

SOUHRN ÚDAJŮ O PŘÍPRAVKU

1. NÁZEV PŘÍPRAVKU

KINEDRYL

2. KVALITATIVNÍ A KVANTITATIVNÍ SLOŽENÍ

Jedna tableta obsahuje 25 mg moxastin teoklátu (moxastini teoclas) a 30 mg kofeinu (coffeinum anhydricum).

Přípravek obsahuje monohydrát laktosy.

Úplný seznam pomocných látek viz bod 6.1.

3. LÉKOVÁ FORMA

Tableta.

Bílé kulaté ploché tablety se zkosenými hranami opatřené na jedné straně čtvrtícím znakem.

Tabletu lze dělit na čtyři stejné části nebo dvě stejné poloviny.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikace

Profylaxe a léčba kinetos (nevolnost při jízdě automobilem, letadlem, vlakem, lodí). Terapie vertiga, nauzey a vomitu při vestibulárních poruchách. Antivertiginózní účinek se využívá při léčbě Meniérovoy choroby.

4.2 Dávkování a způsob podání

Dávkování a doba léčby jsou inividuální a závisí na indikaci, klinickém obrazu a citlivosti pacienta.

Dospělí

1 tableta 60 minut před začátkem cesty. Při dlouhotrvajícím cestování stačí podávat $\frac{1}{2}$ – 1 tabletu v intervalu 2 – 3 hodin. V terapii akutně vzniklé kinetosisy se užívají 2 tablety jednorázově, při nedostatečném účinku potom v intervalech 30 minut $\frac{1}{2}$ – 1 tabletu až po maximálně 4 tablety. Při náhlém zvracení je účelnější počáteční dávku 2 tablet nepodat najednou, ale rozdělenou do 4 dávek v intervalu několika minut.

Děti do 15 let

Dětem ve věku 2 – 6 let se podává $\frac{1}{4}$ tablety, ve věku 6 – 15 let $\frac{1}{4}$ - $\frac{1}{2}$ tablety. První dávka se užije 60 minut před začátkem cesty, při dlouhotrvajícím cestování se může podání dvakrát zopakovat v intervalu 2 – 3 hodin.

Děti do 2 let

Přípravek Kinedryl se nemá podávat dětem do 2 let.

Meniérova choroba a další vestibulární poruchy

Dospělí ležící pacienti užívají 2 – 4 tablety 2 – 3 krát denně. U ostatních se podává až 8 tablet denně.

Tabletu je potřebné zapít dostatečným množstvím tekutiny.

4.3 Kontraindikace

Hypersenzitivita na léčivé látky nebo na kteroukoli pomocnou látku tohoto přípravku, akutní intoxikace léky tlumícími CNS, terapie inhibitory MAO včetně období 14 dní po jejím ukončení, glaukom s úzkým úhlem, retence moči při obstrukci močových cest, hypertrofie prostaty, obstrukce trávicího systému, ulcerózní kolitida, gravidita a laktace, děti ve věku do 2 let.

Kinedryl je nevhodný ve všech případech, kde je nežádoucí únava a ospalost.

Opatrnosti je třeba u epilepsie.

4.4 Zvláštní upozornění a opatření pro použití

Současným užitím alkoholu a léků s tlumivým účinkem se zvýrazní tlumivý účinek přípravku na CNS i při běžném dávkování. Při dlouhodobějším užívání je nutno akceptovat snižování účinnosti nepřímých antikoagulancií, je nutné sledovat hemokoagulační parametry, při podávání perorálních antidiabetik je nutná kontrola glykémie a případná úprava terapie.

Zvýšená opatrnost je potřeba při podání léků pacientům se závažným kardiovaskulárním onemocněním a epilepsií, peptickým vředem, hyperfunkcí štítné žlázy, při těžké poruše funkcí jater, při akutních horečnatých stavech, při závažné hypoxii a cor pulmonale.

U dětí je možný vznik excitace a výskyt křečí.

Starší lidé mají zvýšenou citlivost na anticholinergní účinky přípravku (sucho v ústech, poruchy mikce), může u nich vzniknout zmatenost, hypotenze, ale i paradoxní excitační reakce.

Lék může ovlivnit pozitivitu alergenových kožních testů, proto je potřeba Kinedryl několik dní před testy nepodávat.

Během terapie přípravkem Kinedryl je třeba vyvarovat se pití alkoholických nápojů.

Přípravek může v ojedinělých případech provokovat status epilepticus.

Tento léčivý přípravek obsahuje monohydrát laktózy. Pacienti se vzácnými dědičnými problémy s intolerancí galaktózy, Lappovým nedostatkem laktázy nebo malabsorpcí glukózy a galaktózy by tento přípravek neměli užívat.

4.5 Interakce s jinými léčivými přípravky a jiné formy interakce

Lék zvyšuje sedativní účinek jiných centrálně tlumivých látek včetně alkoholu, hypnotik, sedativ a spazmolytik. Moxastin teoklát potencuje antimuskarinový účinek ostatních antimuskarinik jako je atropin a tricyklická antidepresiva. Snižuje účinek nepřímých antikoagulancií, perorálních antidiabetik, hydantionů, steroidů a steroidních kontraceptiv. Účinnost léku zvyšují inhibitory monoaminoxidázy a inhibitory acetylcholinesterázy, hypnosedativní působení zvyšuje zejména alkohol, hypnotika, sedativa, neuroleptika a anxiolytika. Účinnost léku snižují barbituráty a pyrazolonové deriváty. Při současném podání kofeinu a sympatomimetik nebo jiných xantinových derivátů se zvýrazňují jejich bronchodilatační a nežádoucí účinky.

4.6 Těhotenství a kojení

Moxastin teoklát i kofein procházejí placentární bariérou a do mateřského mléka.

Podávání přípravku Kinedryl je v graviditě a v průběhu laktace kontraindikované.

4.7 Účinky na schopnost řídit a obsluhovat stroje

Kinedryl ovlivňuje nepříznivě pozornost pacienta a jeho schopnost soustředění. Tlumivý účinek se i při běžném dávkování projevuje ospalostí a malátností. Pacientova schopnost obsluhovat stroje, pracovat ve výškách nebo řídit vozidla může být při použití přípravku Kinedryl negativně ovlivněna. Přípravek Kinedryl není určen pro řidiče, piloty letadel a obsluhu strojů.

4.8 Nežádoucí účinky

Nežádoucí účinky se vyskytují u 20 – 30 % pacientů. Projevují se celkovým útlumem, spavostí, slabostí, poruchami koncentrace.

Výjimečně se může rozvinout zvýšená podrážděnost a bolest hlavy, sucho v ústech, snížená sekrece bronchů, zastřené vidění, těžkosti s močením a retence moči, obstipace, zvýšení žaludečního refluxu. Starší lidé jsou citlivější na nežádoucí účinek antihistaminik, včetně antimuskarinového účinku, sedace a hypotenze. Při vyšších dávkách mohou nastat poruchy srdečního rytmu.

Ve vyjimečných případech může u citlivějších osob užití léku vyvolat místní podráždění trávicího traktu, které se může projevit průjmem, zácpou, případně nauzeou.

V ojedinělých případech se mohou vyskytnout hypersenzitivní reakce většinou s kožními projevy.

Velmi vzácné jsou prouchy krvetvoby s agranulocytózou, leukopenií a trombocytopenií, které vznikají na imunologickém podkladě.

Zejména u mladších dětí může dojít k paradoxní excitaci a vzácně i ke vzniku epileptických paroxysmů.

4.9 Předávkování

Projevuje se antimuskarinovou, gastrointestinální, extrapyramidovou a další CNS symptomatikou. U dětí převažuje stimulace CNS nad útlumem – ataxie, excitace, halucinace, křeče, tremor, psychotické projevy. Může nastat hyperpyrexie. Následuje kóma a kardiopulsační kolaps. U dospělých nastává častěji útlum CNS – ospalost, malátnost, křeče. V závažnějších případech nastává respirační selhání, pruchy elektrolytové rovnováhy a kardiopulsační kolaps.

K základním opatřením při předávkování nebo intoxikaci patří přerušování terapie a v případě potřeby dostatečná ventilace a oxygenace, výplach žaludku, podání salinických projímadel. Možné je podání aktivního uhlí v obvyklých dávkách (úvodní dávka 25 – 100 g, v případě potřeby dále 12,5 g každou hodinu, nebo 25 g každé 2 hodiny, či 50 g každé 4 hodiny).

Při výskytu epileptických paroxysmů je potřeba aplikovat benzodiazepiny (např. diazepam nitrožilně, nitrosvalově či rektálně).

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: antiemetikum, antivertiginózum

ATC kód: A04AD

Moxastin teoklát je molekulární komplex moxastinu [2-(1,1-difenylethoxy)-N,N-dimethylethylamin] s 8-chlor-teofylinem, který má výrazně antiemetický a antivertiginózní účinek. Ten je dán přímým snížením dráždivosti centra pro zvracení v prodloužené míše na podněty ze spouštěcí zóny a též snížením vnímavosti organismu vůči podnětům, které u citlivých lidí vyvolávají akutní poruchy vegetativních funkcí projevující se nauzeou a zvracením.

Kofein je psychostimulans, inhibitor fosfodiesterázy, které je v přípravku Kinedryl obsaženo jako adjuvans mírnící sedativní až hypnotické účinky moxastinu.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Moxastin teoklát se podobně jako ostatní H₁-antihistaminika relativně rychle absorbuje a distribuuje do tkání. Účinek moxastin teoklátu nastupuje během 10 až 15 minut, maximálního účinku je dosaženo do 1 hodiny a tento účinek setrvává přibližně 2 hodiny. Distribuuje se do celého organismu, přechází přes všechny bariéry a do mateřského mléka. Metabolizuje se v játrech mikrozomálním enzymatickým systémem a vylučuje se močí.

Kofein se rychle absorbuje z gastrointestinálního traktu, rozsáhle se distribuuje v organismu, rychle vstupuje do CNS a do slin. Prostupuje přes placentární a hematoencefalickou bariéru. Do mateřského mléka přestupuje v koncentracích, které odpovídají 50 – 76 % koncentrací plazmatických. Váže se z 25 – 35 % na plazmatické bílkoviny. Biotransformuje se v játrech (80 %) a močí se vylučuje řada metabolitů (asi 4 % ve formě teofylinu). 1 % se vylučuje ve formě nezměněné látky. Biologický poločas eliminace kofeinu je 3 – 7 hodin.

5.3 Předklinické údaje vztahující se k bezpečnosti

Byla stanovena akutní toxicita LD₅₀ přípravku Kinedryl vztažená na moxastin teoklát:

na potkanech p. o. 273 mg.kg⁻¹, na samicích potkana i. p. 101 mg.kg⁻¹, na králících p. o. 184 mg.kg⁻¹ u samců a 196 mg.kg⁻¹ u samic, na králících i. p. 96 mg.kg⁻¹ u samců a 86 mg.kg⁻¹ u samic.

Předklinickými a toxikologickými studii, studii mutagenity a imunotoxicity byla prokázána bezpečnost léku. Podávání přípravku Kinedryl ve vysokých dávkách nezpůsobilo narušení morfologie sledovaných orgánů, ani nevyvolalo mutagenní účinek. Bezpečnost léku byla prověřena též dlouholetým používáním v klinické praxi bez zaznamenání vážných nežádoucích účinků.

6. FARMACEUTICKÉ ÚDAJE

6.1 Seznam pomocných látek

Monohydrát laktózy, kukuřičný škrob, mastek, stearan vápenatý.

6.2 Inkompatibility

Neuplatňuje se.

6.3 Doba použitelnosti

4 roky.

6.4 Zvláštní opatření pro uchovávání

Uchovávejte při teplotě do 25 °C v původním obalu , aby byl přípravek chráněn před světlem a vlhkostí.

6.5 Druh obalu a velikost balení

Blistr (bezbarvý průhledný PVC/Al), krabička.

Velikost balení 10 tablet.

6.6 Zvláštní opatření pro likvidaci přípravku a pro zacházení s ním

Žádné zvláštní požadavky.

7. DRŽITEL ROZHODNUTÍ O REGISTRACI

Noventis, s. r. o.

Filmová 174

761 79 Zlín

Česká republika

8. REGISTRAČNÍ ČÍSLO(A)

20/195/69-S/C

9. DATUM PRVNÍ REGISTRACE/PRODLOUŽENÍ REGISTRACE

září 1969 / 15.12. 2010

10. DATUM REVIZE TEXTU

15.12. 2010