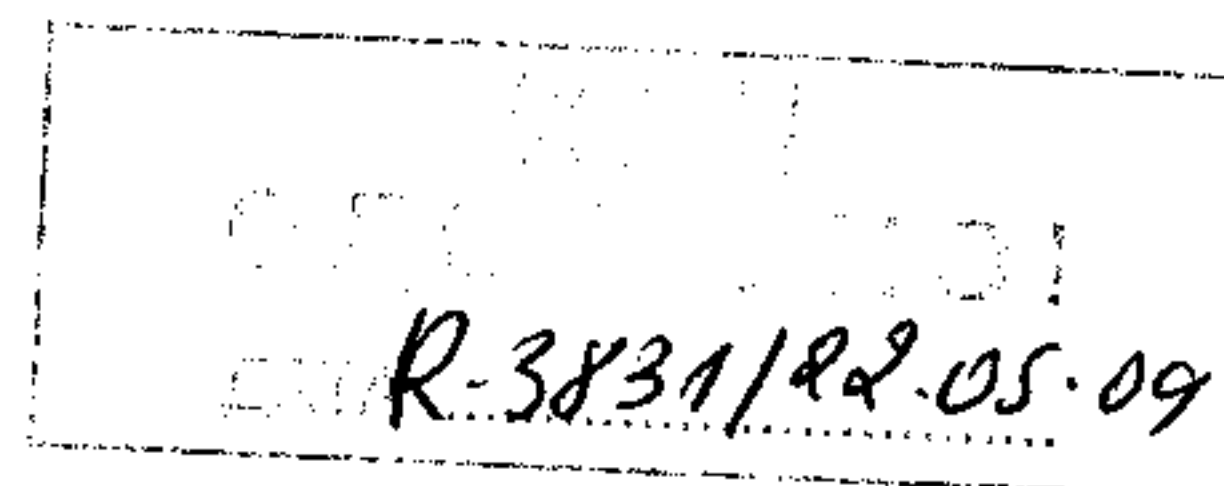


КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

АУРОРИКС 150 mg филмирани таблетки
AURORIX® 150 mg film-coated tablets



2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Една филмирана таблетка съдържа 150 mg моклобемид (moclobemide).

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филмирана таблетка

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Тежка депресия.

Лечение на социална фобия.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Аурорикс таблетки са предназначени за перорална употреба.

Таблетките трябва да се приемат в края на храненето.

Възрастни

Тежка депресия

Препоръчаната начална доза е 300 mg дневно, обикновено в разделени приеми. Дозата може да се повиши до 600 mg дневно в зависимост от тежестта на депресията.

Индивидуалният отговор може да позволи намаление на дневната доза до 150 mg.

Лечение на социална фобия

Препоръчаната доза моклобемид е 600 mg дневно в 2 отделни приема. Дозирането на моклобемид трябва да започне с 300 mg дневно и трябва да се повиши до 600 mg дневно на ден 4-ти. Не се препоръчва продължаването на лечението с доза от 300 mg дневно за повече от 3 дни, тъй като ефективната доза е 600 mg дневно. Лечението с 600 mg дневно трябва да продължи за 8-12 седмици, за да се прецени ефективността на лекарството. Социалната фобия може да бъде хронично състояние и при отговарящите пациенти е разумно да се има предвид продължаване на лечението. Състоянието на пациентите трябва периодично да се преоценява, за да се определи необходимостта от по-нататъшно лечение.

Пациенти в старческа възраст

Пациентите в старческа възраст не се нуждаят от специална корекция на дозата на Аурорикс

Деца

Не се препоръчва употребата на Аурорикс при деца поради липсата на данни за ефективност



Бъбречно/чернодробно увреждане

Не се налага специално коригиране на дозата на Аурорикс при пациенти с намалена бъбречна функция. Когато чернодробният метаболизъм е силно засегнат от заболяване на черния дроб или от прием на лекарство, което инхибира активността на микрозомалната монооксигеназа (напр. циметидин), нормални плазмени нива се достигат, като се намалява дневната доза на Аурорикс наполовина или с една трета (вж. точка 5.2. Фармакокинетика при специални популации).

4.3. Противопоказания

Аурорикс е противопоказан при пациенти, за които е известно, че имат свръхчувствителност към лекарството или някоя негова съставка, при остри състояния на объркване и при пациенти с феохромоцитом.

Аурорикс не трябва да се прилага едновременно с петидин или селегилин.

Аурорикс не трябва да се прилага едновременно с инхибитори на обратното залавяне на 5-НТ (включително тези, които са трициклични антидепресанти), за да се избегне появата на прекомерна серотонергична активност (вж. точка 4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба и точка 4.5. Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие). След преустановяване на лечението с инхибитори на обратното залавяне на 5-НТ между спиране на лечението и започване на терапия с Аурорикс трябва да измине период, равен на 4-5 времена на полуелиминиране на лекарството или на някой активен метаболит.

Аурорикс не трябва да се прилага едновременно с декстрометорфан, съдържащ се в много лекарства против кашлица, тъй като има съобщения за отделни случаи на тежки нежелани реакции от страна на централната нервна система след едновременната им употреба.

Аурорикс не трябва да се прилага при деца, тъй като засега няма клиничен опит с тази група.

4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Аурорикс е обратим инхибитор на моноаминооксидазата тип А (RIMA). Той потенцира действието на тирамина в по-малка степен в сравнение с традиционните необратими MAO инхибитори и поради това при лечение с Аурорикс обикновено не се налагат специалните ограничения в диетата, необходими при необратимите MAO инхибитори. Тъй като обаче някои пациенти може да бъдат особено чувствителни към тирамин, всички пациенти трябва да бъдат съветвани да избягват консумацията на големи количества храни, богати на тирамин (зряло сирене, екстракти от дрожди и ферментирани продукти от соеви зърна).

Пациентите трябва да бъдат съветвани да избягват симпатикомиметици като ефедрин, псевдоефедрин и фенилпропаноламин (съдържащи се в много лекарства против кашлица и простуда) (вж. точка 4.5. Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие).

Депресивните пациенти с преобладаващи клинични прояви на възбуда или ажитация не трябва да се лекуват с Аурорикс или това трябва да става само в комбинация със седативи (напр. бензодиазепини). Седативът трябва да се използва само за 2 до 3 седмици най-много.

Ако се лекува депресивен епизод в рамките на биполарно разстройство, може да се провокират епизоди на мания.



Поради липса на клинични данни, пациентите със съпътстващо заболяване от шизофрения или шизоафективни органични разстройства не трябва да се лекуват с Аурорикс.

Теоретични фармакологични съображения показват, че MAO инхибиторите могат да предизвикат хипертензивна реакция при пациенти с тиреотоксикоза. Тъй като липсва опит с Аурорикс при тази популация, трябва да се внимава, преди да се предпише Аурорикс.

При пациенти, които се лекуват с Аурорикс, трябва да се внимава при едновременно прилагане на лекарства, които увеличават серотонина, за да се предотврати появата на серотонинергичен синдром (вж. точка 4.3. Противопоказания и точка 4.5. Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие). Това се отнася особено за кломипрамин.

Може да се появи свръхчувствителност при предразположени пациенти. Симптомите може да включват обрив и оток.

Поява на хипонатриемия (обикновено при пациенти в старческа възраст и вероятно поради неправилна секреция на антидиуретичен хормон) се е свързвала с приложението на всички видове антидепресанти, макар и много рядко с Аурорикс (вж. точка 4.8. Нежелани лекарствени реакции) и трябва да се има предвид при всички пациенти, при които има проява на сънливост, объркване или гърчове след употреба на антидепресанти.

Самоубийство/суицидни мисли или клинично влошаване

Депресията е свързана с повишен риск от суицидни мисли, самонараняване и самоубийство (събития, свързани със самоубийство). Този риск съществува до достигане на значима ремисия. Тъй като подобрение може да не настъпи през първите няколко седмици или повече от началото на лечението, пациентите трябва да бъдат под строго наблюдение до появата му. Клиничният опит сочи, че рискът от самоубийство може да нарасне през ранните етапи на възстановителния период.

Други психични заболявания, при които Аурорикс се предписва, също могат да бъдат свързани с повишен риск от събития, свързани със самоубийство. Освен това, тези заболявания могат да бъдат съчетани с голямо депресивно разстройство. При лечение на пациенти с други психични нарушения трябва да бъдат съблюдавани същите предпазни мерки, както при лечение на пациенти с голямо депресивно разстройство.

Известно е, че пациенти с анамнеза за събития, свързани със самоубийство, или показващи в значителна степен суицидни идеации, преди започване на лечението, са изложени на по-висок риск от суицидни мисли или опити за самоубийство и трябва да бъдат внимателно наблюдавани по време на лечението. Мета-анализ на плацебо-контролирани клинични изпитвания на антидепресанти при възрастни пациенти с психични разстройства показва повишен риск от суицидно поведение при пациенти под 25-годишна възраст, лекувани с антидепресанти в сравнение с плацебо. Лекарствената терапия трябва да се съпътства със строго наблюдение на пациентите, в частност на тези, които са изложени на висок риск, особено в началните етапи на лечението и след промени в дозите. Пациентите (и полагащите грижи за тях) трябва да бъдат предупредени относно необходимостта от наблюдение на всеки признак за клинично влошаване, суицидно поведение или мисли и необичайни промени в поведението, както и да потърсят незабавно консултация с лекар, ако такива симптоми съществуват.

4.5. Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

При животни Аурорикс потенцира ефектите на опиатите. Опиатни аналгетици като морфин и фентанил трябва да се прилагат предпазливо. При тези лекарства може да се наложи коригиране на дозата.



Циметидин удължава метаболизма на Аурорикс. Поради това обичайната доза на Аурорикс трябва да се намали наполовина при пациенти, приемащи циметидин.

Допълнителни лекарства, които увеличават серотонина, като много други антидепресанти, особено комбинации от много лекарства, трябва да се прилагат предпазливо при пациенти, лекувани с Аурорикс. В отделни случаи са наблюдавани комбинации от сериозни симптоми и признаци, включващи хипертермия, объркване, хиперрефлексия и миоклонус, които показват прекомерна серотонергична активност (вж. точка 4.3. Противопоказания и 4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба). При поява на такива комбинирани симптоми пациентът трябва да се наблюдава внимателно от лекар (да се хоспитализира при нужда) и да се приложи подходящо лечение.

Има вероятност фармакологичното действие при схеми за лечение, съдържащи системни симпатикомиметици, да се интензифицира и удължи при едновременно лечение с моклобемид.

4.6. Бременност и кърмене

Репродуктивните проучвания при животни не са показали никакъв риск за фетуса, но безопасността на Аурорикс за бременността при човека не е установена. Поради това ползата от медикаментозното лечение при бременност трябва да се прецени по отношение на възможния риск за фетуса.

Тъй като само малко количество Аурорикс преминава в кърмата (приблизително 1/30 от майчината доза), ползата от продължителното медикаментозно лечение по време на кърмене трябва да се прецени по отношение на възможния риск за кърмачето.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Обикновено при лечение с Аурорикс не се очаква увреждане на способността за извършване на дейности, изискващи пълна психическа бдителност (напр. шофиране на моторно превозно средство). Индивидуалната реакция обаче трябва да се проследява през ранните етапи на лечението.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Наблюдавани са следните нежелани реакции: нарушения на съня, ажитация, чувство за тревожност, безпокойство, раздразнителност, световъртеж, главоболие, парестезии, сухота в устата, зрителни нарушения, гадене, диария, запек, повръщане, оток и кожни реакции като обрив, сърбеж, уртикария и зачервяване. Наблюдавани са състояния на объркване, но те са изчезвали бързо след преустановяване на лечението.

По време на клиничните изпитвания е имало слабо повишаване на стойностите на чернодробните ензими, без това да е свързано с клинични последствия.

Много рядко е имало съобщения за случаи на хипонатриемия (вж. точка 4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба).

Има съобщени случаи на суицидни идеи и суицидно поведение по време на лечение с антидепресанти или скоро след спиране на лечението (вж. точка 4.4).

4.9. Предозиране



Предозиране само на моклобемид предизвиква обикновено слабоизразени и обратими признаци на дразнене на ЦНС и стомашно-чревния тракт.

Лечението на предозирането трябва да е насочено предимно към поддържане на виталните функции.

Както и при другите антидепресанти, смесено предозиране на моклобемид с други лекарства (напр. други лекарства, действащи върху ЦНС) може да бъде животозастрашаващо. Поради това пациентите трябва да се хоспитализират и да се наблюдават внимателно, така че да може да се приложи подходящо лечение.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Антидепресанти, АТС код: N06AG02

Аурорикс е антидепресант, който повлиява моноаминергичната невротрансмитерна система в мозъка посредством обратимо инхибиране на моноаминооксидазата предимно от тип А (RIMA). Това предизвиква намаление на метаболизма на норадреналина, допамина и серотонина (5-HT), което води до повишени екстрацелуларни концентрации на тези невронни трансмитери.

5.2. Фармакокинетични свойства

Резорбция

След перорално приложение моклобемид се резорбира напълно от стомашно-чревния тракт в порталната кръв. Максималните плазмени концентрации на лекарството обикновено се достигат до един час от приема. Ефект на първо преминаване през черния дроб намалява системно наличната част от дозата (бионаличност F). Това намаление е по-изразено след приложение на еднократни (F: 60%) отколкото многократни (F: 80%) дози. След многократно приложение плазмените концентрации на моклобемид се увеличават през първата седмица на лечението и остава стабилна след това. Когато дневната доза се повиши, равновесните концентрации се увеличават повече от пропорционално.

Разпределение

Поради липофилните си качества моклобемид се разпространява екстензивно в организма. Обемът на разпределение (V_{ss}) е около 1.0 l/kg. Свързването на лекарството с плазмените протеини, предимно албумин, е слабо (50%).

Метаболизъм

Преди елиминирането му от организма лекарството се метаболизира почти напълно. Метаболизмът се извършва предимно чрез оксидативни реакции на морфолиновата част от молекулата. Разпадните продукти с фармакологична активност се откриват в системната циркулация при човека само в много ниски концентрации. Главните метаболити в плазмата са лактамно производно и N-оксидно производно. Доказано е, че моклобемид се метаболизира частично от полиморфните изоензими CYP2C19 и CYP2D6. Поради това метаболизмът на лекарството може да се повлияе при генетически или лекарство-индуцирани (чрез инхибитори на метаболизма) лоши метаболитатори. Две проучвания, проведени с цел да се изследва размерът на тези ефекти, показват, че поради наличие на множество алтернативни метаболитни пътища, те нямат клинично значение и не би трябвало да налагат коригиране на дозата.

Елиминиране



Моклобемид бързо се елиминира от метаболитните процеси. Общият клирънс е приблизително 20-50 l/час. Средното време на полуживот при многократно приложение (300 mg два пъти дневно) е приблизително 3 часа и обикновено варира от 2-4 часа при повечето пациенти. Под 1% от дозата се екскретира през бъбреците в непроменена форма. Образованите метаболити се елиминират през бъбреците. Незначителни количества се екскретират в кърмата при човека.

Фармакокинетика при специални популации

Пациенти в старческа възраст

Показателите на резорбция и диспозиция са непроменени при пациенти в старческа възраст.

Пациенти с бъбречно увреждане

Бъбречното заболяване не променя елиминационните характеристики на моклобемид.

Пациенти с чернодробно увреждане

При напреднала чернодробна недостатъчност метаболизмът на моклобемид се намалява (вж. точка 4.2. Дозировка и начин на приложение).

5.3. Предклинични данни за безопасност

Неприложимо.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Лактоза, царевично нишесте, повидон К30, натриев нишестен гликолат, магнезиев стеарат, хидроксипропил метилцелулоза, етилцелулоза, полиетилен гликол 6000, талк, титанов диоксид (E171). Таблетките от 150 mg съдържат още и жълт железен оксид (E172).

6.2. Несъвместимости

Неприложимо.

6.3. Срок на годност

5 години.

6.4. Специални условия на съхранение

Няма специални изисквания за съхранение.

6.5. Данни за опаковката

Блистерна опаковка.

Размери на опаковката: 30 таблетки (таблетки от 150 mg).

6.6. Специални предпазни мерки при изхвърляне

Неприложимо.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА



MEDA Pharma GmbH & Co. KG
Benzstraße 1
61352 Bad Homburg v.d. Höhe
Германия
Phone: (06172) 888-2429
Fax: (06172) 888-1112

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

П-13807

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Таблетки от 150 mg: Разрешени за пръв път на 04.12.1992 г. / подновяване на разрешението за употреба на 11.07.2006 г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

04/2009 г.

АУРОРИКС е регистрирана търговска марка.

