

SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

1. NÁZOV LIEKU

Zopiclone Baltijos Bite 3,75 mg filmom obalené tablety

Zopiclone Baltijos Bite 5 mg filmom obalené tablety

Zopiclone Baltijos Bite 7,5 mg filmom obalené tablety

2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

Každá filmom obalená tableta obsahuje 3,75 mg, 5 mg a 7,5 mg zopiklónu.

Pomocné látky so známym účinkom

Každá 5 mg filmom obalená tableta obsahuje 0,0017 mg košenilovej červene (E124).

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1.

3. LIEKOVÁ FORMA

Filmom obalená tableta (tableta).

Zopiclone Baltijos Bite 3,75 mg sú biele okrúhle bikonvexné filmom obalené tablety s hladkým povrchom; priemer tablety je približne 5 mm.

Zopiclone Baltijos Bite 5 mg sú modré okrúhle bikonvexné filmom obalené tablety s hladkým povrchom; priemer tablety je približne 6 mm.

Zopiclone Baltijos Bite 7,5 mg sú biele okrúhle filmom obalené tablety s hladkým povrchom, konvexné na jednej strane a s jamkou s deliacou ryhou na druhej strane; priemer tablety je približne 7 mm. Tableta sa môže rozdeliť na rovnaké dávky.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikácie

Zopiklón je indikovaný na krátkodobú liečbu nespavosti u dospelých.

Benzodiazepíny a látky podobné benzodiazepínom sú indikované iba vtedy, ak je porucha závažná, hendikepujúca alebo predstavuje pre jedinca extrémnu záťaž.

4.2 Dávkovanie a spôsob podávania

Dávkovanie

Dospelí

Doba liečby má byť čo najkratšia. Má sa použiť najnižšia účinná dávka.

Zvyčajná začiatková dávka je 5 mg ako jednorazová dávka pred spaním a nemá sa užiť znova počas tej istej noci. U pacientov, ktorí na túto dávku nereagujú, možno dávku zvýšiť na 7,5 mg.

Dávka nemá prekročiť 7,5 mg denne.

Trvanie liečby

Doba liečby má byť čo najkratšia (niekoľko dní až 2 týždne) a nie dlhšia ako 4 týždne vrátane obdobia postupného znižovania dávky. V niektorých prípadoch môže byť potrebné predĺžiť liečbu nad

maximálnu dobu liečby; toto sa však nemá uskutočniť bez prehodnotenia stavu pacienta, pretože s dávkou a dĺžkou liečby sa zvyšuje riziko závislosti alebo zneužívania (pozri tiež časť 4.4).

Osobitné skupiny pacientov

Starší pacienti

Zvyčajná začiatková dávka pre starších pacientov je 3,75 mg. Dávka sa môže neskôr zvýšiť na 5 mg a v prípade potreby až na 7,5 mg.

Porucha funkcie obličiek

U pacientov so zníženou funkciou obličiek sa odporúča začať liečbu dávkou 3,75 mg, hoci sa u tejto skupiny pacientov nezistila žiadna akumulácia zopiklónu alebo jeho metabolitov.

Porucha funkcie pečene alebo chronické respiračné zlyhávanie

Liečba sa má začať dávkou 3,75 mg. Dávka sa môže neskôr zvýšiť na 5 mg a v prípade potreby až na 7,5 mg.

Pediatrická populácia

Zopiclone Baltijos Bite sa nemá podávať deťom a dospievajúcim mladším ako 18 rokov. Bezpečnosť a účinnosť zopiklónu v tejto vekovej skupine neboli stanovené.

Spôsob podávania

- Perorálne použitie.
- Tableta sa má užiť večer pred spaním.
- Tablety sa majú užívať vo vzpriamenej polohe, pretože v ležiacej polohe môže byť absorpcia oneskorená.

4.3 Kontraindikácie

- Precitlivosť na liečivo alebo na ktorúkoľvek z pomocných látok uvedených v časti 6.1.
- Závažná hepatálna insuficiencia.
- Syndróm spánkového apnoe.
- Myasténia gravis.
- Závažná respiračná insuficiencia.
- Predchádzajúca skúsenosť so správaním súvisiacim so spánkom po užití zopiklónu (pozri časť 4.4).

4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní

Pred začatím liečby zopiklónom sa má starostlivo vyriešiť akákoľvek základná príčina nespavosti.

Zopiclone Baltijos Bite sa má používať opatrne u pacientov s anamnézou zneužívania alkoholu alebo liekov. Je potrebné vyhnúť sa súbežnej konzumácii alkoholu.

Závislosť

Liečba sedatívami/hypnotikami, ako je zopiklón, môže viesť k fyzickej alebo psychickej závislosti alebo zneužívaniu týchto látok.

Riziko závislosti alebo zneužívania sa zvyšuje s dávkou a dĺžkou liečby. Riziko závislosti alebo zneužívania je vyššie tiež u pacientov s anamnézou zneužívania alkoholu alebo liekov a ak sa zopiklón užíva v kombinácii s alkoholom alebo inými psychotropnými liekmi.

Ak sa objaví fyzická závislosť, náhle ukončenie liečby môže viesť k abstinenčným príznakom, ktoré môžu zahŕňať nespavosť, bolesť hlavy, bolesť svalov, extrémnu úzkosť, napätie, nepokoj, zmätenosť a podráždenosť. V závažných prípadoch sa môžu vyskytnúť nasledujúce príznaky: depersonalizácia, derealizácia, hyperakúzia, necitlivosť a brnenie končatín, precitlivosť na svetlo, hluk a fyzický kontakt, halucinácie alebo epileptické záchvaty.

Abstinénčné príznaky sa môžu objaviť v priebehu niekoľkých dní po ukončení liečby. Pri krátkodobom pôsobiacich benzodiazepínoch, a najmä ak sa podávajú vo vysokých dávkach, sa príznaky môžu objaviť aj počas intervalu medzi dávkami.

Rebound nespavosť

Prechodný syndróm, pri ktorom sa príznaky, ktoré viedli k liečbe sedatívami/hypnotikami, po prerušení liečby objavujú vo výraznejšej forme. Riziko výskytu týchto príznakov je väčšie pri náhlom vysadení, najmä po dlhodobej liečbe liekmi na spanie. Preto sa odporúča, aby o tom bol pacient informovaný a aby mu dávka bola znižovaná postupne (pozri tiež časť 4.8 Nežiaduce účinky). Liečba liekmi na spanie má byť dočasná alebo prerušovaná, aby sa znížilo riziko abstinénčných problémov.

Trvanie liečby

Dĺžka liečby má byť čo najkratšia (pozri časť 4.2), ale nie dlhšia ako 4 týždne vrátane obdobia postupného znižovania dávky. Toto obdobie sa môže prekročiť až po prehodnotení stavu pacienta. Je vhodné pacienta na začiatku liečby informovať, že liečba je krátkodobá, a presne mu vysvetliť, ako sa bude dávka postupne znižovať.

Je tiež dôležité upozorniť na možnosť rebound efektu, aby sa pacient pri vysadení liečby týmito príznakmi zbytočne neznepokojoval.

Psychomotorické poruchy

Ako iné sedatíva/hypnotiká má aj zopiklón tlmivé účinky na CNS. V priebehu niekoľkých hodín po podaní sa pravdepodobne objavia zmeny v psychomotorických funkciách. Riziko psychomotorických porúch, vrátane schopnosti viesť vozidlá, sa zvyšuje v nasledujúcich situáciách:

- užitie lieku menej ako 12 hodín pred vykonávaním činnosti vyžadujúcej bdelosť (pozri časť 4.7);
- prekročenie odporúčanej dávky;
- súbežné podávanie s inými liekmi tlmiacimi CNS, alkoholom, nelegálnymi látkami alebo inými liekmi, ktoré zvyšujú koncentráciu zopiklónu v krvi (pozri časť 4.5).

Pacientov treba upozorniť, aby po užití zopiklónu, a najmä počas prvých 12 hodín po podaní, nevykonávali nebezpečné činnosti, ktoré si vyžadujú plnú pozornosť alebo motorickú koordináciu (napr. obsluha strojov alebo vedenie vozidla).

Anterográdna amnézia

Môže sa vyskytnúť anterográdna amnézia, najmä ak je spánok prerušovaný alebo ak sa po užití lieku Zopiclone Baltijos Bite oneskorí zaspávanie. Anterográdna amnézia sa môže objaviť v priebehu niekoľkých hodín po podaní.

Na zníženie rizika anterogradnej amnézie sa má pacientovi odporučiť, aby:

- užil tabletu tesne pred spaním alebo až v posteli;
- vytvoril čo najpriaznivejšie podmienky pre plnohodnotný nočný spánok (7-8 hodín).

Tolerancia

Hypnotický účinok krátkodobu pôsobiacich benzodiazepínov a látok podobných benzodiazepínom sa môže znížiť po opakovanom použití počas niekoľkých týždňov. Avšak v prípade zopiklónu sa počas liečby trvajúcej až 4 týždne nevyskytla žiadna výrazná tolerancia.

Somnambulizmus a pridružené správanie

U pacientov, ktorí užili prvú alebo akúkoľvek ďalšiu dávku zopiklónu a neboli dostatočne prebudení, boli hlásené prípady somnambulizmu a iného správania súvisiaceho so spánkom, ako je „vedenie vozidla v spánku“, príprava a konzumácia jedla, sex alebo telefonovanie v spánku, s amnéziou na túto udalosť. Pacienti si tieto udalosti zvyčajne nepamätajú.

Počas správania súvisiaceho so spánkom môžu pacienti vážne zraniť seba alebo inú osobu. Takéto zranenia môžu mať fatálne následky.

Riziko výskytu takéhoto správania sa môže zvýšiť pri užití zopiklónu spolu s alkoholom alebo inými látkami tlmiacimi CNS alebo pri prekročení maximálnej odporúčanej dávky. U pacientov, ktorí hlásia takéto správanie, je potrebné dôkladne zvážiť ukončenie liečby (pozri časť 4.5).

Iné psychiatrické a paradoxné reakcie

Počas liečby benzodiazepínmi a látkami podobnými benzodiazepínom sa môžu vyskytnúť reakcie, ako nepokoj, vzrušenosť, podráždenosť, agresivita, bludy, hnev, nočné mory, halucinácie, psychóza, abnormálne správanie a iné poruchy správania. V takom prípade sa musí podávanie lieku ukončiť. Tieto reakcie sa vyskytujú častejšie u starších pacientov.

Samovražda / Depresia / Epizódy depresívnej poruchy

Niektoré epidemiologické štúdie ukazujú zvýšený výskyt samovražedných myšlienok, pokusov o samovraždu a samovrážd u pacientov s depresiou alebo bez nej, ktorí sú liečení benzodiazepínmi a inými hypnotikami, vrátane zopiklónu. Kauzálny vzťah sa však nepotvrdil.

Tak ako u iných hypnotík zopiklón nepredstavuje liečbu depresie, a dokonca môže maskovať jej príznaky (u týchto pacientov môže dôjsť k samovražde).

Pacienti s epizódami depresívnej poruchy

Benzodiazepíny a lieky podobné benzodiazepínom sa nemajú predpisovať ako monoterapia, pretože to môže umožniť rozvinutie a pretrvávanie už existujúcej depresie, čo vedie k zvýšenému riziku samovraždy.

Vzhľadom na riziko samovraždy sa má u týchto pacientov použiť najnižšia možná dávka zopiklónu, aby sa predišlo možnosti úmyselného predávkovania.

Riziká súčasného užívania opioidov

Súčasné užívanie lieku Zopiclone Baltijos Bite a opioidov môže mať za následok sedáciu, útlm dýchania, kómu a smrť. Vzhľadom na tieto riziká má byť súbežné predpisovanie sedatív, ako sú benzodiazepíny alebo podobné lieky, ako je Zopiclone Baltijos Bite, spolu s opioidmi vyhradené pre pacientov, u ktorých nie sú alternatívne možnosti liečby. V prípade rozhodnutia predpísať Zopiclone Baltijos Bite súčasne s opioidmi sa má použiť najnižšia účinná dávka a dĺžka liečby má byť čo najkratšia (pozri tiež všeobecné odporúčanie pre dávkovanie v časti 4.2).

U pacientov sa majú pozorne sledovať prejavy a príznaky útlmu dýchania a sedácie. V tejto súvislosti sa dôrazne odporúča informovať pacientov a ich opatrovateľov (ak je to vhodné), aby si boli vedomí týchto príznakov (pozri časť 4.5).

Osobitné skupiny pacientov

Porucha funkcie pečene

Odporúča sa zníženie dávky, pozri časť 4.2. Benzodiazepíny nie sú indikované na liečbu pacientov s ťažkou poruchou funkcie pečene, pretože môžu vyvolať encefalopatiu (pozri časť 4.3).

Respiračná insuficiencia

Kvôli riziku respiračnej depresie sa u pacientov s chronickou respiračnou insuficienciou odporúča nižšia dávka.

Porucha funkcie obličiek

Odporúča sa zníženie dávky (pozri časť 4.2).

Starší pacienti

Starším pacientom sa má podávať nižšia dávka (pozri časť 4.2). Najmä u starších pacientov, ktorí vstávajú počas noci, existuje riziko pádu ako dôsledok myorelaxačného účinku zopiklónu.

Pediatrická populácia

Zopiclone Baltijos Bite sa nemá podávať deťom a dospievajúcim mladším ako 18 rokov. Bezpečnosť a účinnosť zopiklónu v tejto vekovej skupine neboli stanovené.

Pomocné látky

Tento liek obsahuje menej ako 1 mmol sodíka (23 mg) v tablete, t.j. v podstate zanedbateľné množstvo sodíka.

Filmom obalené tablety 5 mg obsahujú košenilovú červen (E124), ktorá môže vyvolať alergické reakcie.

4.5 Liekové a iné interakcie

Súbežné užívanie sa neodporúča:

Alkohol

Súbežné užívanie s alkoholom sa neodporúča. Sedatívny účinok lieku Zopiclone Baltijos Bite sa môže zosilniť, keď sa liek kombinuje s alkoholom. To ovplyvňuje schopnosť viesť vozidlá a obsluhovať stroje.

Interakcie vyžadujúce opatrnosť:

Látky tlmiace CNS

Kombinácia s inými látkami tlmiacimi CNS, ako sú neuroleptiká, hypnotiká, anxiolytiká/sedatíva, antidepresíva, opioidné analgetiká, antiepileptiká, anestetiká a sedatívne antihistaminiká, sa má starostlivo zvážiť, pretože v kombinácii s týmito látkami sa môže zosilniť supresívny účinok zopiklónu na centrálny nervový systém.

V prípade opioidných analgetík môže dôjsť aj k zosilneniu eufórie, čo môže viesť k zvýšeniu psychickej závislosti.

Opioidy

Súbežné užívanie sedatív, ako sú benzodiazepíny alebo príbuzné lieky, ako je Zopiclone Baltijos Bite, s opioidmi zvyšuje riziko sedácie, útlmu dýchania, kómy a smrti v dôsledku aditívneho tlmivého účinku na CNS. Dávkovanie a trvanie súbežného užívania majú byť obmedzené (pozri časť 4.4).

Inhibitory CYP3A4/induktory CYP3A4

Keďže zopiklón sa metabolizuje prostredníctvom CYP3A4, plazmatické hladiny zopiklónu sa môžu zvýšiť, ak sa podáva súbežne s inhibítormi CYP3A4, ako sú makrolidové antibiotiká, azoly, inhibitory HIV proteázy a grapefruitový džús. Počas súbežnej liečby inhibítormi CYP3A4 môže byť potrebné zníženie dávky zopiklónu.

Naopak, plazmatické hladiny zopiklónu sa môžu znížiť, ak sa podáva súbežne s induktormi CYP3A4, ako je fenobarbital, fenytoín, karbamazepín, rifampicín a lieky obsahujúce ľubovník bodkovaný. Možno bude potrebné zvýšiť dávku zopiklónu.

Erytromycín

U zdravých dobrovoľníkov sa skúmal účinok erytromycínu na farmakokinetiku zopiklónu. AUC zopiklónu sa v prítomnosti erytromycínu zvyšuje o 80 %, pravdepodobne v dôsledku inhibície metabolizmu liekov metabolizovaných CYP3A4 erytromycínom. V dôsledku toho sa môže zvýšiť hypnotický účinok zopiklónu.

Itrakonazol

Pri súbežnom podávaní s itraconazolom (ktorý inhibuje metabolizmus sprostredkovaný CYP3A4) sa biologická dostupnosť zopiklónu zvýši približne o 70 %.

Rifampicín

Rifampicín silne indukuje metabolizmus zopiklónu pravdepodobne prostredníctvom CYP3A4. Jeho plazmatická koncentrácia klesá asi o 80 % a jeho účinky v psychomotorických testoch sú výrazne znížené.

4.6 Fertilita, gravidita a laktácia

Gravidita

Užívanie zopiklónu počas tehotenstva sa neodporúča.

Štúdie na zvieratách nepreukázali priame alebo nepriame účinky z hľadiska reprodukčnej toxicity.

Zopiklón prechádza placentou.

Veľké množstvo údajov u gravidných žien (viac ako 1 000 ukončených gravidít) z kohortových štúdií nepreukázalo výskyt malformácií po expozícii benzodiazepínom alebo látkam podobným benzodiazepínom počas prvého trimestra gravidity. Niektoré kontrolné prípadové štúdie však zaznamenali zvýšený výskyt rázštepú pery a podnebia súvisiace s užívaním benzodiazepínov počas tehotenstva.

Po podaní benzodiazepínov alebo látok podobných benzodiazepínom počas druhého a/alebo tretieho trimestra gravidity boli popísané prípady zníženia pohybov plodu a variability srdcovej frekvencie plodu.

Podávanie benzodiazepínov alebo látok podobných benzodiazepínom, vrátane zopiklónu, počas neskorej fázy tehotenstva alebo počas pôrodu sa spájalo s účinkami na novorodenca, ako je hypotermia, hypotónia, ťažkosti s kŕmením („floppy infant syndrome“) a útlm dýchania, v dôsledku farmakologického účinku lieku. Boli hlásené prípady závažnej neonatálnej respiračnej depresie.

Okrem toho u dojčiat narodených matkám, ktoré chronicky užívali sedatíva/hypnotiká počas neskorších štádií tehotenstva, sa môže rozvinúť fyzická závislosť a môže hroziť riziko vzniku abstinenčných príznakov v postnatálnom období.

Odporúča sa vhodné sledovanie novorodenca v postnatálnom období.

Ak je Zopiclone Baltijos Bite predpísaný žene vo fertilnom veku, má byť informovaná, aby sa poradila s lekárom a prediskutovala prerušenie liečby, ak plánuje otehotnieť alebo má podozrenie, že je tehotná.

Dojčenie

Zopiklón sa vylučuje do materského mlieka, hoci koncentrácia zopiklónu v materskom mlieku je nízka, jeho použitiu u dojčiacich matiek treba sa vyhnúť.

4.7 Ovplyvnenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

Zopiklón má veľký vplyv na schopnosť viesť vozidlá a obsluhovať stroje.

Počas liečby zopiklónom môže byť znížená schopnosť reagovať. Toto je potrebné vziať do úvahy, keď sa vyžaduje ostražitosť, napr. pri vedení vozidla alebo vykonávaní presnej práce, najmä počas prvých 12 hodín po podaní zopiklónu. Na minimalizáciu týchto rizík sa medzi užitím zopiklónu a vedením vozidla, obsluhou strojov alebo prácou vo výškach odporúča neprerušovaný odpočinok v trvaní najmenej 12 hodín.

Okrem toho sa riziko zvyšuje pri súčasnom požití alkoholu alebo iných látok tlmiacich CNS. Riziko je ešte vyššie, keď je dĺžka spánku nedostatočná. Pacienti majú byť upozornení, aby sa pri užívaní zopiklónu vyhýbali alkoholu alebo iným psychoaktívnym látkam.

4.8 Nežiaduce účinky

Zhrnutie bezpečnostného profilu

Asi 10 % liečených pacientov má nejakú formu vedľajšieho účinku. Najčastejším vedľajším účinkom je horká chuť, často prechodná, ktorá sa vyskytuje asi u 4 % pacientov v klinických štúdiách, po ktorej nasleduje ospalosť, ktorá závisí od dávky.

Tabuľkový zoznam nežiaducich reakcií

Frekvencie nežiaducich účinkov sú zoradené v tabuľke nižšie podľa nasledovného: veľmi časté ($\geq 1/10$), časté ($\geq 1/100$ až $< 1/10$), menej časté ($\geq 1/1\,000$ až $< 1/100$), zriedkavé ($\geq 1/10\,000$ až $< 1/1\,000$), veľmi zriedkavé ($< 1/10\,000$) a neznáme (z dostupných údajov).

Tieto účinky súvisia s užívanou dávkou a individuálnou citlivosťou pacienta.

Trieda orgánových systémov	Časté	Menej časté	Zriedkavé	Veľmi zriedkavé	Neznáme
Poruchy imunitného systému				Angioedém, anafylaktické reakcie	
Psychické poruchy		Vzrušenie, nočné mory	Stav zmätenosti, poruchy libida, podráždenosť, agresivita, halucinácie, depresia*		Nepokoj, bludy, hnev, abnormálne správanie (pravdepodobne súvisiace s amnéziou) a správanie spojené so spánkom vrátane somniaambulizmu (pozri časť 4.4), psychóza, fyzická a psychická závislosť, abstinénčný syndróm**
Poruchy nervového systému	Dysgeúzia (horká/kovová chuť), ospalosť	Znížená pozornosť, bolesť hlavy, závrat	Anterográdna amnézia		Ataxia, parestézia, kognitívne poruchy ako porucha pamäti, porucha pozornosti, porucha reči
Poruchy oka					Diplopia
Poruchy dýchacej sústavy, hrudníka a mediastína			Dyspnoe		Respiračná depresia
Poruchy gastrointestinálneho traktu	Sucho v ústach	Nauzea, malátnosť, bolesť brucha			Dyspepsia, vracanie
Poruchy pečene a žlčových ciest				Zvýšenie sérových transamináz a/alebo alkalickej fosfatázy v krvi (mierne alebo stredne závažné)	
Poruchy kože a podkožného tkaniva			Alergické kožné reakcie (vrátane vyrážky, svrbenia, urtikárie)		
Poruchy kostrovej a svalovej sústavy a spojivového tkaniva					Svalová slabosť
Celkové poruchy a reakcie v mieste podania		Ťažkosti so vstávaním ráno, únava (asténia)			

Trieda orgánových systémov	Časté	Menej časté	Zriedkavé	Veľmi zriedkavé	Neznáme
Úrazy, otravy a komplikácie liečebného postupu			Pád (najmä u starších pacientov, pozri časť 4.4)		

* Počas užívania benzodiazepínov a látok podobných benzodiazepínom sa môže prejaviť latentná depresia.

** Použitie zopiklónu môže aj pri terapeutických dávkach viesť k rozvoju fyzickej závislosti a ukončenie liečby môže spôsobiť abstinenčné príznaky alebo rebound fenomén (pozri časť 4.4). Môže sa objaviť aj psychická závislosť. Došlo k zneužitiu.

Popis vybraných nežiaducich reakcií

Po vysadení zopiklónu bol hlásený abstinenčný syndróm (pozri časť 4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní). Abstinenčné príznaky sa líšia a zahŕňajú ťažkosti so spánkom, úzkosť, tras, potenie, nepokoj, zmätenosť, bolesť hlavy, palpitácie, tachykardiu, delírium, nočné mory, halucinácie a podráždenosť. Vo veľmi zriedkavých prípadoch sa vyskytli aj záchvaty.

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie po registrácii lieku je dôležité. Umožňuje priebežné monitorovanie pomeru prínosu a rizika lieku. Od zdravotníckych pracovníkov sa vyžaduje, aby hlásili akékoľvek podozrenia na nežiaduce reakcie na národné centrum hlásenia uvedené v Prílohe V.

4.9 Predávkovanie

Toxicita

Veľká individuálna variabilita. 5 mg spôsobilo miernu intoxikáciu u 1,5-ročných detí. Približne 30 mg spôsobilo strednú intoxikáciu u 6-ročných detí. 22,5-50 mg u dospelých a 40 mg u starších pacientov spôsobilo miernu intoxikáciu. >50 - >100 mg spôsobilo miernu až stredne závažnú intoxikáciu u dospelých. 100 mg spôsobilo hlboké bezvedomie u dospelých. 187 mg v kombinácii s alkoholom spôsobili ťažkú intoxikáciu u dospelých.

Príznaky

Predávkovanie sa zvyčajne prejavuje rôznym stupňom útlmu centrálného nervového systému (u starších pacientov niekedy veľmi dlho trvajúcim) v rozsahu od ospalosti až po kómu. V miernych prípadoch príznaky zahŕňajú únavu, ospalosť, spavosť, zmätenosť, letargiu, bezvedomie, ktorému niekedy predchádza alebo po ktorom nasleduje agitácia a halucinácie; vo vážnejších prípadoch príznaky zahŕňajú ataxiu, svalovú slabosť (hypotóniu), hypotenziu, methemoglobinémiu, útlm dýchania (najmä v kombinácii s alkoholom alebo látkami tlmiacimi CNS) a kómu.

K závažnosti príznakov môžu prispieť iné rizikové faktory, ako je prítomnosť sprievodného ochorenia alebo oslabený stav pacienta, a vo veľmi zriedkavých prípadoch môžu byť fatálne.

Liečba

Odporúča sa symptomatická a podporná liečba v adekvátnom klinickom prostredí, pozornosť sa má venovať respiračným a kardiovaskulárnym funkciám. Výplach žalúdka alebo aktívne uhlie sú užitočné len pri aplikácii krátko po užití lieku. Na zmiernenie útlmu CNS a útlmu dýchania môže byť ako antidotum užitočný flumazenil, ktorý je indikovaný hlavne pri ťažkej otrave, aby sa zabránilo intubácii a respiračnej podpore. Je potrebné vziať na vedomie, že trvanie účinku flumazenilu je kratšie ako trvanie účinku zopiklónu. Kvôli veľkému distribučnému objemu zopiklónu nie je pri liečbe predávkovania prospešná hemodialýza.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: hypnotiká a sedatíva, liečivá príbuzné benzodiazepínu, ATC kód: N05CF01

Zopiklón je hypnotikum podobné benzodiazepínom, ktoré patrí do skupiny cyklopyrolónov. Jeho farmakologické vlastnosti sú: hypnóza, sedácia, anxiolýza, antikonvulzia, svalová relaxácia. Zopiklón má vysokú afinitu k väzbovému miestu v rámci makromolekulárneho receptorového komplexu GABA_A, kde vyvoláva špecifické konformačné zmeny a zvyšuje normálny prenos neurotransmiteru GABA v CNS. Zopiklón má rýchly nástup účinku (asi do 30 minút), skracuje čas zaspávania, predlžuje trvanie spánku a znižuje počet prebudení počas noci. Množstvo REM spánku a hlbokého spánku (štádium III a IV) sa pri odporúčanej dávke zachováva.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Absorpcia

Biologická dostupnosť zopiklónu je približne 80 %. Maximálne plazmatické koncentrácie sa dosiahnu v priebehu 1,5-2 hodín a sú približne 30 ng/ml po dávke 3,75 mg a 60 ng/ml po dávke 7,5 mg. Absorpcia je rovnaká u žien i mužov a nie je ovplyvnená súčasným príjmom potravy. Absorpcia sa môže oneskoriť, ak sa zopiklón požíja v horizontálnej polohe.

Distribúcia

Zopiklón sa z cievneho kompartmentu distribuuje rýchlo. Distribučný objem je 1,3 l/kg a väzba na bielkoviny je približne 45 % a nie je saturateľná. Dá sa očakávať, že menej ako 1 % dávky požitej matkou sa dostane k dojčatú prostredníctvom materského mlieka.

Biotransformácia

Po opakovanom podávaní nedochádza k akumulácii a zdá sa, že existujúce interindividuálne odchýlky sú minimálne. Zopiklón sa extenzívne metabolizuje v pečeni dekarboxyláciou.

Asi 11 % sa premení na N-oxyzopiklón, ktorý je menej aktívny ako pôvodná látka a nemá klinický význam, a asi 15 % sa premení na inaktívny N-desmetylzopiklón. Zdanlivé polčasy sú približne 4,5 a 7,4 hodiny.

Eliminácia

Nízky renálny klírens zopiklónu (priemerne 8,4 ml/min) v porovnaní s plazmatickým klírensom (232 ml/min) naznačuje, že zopiklón sa v podstate eliminuje metabolizmom.

Polčas je 5 hodín, u starších ľudí sa zvyšuje na 7 hodín. V rôznych štúdiách so staršími pacientmi nebola po opakovaných dávkach pozorovaná žiadna akumulácia zopiklónu v plazme. Plazmatický klírens je u pacientov s cirhózou pečene znížený približne o 40 % v dôsledku pomalšieho procesu metylácie, a preto sa má dávka u týchto pacientov upraviť. U pacientov s renálnou insuficienciou sa po dlhšom podávaní nezistila žiadna akumulácia zopiklónu, ktorý prechádza tiež cez dialyzačnú membránu, ani jeho metabolitov.

Asi 80 % všetkého zopiklónu sa vylučuje močom, hlavne vo forme nekonjugovaných metabolitov (N-oxid a N-dimetylderiváty). Asi 16 % sa vylúči stolicou.

5.3 Predklinické údaje o bezpečnosti

Neexistujú žiadne predklinické údaje relevantné pre predpisujúceho lekára, ktoré by dopĺňali údaje už zahrnuté v iných častiach súhrnu charakteristických vlastností lieku.

6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

6.1 Zoznam pomocných látok

Jadro tablety

kukuríčný škrob

hypromelóza (typ 2910) (E464)
hydrogenfosforečnan vápenatý (E341)
sodná soľ karboxymetylškrobu (typ A)
mikrokryštalická celulóza (E460)
stearát horečnatý (E572)

Filmový obal tablety

tablety 5 mg:

makrogol a polyvinylalkohol vrúbľovaný, kopolymér (E1209)
mastenec (E553b)
oxid titaničitý (E171)
glycerol-monokaprylokaprát (E471)
polyvinylalkohol (E1203)
indigokarmín (E132)
košenilová červená A (E124)
chinolínová žltá (E104)

tablety 3,75 mg a 7,5 mg:

makrogol a polyvinylalkohol vrúbľovaný, kopolymér (E1209)
mastenec (E553b)
oxid titaničitý (E171)
glycerol-monokaprylokaprát (E471)
polyvinylalkohol (E1203)

6.2 Inkompatibility

Neaplikovateľné.

6.3 Čas použiteľnosti

2 roky

6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

Tento liek nevyžaduje žiadne zvláštne podmienky na uchovávanie.

6.5 Druh obalu a obsah balenia

10, 20, 30 alebo 100 filmom obalených tabliet v PVC/PVDC//Al blistroch.
Na trh nemusia byť uvedené všetky veľkosti balenia.

6.6 Špeciálne opatrenia na likvidáciu a iné zaobchádzanie s liekom

Žiadne zvláštne požiadavky.

7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCII

AS GRINDEKS
Krustpils iela 53, Rīga, LV-1057
Lotyšsko
Tel: +371 67083205
E-mail: grindeks@grindeks.com

8. REGISTRAČNÉ ČÍSLO

Schválený text k rozhodnutiu o prevode registrácie, ev. č.: 2025/03981-TR, 2025/03982-TR, 2025/03983-TR

Zopiclone Baltijos Bite 3,75 mg filmom obalené tablety: 57/0139/25-S

Zopiclone Baltijos Bite 5 mg filmom obalené tablety: 57/0140/25-S

Zopiclone Baltijos Bite 7,5 mg filmom obalené tablety: 57/0141/25-S

9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE/PREDLŽENIA REGISTRÁCIE

Dátum prvej registrácie: 29. mája 2025

10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

10/2025