinas, pois a sua habilidade e atenção podem estar prejudicadas.

Uso de bebidas alcoólicas durante tratamento: a ingestão de bebidas alcoólicas deve ser evitada durante o tratamento com AKINETON[®] (cloridrato de biperideno).

Uso em crianças: o uso de AKINETON[®] (cloridrato de biperideno/lactato de biperideno) em crianças é indicado para o tratamento (de curta duração) de transtornos nos movimentos causados por medicamentos (por ex.: por neurolépticos, metoclopramida, etc). Para crianças, deverá ser administrada a forma comprimidos de 2 mg.

Gravidez: não se sabe se o biperideno pode causar danos ao feto. Nesses casos, AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) deve ser usado quando estritamente recomendado pelo médico.

Amamentação: não se sabe se o biperideno passa pelo leite materno. Pelo fato de muitos medicamentos passarem pelo leite materno, deve-se ter cuidado ao administrar AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) a uma mulher que esteja amamentando.



Uso em idosos: maior atenção deve ser dispensada aos pacientes com idade avançada, sobretudo se apresentarem sintomas de doença orgânica cerebral ou apresentarem suscetibilidade aumentada a convulsões. Pacientes idosos são mais suscetíveis à medicação anticolinérgica.

Interações medicamentosas, alimentares e com testes laboratoriais

O uso de AKINETON[®] (cloridrato de biperideno), juntamente com outros medicamentos com efeitos parecidos, pode aumentar os efeitos colaterais no sistema nervoso central e periférico.

A ingestão de bebidas alcoólicas deve ser evitada durante o tratamento com AKINETON[®] (cloridrato de biperideno).

Informe ao médico o aparecimento de reações indesejáveis.

Informe ao seu médico se você está fazendo uso de algum outro medicamento.

Não use medicamento sem o conhecimento do seu médico. Pode ser perigoso para a sua saúde.

Este medicamento não deve ser utilizado por mulheres grávidas sem orientação médica ou do cirurgião-dentista.

Categoria de risco: C

MODO DE USO

Aspecto físico

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido revestido retard 4 mg é oblongo e branco.

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido 2 mg é redondo e branco.

Características organolépticas

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido revestido retard 4 mg é insípido e inodoro.

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido 2 mg é insípido e inodoro.

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido deve ser tomado com um pouco de líquido, preferencialmente durante ou após uma refeição.



AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido revestido retard não deve ser mastigado e nem partido, devendo ser tomado inteiro com um pouco de líquido, em doses que deverão ser distribuídas ao longo do dia (tomando sempre um comprimido pela manhã).

Adultos: a princípio deve-se administrar AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido 2 mg, aumentando lentamente a dose até se obter melhora; só então deve-se trocar o tratamento para AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido revestido retard 4 mg.

Normalmente, a dose média para adultos é de 1 a 3, ou, no máximo, 4 comprimidos revestidos ao dia. As doses deverão ser distribuídas ao longo do dia (administrando-se sempre um comprimido revestido retard pela manhã). A duração do tratamento dependerá da natureza e do curso da doença.

SÍNDROMES PARKINSONIANAS

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido 2 mg:

Adultos: a dose inicial usual é de 1 mg (1/2 comprimido) de AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) duas vezes ao dia (correspondendo a 2 mg de cloridrato de biperideno/dia). A dose de manutenção é de 3 a 16mg/dia. A dose máxima diária recomendada é de 16 mg (8 comprimidos) que deverá ser distribuída uniformemente ao longo do dia.

TRANSTORNOS EXTRAPIRAMIDAIS MEDICAMENTOSOS

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido 2 mg:

Adultos: a dose usual é de 1 - 4 mg (1/2 - 2 comprimidos), de 1 a 4 vezes ao dia, como tratamento oral, associado a terapia neuroléptica, dependendo da intensidade dos sintomas.

Uso Pediátrico

TRANSTORNOS MEDICAMENTOSOS DO MOVIMENTO

Estudos com AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) em crianças são limitados e baseados, fundamentalmente, no tratamento transitório de transtornos de movimentos provocados por medicamentos (ex. por neurolépticos, metoclopramida e compostos similares).

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido 2 mg:

Crianças: a dose recomendada para crianças de 3 a 15 anos é 1/2 a 1 comprimido, 1 a 3 vezes ao dia (correspondendo a 1- 2 mg de cloridrato de biperideno/dia).

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido revestido retard 4 mg:

Crianças: não é recomendado para uso pediátrico; neste caso, AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido 2 mg é o mais indicado.



O que devo fazer se esquecer de tomar uma dose do medicamento?

Se a pessoa esquecer de tomar o AKINETON[®] (cloridrato de biperideno), deve entrar em contato com o médico o mais rápido possível.

Siga a orientação de seu médico, respeitando sempre os horários, as doses e a duração do tratamento.

Não interrompa o tratamento sem o conhecimento do seu médico.

Não use o medicamento com o prazo de validade vencido. Antes de usar observe o aspecto do medicamento.

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido revestido retard 4 mg: Este medicamento não pode ser partido ou mastigado.

REAÇÕES ADVERSAS

- Alergia, incluindo erupção cutânea;
- Sono perturbado;
- Agitação, confusão, ansiedade, excitação, euforia, delírios, alucinações;
- Insônia, problemas de memória, convulsões;
- Dilatação da pupila;
- Coração batendo muito rápido ou muito lento;
- Boca seca, prisão de ventre;
- Retenção urinária;

CONDUTA EM CASO DE SUPERDOSAGEM

Os sintomas são: pupilas dilatadas e lentas; secura das mucosas; rubor facial; coração acelerado; paciente pode perder controle urinário e fecal; elevação da temperatura do corpo (especialmente em crianças); excitação; delírio; confusão; alucinações. Se a intoxicação for muito grave, existe o risco de parada cardíaca e respiratória. Por isso, é importante procurar socorro médico imediatamente.



CUIDADOS DE CONSERVAÇÃO E USO

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) deve ser guardado dentro da embalagem original e conservado em temperatura ambiente (entre 15 e 30°C), protegido da luz e da umidade.

Todo medicamento deve ser mantido fora do alcance das crianças.

INFORMAÇÕES TÉCNICAS AOS PROFISSIONAIS DE SAÚDE

CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) contém como princípio ativo o biperideno, quimicamente conhecido como 3-piperidino-1-fenil-1-bicicloheptenil-1-propanol, um agente anticolinérgico predominantemente central. O biperideno é indicado para tratamento do Parkinsonismo e das reações adversas extrapiramidais induzidas pelos neurolépticos e outras drogas que bloqueiam receptores de dopamina nos gânglios da base e também criam uma deficiência funcional de dopamina.

Mudanças bioquímicas degenerativas do Parkinsonismo causam um déficit de dopamina no núcleo estriado, o que resulta num desequilíbrio funcional entre a transmissão colinérgica e dopaminérgica. O biperideno bloqueia principalmente a transmissão dos impulsos colinérgicos centrais pela reversão da ligação aos receptores de acetilcolina. Sintomas como hipersalivação ou aumento da sudorese podem ser minimizados com biperideno. Também é recomendado como adjuvante na terapia com levodopa ou medicamentos similares, o qual possui um aumento no efeito sobre a acinesia dos pacientes com Parkinsonismo.

Biperideno é um pó branco, inodoro, cristalino, ligeiramente solúvel em água e álcool, estável a temperaturas normais.

Farmacodinâmica

O biperideno é um agente anticolinérgico com efeito marcante no sistema nervoso central.

Seus efeitos anticolinérgicos são relativamente pequenos quando comparados aos da atropina. O biperideno se une de maneira competitiva aos receptores muscarínicos (preferencialmente M₁, o principal tipo de receptor muscarínico no cérebro) periféricos e centrais. Nos estudos experimentais em animais, o biperideno modificou os estados parkinsonianos (tremores, rigidez) provocados por colinérgicos de ação central.

Farmacocinética



Após a administração oral, o cloridrato de biperideno (4 mg correspondem a 3,59 mg de biperideno) é rapidamente absorvido depois de um período de latência de 30 minutos e meia vida de 20 min. Pico de concentração plasmática máxima de 4 ng/ml é atingido 1,5h mais tarde. O volume aparente de distribuição é de $24 \pm 4,1$ l/kg. A depuração plasmática oral é por volta de 146 l/h. A biodisponibilidade é em torno de 33% e a meia-vida de eliminação é de 21 horas.

A meia-vida terminal de eliminação plasmática, após a administração oral de dose única de 4 mg de cloridrato de biperideno, é de cerca de 11 a 21 horas em pacientes jovens saudáveis e de 24 a 37 horas em pacientes idosos. Em estado de equilíbrio (2mg de cloridrato de biperideno duas vezes ao dia durante 6 dias) as meias-vidas foram de 16 a 33 horas entre o jovens testados e de 26 a 41 horas entre os idosos. Pacientes idosos apresentaram uma maior biodisponibilidade (área sob a curva - AUC) do que pacientes jovens. A depuração plasmática foi de $11,6 \pm 0,8$ ml.min/kg corpóreo. A absorção do AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido revestido retard é consideravelmente mais lenta em comparação ao comprimido, com o primeiro pico de concentração plasmática em 3,5 horas e o segundo pico de 1 ng/ml após 10 a 12 horas. A meia vida terminal dura por volta de 24 horas após a administração do AKINETON[®] (cloridrato de biperideno). A biodisponibilidade é a mesma para ambas as formas orais. O biperideno se liga amplamente às proteínas plasmáticas. Além da albumina, a glicoproteína ácida α -1 também é um ligante em potencial. A extensão da ligação, que é independente da concentração para alcançar níveis terapêuticos, é de aproximadamente 95% nos caucasianos e de aproximadamente 90% nos japoneses. Não se sabe o fator que causa essa diferença. O biperideno se liga às proteínas plasmáticas em 94% nas mulheres e em 93% nos homens. O biperideno sofre metabolização quase completa; não se detecta biperideno inalterado na urina. O metabólito principal do biperideno é originado da hidroxilação pelo anel biciclo-heptano (60%); além disso, ocorre uma hidroxilação pelo anel de piperidina (40%). Os numerosos metabólitos (produtos de hidroxilação e conjugados) são excretados, em partes iguais, pela urina e pelas fezes.

Não se dispõe de dados sobre a farmacocinética entre pacientes com alterações das funções hepática ou renal.

RESULTADOS DE EFICÁCIA

Os resultados de eficácia estão disponíveis em referências bibliográficas.

Referências Bibliográficas:

Caso haja interesse em conhecer as referências bibliográficas e/ou estudos clínicos disponíveis para este medicamento, por favor, entre em



contato com nosso Serviço de Atendimento ao Consumidor – Abbott Center através do telefone 0800 7031050.

INDICAÇÕES

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) é indicado para: síndrome parkinsoniana, especialmente para controlar sintomas de rigidez e tremor; sintomas extrapiramidais como distonias agudas, acatisia e síndromes parkinsonianas induzidas por neurolépticos e outros fármacos similares.

CONTRA-INDICAÇÕES

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) é contra-indicado a pacientes com hipersensibilidade ao biperideno ou a qualquer um dos excipientes da fórmula. AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) é contra-indicado para pacientes portadores de glaucoma de ângulo estreito, estenose ou obstrução mecânica do trato gastrointestinal e megacólon.

MODO DE USAR E CUIDADOS DE CONSERVAÇÃO DEPOIS DE ABERTO

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimidos deve ser ingerido com um pouco de líquido, preferencialmente durante ou após uma refeição.

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido revestido retard não deve ser mastigado e nem partido, devendo ser ingerido inteiro com um pouco de líquido, em doses que deverão ser distribuídas ao longo do dia (administrando-se sempre um comprimido revestido retard pela manhã).

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) deve ser guardado dentro da embalagem original e conservado em temperatura ambiente (entre 15 e 30°C), protegido da luz e da umidade.

Via de administração: vide item “Posologia”.

POSOLOGIA

Adultos: o tratamento com AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) deve ser iniciado com aumento gradativo das doses em função do efeito terapêutico e dos efeitos secundários.

Os comprimidos devem ser administrados com líquidos, preferencialmente durante ou após uma refeição, para minimizar os efeitos indesejáveis no sistema gastrointestinal.



A princípio, deve-se administrar AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido 2 mg, aumentando-se gradativamente a dose até se obter resultado satisfatório; só então pode-se passar o tratamento para AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido revestido retard 4 mg. Estudos indicam que a dose média para adultos é de 1 a 3, ou no máximo 4 comprimidos revestidos ao dia. As doses deverão ser distribuídas ao longo do dia (administrando-se sempre um comprimido revestido retard pela manhã). A duração do tratamento dependerá da natureza e do curso da doença. O tratamento deve ser associado gradualmente.

Síndromes parkinsonianas

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido 2 mg:

Adultos: a dose inicial usual é de 1 mg (1/2 comprimido) de AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) duas vezes ao dia (correspondendo a 2 mg de cloridrato de biperideno/dia). A dose de manutenção é de 3 a 16 mg/dia. A dose máxima diária recomendada é de 16 mg (8 comprimidos), que deverá ser distribuída uniformemente ao longo do dia.

Transtornos extrapiramidais medicamentosos

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido 2 mg:

Adultos: a dose usual é de 1 - 4 mg (1/2 - 2 comprimidos), de 1 a 4 vezes ao dia, como tratamento oral, associado à terapia neuroléptica, dependendo da intensidade dos sintomas.

Uso pediátrico

Disfunções medicamentosas do movimento

Estudos com AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) em crianças são limitados e baseados, fundamentalmente, no tratamento transitório das distonias provocadas por medicamentos (ex. por neurolépticos, metoclopramina e compostos similares).

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido 2 mg:

Crianças: a dose recomendada para crianças de 3 a 15 anos é de ½ a 1 comprimido, 1 a 3 vezes ao dia (correspondendo a 1- 2 mg de cloridrato de biperideno/dia).

AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido revestido retard 4 mg:

Crianças: não é recomendado para uso pediátrico; neste caso, AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) comprimido 2 mg é o mais indicado.



ADVERTÊNCIAS

Habilidade de dirigir e operar máquinas: durante o tratamento com AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) combinado com outro medicamento de ação central, anticolinérgicos ou álcool, o paciente não deve executar tarefas que exijam atenção ou dirigir veículos e operar máquinas, pois a sua habilidade e atenção podem estar prejudicadas.

Uso concomitante com álcool: a ingestão de bebidas alcoólicas deve ser evitada durante o tratamento com AKINETON[®] (cloridrato de biperideno).

Uso em crianças: estudos sobre o uso de AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) em crianças são limitados e restringem-se, basicamente, a tratamentos de duração limitada de distonias de causa iatrogênica (por ex.: por neurolépticos, metoclopramida ou compostos análogos), que podem se manifestar como reações adversas ou sintomas de intoxicação. Para crianças, deverá ser administrada a forma comprimidos de 2 mg.

Gravidez: não se sabe se o biperideno pode causar danos fetais quando administrado a uma mulher grávida ou se pode afetar a capacidade de reprodução. AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) deve ser administrado quando estritamente recomendado pelo médico.

Lactação: não se sabe se o biperideno é excretado pelo leite materno. Pelo fato de muitas drogas serem excretadas pelo leite materno, deve-se ter cautela ao administrar AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) a uma lactante.

Ver item “Uso em idosos, crianças e outros grupos de risco” para ajuste de dose em pacientes idosos.

Este medicamento não deve ser utilizado por mulheres grávidas sem orientação médica ou do cirurgião-dentista.

Categoria de risco: C

USO EM IDOSOS, CRIANÇAS E OUTROS GRUPOS DE RISCO

Uso em crianças: estudos sobre o uso de AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) em crianças são limitados e restringem-se, basicamente, a tratamentos de duração limitada de distonias de causa iatrogênica (por ex.: por neurolépticos, metoclopramida ou compostos análogos), que podem se manifestar como reações adversas ou sintomas de intoxicação. Para crianças deverá ser administrada a forma comprimidos de 2 mg.

Uso em idosos: maior atenção deve ser dispensada aos pacientes com idade avançada, sobretudo, se apresentam sintomas de doenças orgânicas cerebrais. Pacientes idosos são mais suscetíveis a medicação anticolinérgica.



INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

A administração simultânea de AKINETON[®] (cloridrato de biperideno) com outras drogas de efeito anticolinérgico pode potencializar os efeitos colaterais ao nível do Sistema Nervoso Central e periférico. Foram relatados movimentos coreicos na doença de Parkinson quando o biperideno foi associado à carbidopa/levodopa. A administração concomitante de quinidina pode aumentar o efeito anticolinérgico cardiocirculatório (especialmente na condução AV). A ingestão de bebidas alcoólicas deve ser evitada durante o tratamento com AKINETON[®] (cloridrato de biperideno).

REAÇÕES ADVERSAS A MEDICAMENTOS

Estudos Pós-Comercialização

Os efeitos adversos clinicamente significantes são:

Disfunção do sistema imune: hipersensibilidade, incluindo rash cutâneo

Alteração psiquiátrica: foi relatada redução da fase do sono de movimento rápido dos olhos (REM), caracterizada por aumento da latência do REM e redução percentual do sono REM. Foi relatada tolerância a este efeito.

Os efeitos adversos relacionados abaixo são efeitos da classe das drogas anticolinérgicas. A relação de causa e efeito não foi estabelecida.

Alteração psiquiátrica: agitação, confusão, ansiedade, excitação, euforia, delírios, alucinações.

Disfunção do Sistema Nervoso Central: insônia, transtornos ocasionais de memória, ataxia, convulsões.

Disfunção ocular: midríase.

Disfunção cardíaca: taquicardia, bradicardia.

Disfunção gastrintestinal: boca seca, constipação.

Disfunção renal e urinária: retenção urinária.

SUPERDOSAGEM

Sintomas: A intoxicação se parece, a princípio, com a intoxicação atropínica com sintomas anticolinérgicos periféricos (pupilas dilatadas e lentas; secura das mucosas; rubor facial; taquicardia; atonia vesical e intestinal; elevação da temperatura, especialmente em crianças) e transtornos centrais (como excitação, delírio, confusão, obnubilação ou alucinações). Se a intoxicação for maciça há risco de colapso cardíaco e parada respiratória de origem central.



ARMAZENAGEM

AKINETON® (cloridrato de biperideno) deve ser guardado dentro da embalagem original e conservado em temperatura ambiente (entre 15 e 30°C), protegido da luz e da umidade.

MS: 1.0116.0001

Farm. Resp.: Fabio Bussinger da Silva - CRF-RJ 9277

Detentor do registro: **Knoll Produtos Químicos e Farmacêuticos Ltda.**
Estrada dos Bandeirantes, 2400 - Rio de Janeiro -
RJ

CNPJ: 33.258.450/0001-38 - INDÚSTRIA

BRASILEIRA

Fabricado e distribuído por: **Abbott Laboratórios do Brasil Ltda.**

Estrada dos Bandeirantes, 2400 – Rio de
Janeiro – RJ

CNPJ: 56.998.701/0012-79 – INDÚSTRIA
BRASILEIRA

Marca registrada de Abbott GmbH & Co. KG - Ludwigshafen/Reno -
Alemanha

ABBOTT CENTER
Central Interativa
0800 7031050
www.abbottbrasil.com.br

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA.

SÓ PODE SER VENDIDO COM RETENÇÃO DE RECEITA.

Nº de lote, data de fabricação e validade: vide rótulo e cartucho.