

VALMISTEYHTEENVETO

1. LÄÄKEVALMISTEEN NIMI

Zopiclone Actavis 5 mg tabletti
Zopiclone Actavis 7,5 mg tabletti

2. VAIKUTTAVAT AINEET JA NIIDEN MÄÄRÄT

Tsopikloni 5 mg tai 7,5 mg

Apuaineet, ks. kohta.6.1.

3. LÄÄKEMUOTO

Tabletti.

5 mg: Valmisteen kuvaus: keltainen tabletti, jossa merkintä ZOC5.

7,5 mg: Valmisteen kuvaus: valkoinen, jakourallinen, jossa merkintä ZOC7.5

4. KLIINISET TIEDOT

4.1 Käyttöaiheet

Tilapäinen ja/tai lyhytaikainen unettomuus, joka ilmenee nukahtamisvaikeuksina, toistuvina yöllisinä heräämisinä ja/tai liian varhaisina aamuhäämöinä. Unihäiriöiden hoito psykiatrisissa sairauksissa yhdistettynä perussairauden asianmukaiseen lääkkitykseen ja hoitoon.

4.2 Annostus ja antotapa

Hoidon kesto pyritään pitämään mahdollisimman lyhyenä.

Yleensä 5-7,5 mg juuri ennen nukkumaanmenoa. Tavallinen aikuisten annos on 7,5 mg.

Maksimiannos on 15 mg.

Lievästä, tilapäisestä unettomuudesta kärsivillä sekä vanhuksilla ja heikkokuntoisilla 3,75-5 mg on usein riittävä annos. Vaikeassa maksan tai munuaisten vajaatoiminnassa sekä kroonisessa hengitysvajauksessa annostus on 3,75 mg.

Ei lapsille.

4.3 Vasta-aiheet

Myasthenia gravis.

Vaikea uniapnea.

Yliherkkyys tsopiklonille.

4.4 Varoitukset ja käyttöön liittyvät varotoimet

Riippuvuus:

Tsopiklonin käyttö voi johtaa fyysiseen ja psyykkiseen riippuvuuteen. Riippuvuuden kehittymisen riski lisääntyy annoksen ja käyttökertojen lisääntyessä. Jos fyysinen riippuvuus on jo kehittynyt, äkillinen käytön keskeyttäminen voi aiheuttaa vieroitusoireita, kuten päänsärkyä, lihaskipuja, väkivaltaista tuskaisuutta, jännittyneisyyttä, levottomuutta, sekavuutta ja ärtyneisyyttä.

Tsopiklonin käyttö tulisi olla mahdollisimman lyhytaikaista. Jo hoidon alussa potilasta olisi syytä informoida tästä ja kertoa, että lääkehoito lopetetaan vähentämällä annosta asteittain.

Amnesia:

Tsopikloni voi aiheuttaa anterogradista amnesiaa eli tiettyyn ajanjaksoon kohdistuvaa muistamattomuutta, joka voi ilmetä useiden tuntien jälkeen lääkkeen nauttimisesta. Siksi potilaille tulisi varmistaa mahdollisuus 7-8 tunnin häiriintymättömään uneen lääkkeen nauttimisen jälkeen.

Psykiatriset ja paradoksaaliset reaktiot, varsinkin vanhuksilla ovat mahdollisia.

Tsopikloni ei ole primaarihoito psykooseissa tai vaikeassa depressiossa, vaan taustalla oleva sairaus on hoidettava asianmukaisesti.

4.5 Yhteisvaikutukset muiden lääkevalmisteiden kanssa sekä muut yhteisvaikutukset

Alkoholin tai keskushermostoa lamaavien lääkeaineiden samanaikaista käyttöä ei suositella, koska keskushermostoa lamaava vaikutus voi vahvistua. Keskushermostoa lamaavan vaikutuksen korostuminen on mahdollista käytettäessä samanaikaisesti neurolepteja, muita unilääkkeitä, anksiolyyttejä/sedatiiveja, masennuslääkkeitä, euforisoivia analgeetteja, epilepsialääkkeitä, anestesia-aineita ja väsyttäviä antihistamiineja.

Opioidien ja tsopiklonin yhteisvaikutuksena voi olla euforian lisääntyminen, joka myös lisää psyykkisen riippuvuuden riskiä.

Rifampisiini voi heikentää tsopiklonin tehoa nopeuttamalla metaboliaa.

Erytromysiinin vaikutusta tsopiklonin farmakokinetiikkaan on tutkittu kymmenellä terveellä koehenkilöllä. Tsopiklonin AUC-arvo kasvoi 80 % käytettäessä samanaikaisesti erytromysiiniä, mikä osoittaa, että erytromysiini voi estää niiden lääkkeiden metaboliaa, jotka metaboloituvat CYP3A4:n kautta. Sen seurauksena tsopiklonin hypnoottinen vaikutus saattaa voimistua.

Lääkeaineet, jotka hidastavat mahan tyhjentymistä, saattavat hidastaa tsopiklonin imeytymistä ja unilääkevaikutusta.

4.6 Raskaus ja imetys

Vaikka tsopiklonilla ei ole eläinkokeissa ilmennyt teratogeenisia vaikutuksia, tulisi käyttöä erityisesti raskauden ensimmäisen kolmanneksen aikana välttää.

Koska tsopiklonia erittyy pieniä määriä äidinmaitoon, ei sitä tulisi käyttää imetyksen aikana.

4.7 Vaikutus ajokykyyn ja koneiden käyttökykyyn

Lääke voi haitata suorituskykyä liikenteessä.

Vaikka tsopiklonin jälkivaikutukset seuraavana aamuna ovat olleet vähäisiä, suorituskyky liikenteessä ja tarkkuutta vaativien laitteiden käytössä voi olla alentunut.

4.8 Haittavaikutukset

Kitkerä maku on tsopiklonin yleisin haittavaikutus.

Muita ilmoitettuja haittatapahtumia ovat:

- huimaus, päänsärky, residuaalinen uneliaisuus
- dyspepsia, pahoinvointi, suun kuivuminen

- allergiset reaktiot tai iho-oireet, kuten kutina tai ihottuma.

Amnesia.

Anterogradista amnesiaa voi esiintyä (ks. kohta Varoitukset ja käyttöön liittyvät varotoimet).

Psykiatriset ja paradoksaaliset reaktiot.

Harvinaisina painajaisunet, ärtyvyys, sekavuus, hallusinaatiot, aggressiivisuus, epätarkoituksenmukainen käyttäytyminen mahdollisesti amnesiaan liittyen.

Vieroitus- ja rebound-unettomuutta on todettu satunnaisesti hoidon lopettamisen yhteydessä.

Seerumin transaminaasien ja/tai alkaalisen fosfaatin pitoisuudet ovat kasvaneet hieman tai kohtalaisesti erittäin harvoin.

4.9 Yliannostus

Eläinkokeet ovat osoittaneet tsopiklonin olevan turvallisuudeltaan bentsodiatsepiinien luokkaa.

Yliannostuksen oireita ovat tokkuraisuus, uneliaisuus, vaikeammassa tapauksessa ilmenee ataksiaa, hypotoniaa, hypotensiota, hengitysvaikeuksia, harvoin kooma ja jopa kuolema.

Yliannostuksen hoitona on oksennuttaminen ja lääkehiili tai mahahuuhtelu vähintään 1 tunnin kuluessa, koska tsopikloni imeytyy nopeasti ruoansulatuskanavasta.

Muuten hoito on oireenmukaista. Hengitystä sekä sydämen toimintaa tulisi seurata huolella.

Tehostetusta diureesista voi olla apua eliminaation nopeuttamisessa.

Antidootti on flumatseniili.

5. FARMAKOLOGISET OMINAISUUDET

5.1 Farmakodynamiikka

Farmakoterapeuttinen ryhmä: Bentsodiatsepiinien kaltaiset lääkkeaineet. ATC-koodi: N05CF01

Tsopikloni on syklopyrrolonien ryhmään kuuluva aine. Vaikka tsopikloni poikkeaa rakenteellisesti bentsodiatsepiineista se vaikuttaa bentsodiatsepiinien tavoin keskushermostossa GABA-ergiseen järjestelmään muunnellen reseptorivälitteisesti sen toimintaa. Tsopikloni vaikuttaa nukahtamista nopeuttavasti ja unta ylläpitävästi. Se ei vähennä REM-unen kokonaismäärää ja saattaa jopa pidentää syvän unen kestoa. Tsopiklonilla on myös vähäinen anksiolyyttinen, antikonvulsiivinen ja lihaksia relaksoiva vaikutus. Terapeuttisilla annoksilla tsopiklonilla ei ole vaikutuksia hengitystoimintaan tai sydämen toimintaan.

5.2 Farmakokinetiikka

Imeytyminen: Tsopiklonin imeytyy nopeasti ruoansulatuskanavasta ja vaikutus alkaa 15-20 minuutissa. Huippupitoisuus plasmassa saavutetaan 1 -1,5 tunnin kuluessa. Ikä tai sukupuoli eivät vaikuta imeytymiseen. Annoksesta 3,75 mg - 15 mg imeytyy noin 30-110 ng/ml. Biologinen hyväksikäytettävyys oraalisen annon jälkeen on noin 80%.

Jakautuminen: Tsopikloni jakautuu nopeasti. Jakautumistilavuus on 1,3 l/kg ja proteiineihin sitoutumisaste noin 45 %.

Metabolia: Tärkeimmät metaboliitit ovat N-oksidi- ja N-desmetyylimetaboliitit, joista ensin mainittu on osoittautunut farmakologisesti aktiivisesti eläimillä. N-oksidin eliminaation puoliintumisaika on noin 4,5 tuntia.

Erittyminen: Annetusta tsopikloniannoksesta noin 80 % erittyy metaboliitteina virtsaan, noin 16 % ulosteeseen ja noin 4 % muuttumattomana, munuaisten kautta.

Maksakirroosipotilailla ja vanhuksilla puoliintumisaika saattaa pidentyä 8 tuntiin.

Pitkäaikaisessa käytössä eikä munuaisten vajaatoiminnassa kumuloitumista ei ole havaittu.

5.3 Prekliiniset tiedot turvallisuudesta

Subakuutteja tai kroonisia toksisuustutkimuksia rotilla ei ole saatavilla. Beagle-koirilla tehty kuukauden ja 6 kuukauden toksisuustutkimus osoitti maksavaurioita sekä vaikutuksia punaisiin verisoluihin (anemia ja hemosideroosi pernassa). Annostaso, jolla ei näitä vaikutuksia enää esiintynyt on 5 mg/kg/päivä.

Koirasrotilla tehty tutkimus osoitti infertiliteettiä ja siittiökuolleisuutta annoksella 50 mg/kg/päivä. Vaikutukset siittiöihin olivat reversiibeilejä 2 viikon jälkeen. Annostaso, jolla ei näitä vaikutuksia enää esiintynyt on 10 mg/kg/päivä.

Rotilla ja apinoilla tehdyt tutkimukset osoittavat, että tsopikloni ei ole teratogeeninen.

Mutageenisia tai karsinogeenisiä vaikutuksia ei ole havaittu.

6. FARMASEUTTISET TIEDOT

6.1 Apuaineet

Laktoosimonohydraatti (30,8mg)

Kalsiumvetyfosfaattidihydraatti

Maissitärkkelys

Karmelloosinatrium

Magnesiumstearaatti

Titaanidioksidi (E171)

Hypromelloosi

5 mg: Keltainen rautaoksidi (E172).

6.2 Yhteensopimattomuudet

Ei ole

6.3 Kesto aika

5 mg: 4 vuotta

7,5mg: 3 vuotta

6.4 Säilytys

Säilytetään alle +25°C

6.5 Pakkaustyypit ja pakkauskooot

10, 30 ja 100 tabl. läpipainopakkauksissa (PVC/PVDC/Al)

6.6 Käyttö- ja käsittelyohjeet

Ei ole.

7. MYYNTILUVAN HALTIJA

Actavis Group hf.,
Reykjavikurvegi 76-78
IS-220 Hafnarfjordur
Islanti

8. MYYNTILUVAN NUMERO

5 mg: 13328
7,5 mg: 13329

9. MYYNTILUVAN MYÖNTÄMISPÄIVÄMÄÄRÄ/ UUDISTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ

02.11.1998/02.11.2003/02.11.2008

10. TEKSTIN MUUTTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ

10.11.2006