



Akineton

Biperideno Clorhidrato 2 mg

Comprimidos

Industria Argentina
EXPENDIO BAJO RECETA ARCHIVADA

FÓRMULA

Cada Comprimido contiene: Biperideno Clorhidrato (equivalente a 1,79 mg de Biperideno) 2 mg. Excipientes: Almidón de Maíz; Celulosa Microcristalina; Estearato de Magnesio; Povidona; Lactosa; Talco.

ACCIÓN TERAPÉUTICA

Antiparkinsoniano. Anticolinérgico. Código ATC: N04AA02.

INDICACIONES

Síndromes parkinsonianos, especialmente para contrarrestar la rigidez muscular y el temblor. Síntomas extrapiramidales tales como la distonía aguda, la acatisia y el síndrome parkinsoniano inducido por neurolepticos y medicamentos que actúan en forma similar.

CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS / PROPIEDADES

Propiedades farmacodinámicas

Mecanismo de acción

El Biperideno es un agente anticolinérgico con un marcado efecto sobre el sistema nervioso central. En comparación con la atropina, posee efectos anticolinérgicos débiles.

Estudios sobre la unión a los receptores muscarínicos humanos muestran una alta afinidad al Biperideno por la subclase M1, la clase principal de receptores muscarínicos en el cerebro.

El temblor causado por agentes colinérgicos de acción central (tremorina, pilocarpina) o la catalepsia y la rigidez muscular producida por la administración de neurolepticos o la reserpina en animales, son favorablemente influenciados por la administración de Biperideno.

Se ha demostrado un efecto activador psicomotor del Biperideno en varios modelos animales.

Propiedades farmacocinéticas

Después de la administración oral, el Clorhidrato de Biperideno (4 mg corresponden a 3,59 mg de Biperideno) es rápidamente absorbido con un tiempo de demora de media hora y una vida media de 0,3 horas.

Las concentraciones plasmáticas pico de alrededor de 4 ng/ml se alcanzan después de aproximadamente 1,5 horas. El volumen aparente de distribución es de $24 \pm 4,1$ litros/kg. El índice de *clearance* plasmático oral es de alrededor de 146 litros/hora; la biodisponibilidad es de alrededor del 33% y la vida media de eliminación es de 21 horas.

Después de una dosis única de 4 mg de Biperideno, la vida media de eliminación plasmática terminal fue de 11 a 21 horas en voluntarios sanos jóvenes y de 24 a 37 horas en pacientes añosos. Las vidas medias en estado constante (Biperideno 2 mg dos veces al día durante seis días) fueron de 16 a 33 horas para los voluntarios jóvenes y de 26 a 41 para los pacientes añosos.

Los pacientes geriátricos demostraron una biodisponibilidad significativamente más alta (área bajo la curva) que los voluntarios jóvenes. El *clearance* plasmático fue de $11,6 \pm 0,8$ ml/minuto/kg de peso corporal.

El Biperideno se une extensamente a las proteínas plasmáticas.

Además de la albúmina, la alfa-1-glicoproteína ácida es otra compañera potencial de unión. El grado de unión, que es independiente de la concentración hasta un nivel muy por encima del nivel terapéutico, es de aproximadamente 95% en los caucásicos y de aproximadamente 90% en los japoneses.

Se desconoce que factor causa esta diferencia. La unión del Biperideno a las proteínas plasmáticas es de 94% en mujeres y de 93% en hombres.

El Biperideno se metaboliza casi completamente. El Biperideno no modificado no se detecta en la orina. El metabolito principal del Biperideno se forma por la hidroxilación en el anillo de bicicloheptano (60%) aunque también se produce cierta hidroxilación en el anillo de piperidina (40%).

Aproximadamente iguales cantidades de los diferentes metabolitos (conjugados y productos de la hidroxilación) son excretados a través de la orina y las heces. No se encuentra disponible información farmacocinética para pacientes con distensión hepática y renal.

POSOLÓGIA / DOSIFICACIÓN - MODO DE ADMINISTRACIÓN

El tratamiento con **Akineton** se debe iniciar gradualmente, aumentando la dosis en función del efecto terapéutico y de los efectos secundarios.

La duración de la terapia dependerá del tipo y evolución de la enfermedad; el tratamiento deberá suspenderse de manera paulatina.

Síndrome parkinsoniano

En adultos, el tratamiento se inicia con una dosis oral de 1 mg (1/2 comprimido de **Akineton** de 2 mg) dos veces al día.

La dosis puede aumentarse a **Akineton** 2 mg (1 comprimido de 2 mg) por día.

La dosis de mantenimiento es de 3 a 16 mg/día (1/2 a 2 comprimidos de **Akineton** de 2 mg, 3 a 4 veces por día).

La dosis diaria máxima es de 16 mg (8 comprimidos de **Akineton** de 2 mg). La dosis total diaria deberá dividirse en forma pareja durante el día.

Síntomas extrapiramidales inducidos por medicamentos

Según la severidad de los síntomas, la dosis para adultos es de 1 a 4 mg (1/2 a 2 comprimidos de **Akineton** de 2 mg) 1 a 4 veces por día como medicación concomitante de los neurolepticos.

Modo de administración

Los comprimidos deben ser ingeridos con algún líquido, preferentemente durante o después de una comida para minimizar efectos adversos intestinales no deseados.

Uso en geriatría

La dosificación se debe vigilar especialmente en los pacientes de edad avanzada, sobre todo, con síntomas orgánicos cerebrales y en pacientes con predisposición elevada a ataques vasculares cerebrales. Los pacientes añosos son más susceptibles a la medicación anticolinérgica.

Uso pediátrico

La dosis recomendada de **Akineton** para niños entre 3 y 15 años con trastornos del movimiento inducido por medicamentos es de 1 a 2 mg (1/2 a 1 comprimido), 1 a 3 veces por día.

CONTRAINDICACIONES

El Biperideno está contraindicado en:

- Hipersensibilidad a la sustancia activa o a cualquiera de los excipientes.
- Glaucoma de ángulo estrecho.
- Obstrucción o estenosis del tracto gastrointestinal.
- Megacolon.

ADVERTENCIAS

Esta droga se deberá administrar con precaución en pacientes con prostatismo, epilepsia o arritmia cardíaca.

Efectos sobre la capacidad de conducir y operar maquinarias

Especialmente cuando el Biperideno es administrado en combinación con otras drogas que actúan a nivel nervioso central, anticolinérgicos o alcohol, los efectos colaterales sobre el sistema nervioso central y periférico pueden disminuir la habilidad para conducir y para operar maquinarias.

PRECAUCIONES

En pacientes con antecedentes de glaucoma se recomienda el control oftalmológico periódico.

Embarazo

Se desconoce si el Biperideno puede causar daño fetal cuando es administrado a mujeres embarazadas o si puede llegar a afectar la capacidad de reproducción. El Biperideno podrá ser administrado a mujeres embarazadas solamente en casos de estricta necesidad.

Lactancia

Los anticolinérgicos inhiben, en ocasiones, la lactancia. No se conoce ningún dato sobre el comportamiento del Biperideno. Su uso se decidirá en estos casos si, a criterio del médico, los beneficios superan los potenciales riesgos. El Biperideno se excreta en la leche materna, alcanzando concentraciones muy similares a las del plasma de la madre.

En general, se recomienda la suspensión de la lactancia, ya que no se conoce la naturaleza ni el grado de metabolización del fármaco en el recién nacido ni se puede descartar un efecto fármaco-toxicológico.

Uso pediátrico

Trastornos del movimiento inducidos por medicamentos: la experiencia con Biperideno en pacientes pediátricos es limitada y se basa, principalmente, en el empleo transitorio de un tratamiento para la distonía provocada por medicamentos por ejemplo las causadas por neurolepticos o metoclopramida y compuestos similares (ver "POSOLOGÍA / DOSIFICACIÓN - MODO DE ADMINISTRACIÓN").

Abuso y drogodependencia

Aunque la información es limitada, se han reportado casos de abuso de Biperideno en la literatura científica.

Interacciones medicamentosas

La administración de Biperideno en combinación con otras drogas con efectos anticolinérgicos puede empeorar los efectos colaterales sobre el sistema nervioso central y periférico.

Se han informado movimientos coreicos generalizados en la enfermedad de Parkinson cuando se coadministra carbidopa / levodopa con Biperideno.

Otros: quinidina y alcohol.

REACCIONES ADVERSAS

Los eventos adversos clínicamente significativos observados durante la vigilancia post-marketing o en estudios clínicos están listados a continuación por sistema corporal:

- **Trastornos del sistema inmune:** hipersensibilidad, incluyendo erupción.
- **Trastornos psiquiátricos:** reducción de la etapa REM del sueño, caracterizado por aumento de la latencia de este período y un menor porcentaje de esta etapa. Se ha informado de tolerancia a este efecto. Los siguientes eventos adversos son propios de las drogas anticolinérgicas. Puede no haberse establecido una relación causa y efecto.
- **Trastornos psiquiátricos:** ansiedad, euforia, agitación, confusión, delirio, alucinaciones.
- **Trastornos del sistema nervioso:** deterioro de la memoria, somnolencia, ataxia, convulsiones.
- **Trastornos oculares:** midriasis.
- **Trastornos cardíacos:** taquicardia, bradicardia.
- **Trastornos gastrointestinales:** boca seca, constipación.
- **Trastornos renales y urinarios:** retención urinaria.

SOBREDOSIFICACIÓN

Síntomas de intoxicación

El cuadro tóxico se asemeja, en principio, al de la intoxicación por atropina y se caracteriza por síntomas anticolinérgicos periféricos (pupilas dilatadas y perezosas, sequedad de mucosas, enrojecimiento facial, aceleración de la frecuencia cardíaca; atonía intestinal y vesical, aumento de la temperatura, sobre todo en los niños) y trastornos del sistema nervioso central (del tipo de excitación, delirio, confusión, alteraciones de conciencia y/o alucinaciones).

En las intoxicaciones masivas puede ocurrir un colapso circulatorio así como paro respiratorio de origen central.

Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al Hospital más cercano o comunicarse las 24 horas del día en Argentina con los Centros de Toxicología:

- Hospital de Niños Ricardo Gutiérrez, Tel.: (011) 4962-6666/2247,
- Hospital Pedro de Elizalde (ex Casa Cuna), Tel.: (011) 4300-2115,
- Hospital Nacional Prof. Dr. Alejandro Posadas, Tel.: (011) 4654-6648 / 4658-7777.

PRESENTACIONES

Envases conteniendo 20 y 60 Comprimidos redondos, lisos, color blanco.

Conservar el producto a una temperatura no mayor de 30 °C. Mantener en su envase original.

AL IGUAL QUE TODO MEDICAMENTO, **AKINETON** DEBEN SER MANTENIDO FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS.

Este medicamento debe ser usado exclusivamente bajo prescripción y vigilancia médica y no puede repetirse sin nueva receta médica.

Especialidad Medicinal autorizada por el Ministerio de Salud. Certificado Nro. 27.969.

Prospecto autorizado por la A.N.M.A.T. Disp. Nro. 472/08.



Ética al servicio de la salud

Administración: Bernardo de Irigoyen Nro. 248 (C1072AAF) Ciudad Autónoma de Buenos Aires. Tel.: (011) 4344-2000/19.

Director Técnico: Juan Manuel Ápella. Farmacéutico.

Calle 4 Nro. 1429 (B1904CIA) La Plata. Pcia. de Buenos Aires. Tel.: (0221) 425-9550/54.