

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

МОСЛОВЕМИДЕ НИНФИ 150 mg

МОКЛОБЕМИД НИХФИ 150 mg

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Moclobemide NINFI 150 mg

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Moclobemide 150 mg в една филмирана таблетка.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филмирани таблетки

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Показания

Депресия, социална фобия.

4.2. Дозировка и начин на приложение

Дозировката на моклобемид се определя индивидуално, в зависимост от състоянието на пациента и изразеността на симптоматиката. Продуктът се приема непосредствено след хранене. Минималната продължителност на лечението с моклобемид е 8 седмици.

Възрастни пациенти:

Депресия: Препоръчителната дозировка е 300-600 mg дневно, разделена обикновено на 2-3 приема. Началната доза е 300 mg дневно, като при по-тежки случаи може да бъде повишена до 600 mg дневно. Дозировката не трябва да бъде повишавана преди края на първата седмица на лечението, тъй като през този период нараства бионаличността на продукта.

Социална фобия: При пациенти със социална фобия моклобемид се използва в дози от 600 до 750 mg дневно, разпределени в 2 приема.

Гериатрични пациенти: коригиране на дозата не се налага.

Пациенти с чернодробна недостатъчност: при пациенти с изразена чернодробна недостатъчност дозата се намалява до 1/3 – 1/2 от стандартната.

Пациенти с бъбречна недостатъчност: не се налага коригиране на дозата, но пациентите трябва да бъдат под наблюдение.

| | |
|--|--------------|
| МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕСПАЗВАНЕТО | |
| Приложение към разрешение за употреба № 11-7212/02.05.07г | |
| 636/25.03.03 | <i>Мочил</i> |

Дела: Досега не е доказана ефективността и безопасността на продукта при деца, поради което употребата му в детска възраст не се препоръчва.

4.3. Противопоказания

Свръхчувствителност към някоя от съставките на продукта, феохромоцитом.. Моклобемид не трябва да се употребява при остри състояния на обърканост. Не трябва да се използва в педиатрията, тъй като липсва клиничен опит от прилагането му в детска възраст. Да не се прилага в комбинация с други MAO-инхибитори (напр. Selegiline), тъй като съществува опасност от потенциране на ефектите им и по-специално на тези, свързани с метаболизма на тирамина.

4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

Описани са изолирани случаи на анафилактични реакции (уртикария, ангиоедем, остра хипотония). В зависимост от обстоятелствата те може да изискват спешни терапевтични мерки и преустановяване на лечението с моклобемид. Както обикновено при лечението с антидепресанти, пациентите със склонност към суицидност трябва да бъдат под непрекъснато лекарско наблюдение. Пациенти с шизофрения, шизоафективни или органични разстройства не трябва да се лекуват моклобемид поради липса на клинични данни. При пациенти с предимно възбудна симптоматика може да се прилага с моклобемид само като комбинирана терапия със седативни средства. При лечение на депресивен епизод на биполарно разстройство може да се провокира маничен епизод. При започване на лечение с моклобемид не трябва да се прекратява терапията с невролептици при пациенти с шизофрени и шизоафективни разстройства. Необходимо е продуктът да се предписва с повишено внимание на пациенти с тиреотоксикоза, феохромоцитом и артериална хипертония. При чернодробна недостатъчност дозата се намалява до 1/3 - 1/2 от обичайната. Болните следва да бъдат информирани да се въздържат от употреба на храни, богати на тирамин, независимо от факта, че моклобемид е селективен MAO-A-инхибитор.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Моклобемид се комбинира без риск от нежелани ефекти с ibuprofen, lithium, бензодиазепини, digoxin, алкохол (в умерени количества), орални контрацептиви, невролептици, glibenclamide.

Необходимо е да се избягва съвместната употреба на моклобемид с imipramine, clomipramine, tranylcypromine, тъй като продуктът представлява инхибитор на

чернодробната CYP450 2D6 или дебризоквин хидроксилазата, ензим отговорен за метаболизма на посочените лекарства, някои антиаритмични агенти и др. В резултат ефектите на тези лекарства могат да бъдат усиленни.

Тъй като липсват клинични данни за едновременна употреба на моклобемид и селективни инхибитори на обратното поемане на серотонина, е необходимо да се избягва комбинираното им приложение до появата на такива данни.

Стандартна практика е при промяна на лечението от серотонинергични антидепресанти на конвенционални MAO-инхибитори да се осигурява период на изчистване, еквивалентен най-малко на 4 до 5 полуживота на прилаганото лекарство или някои от активните му метаболити. Изключение прави терапията с fluoxetine, при която е необходим период най-малко от 5 седмици между прекратяването и началото на лечение с моклобемид.

Установено е, че циметидин и вероятно всички инхибитори на микрозомалната монооксигеназа удължават метаболизма на моклобемид. Така че е необходимо 50% редуциране на дневната доза на моклобемид при едновременната му употреба с циметидин.

Експерименти върху животни показват, че моклобемид потенцира ефектите на опиатните аналгетици. Обаче данните от комбинираното приложение на моклобемид с морфин, кодеин, фентанил и аналози са ограничени. Поради това комбинацията им, както и тази на моклобемид с pethidine, dextromethorphan или dextropropoxyphen трябва да се избягва.

Фармакологичното действие на системно прилагани симпатикомиметични медикаменти може да бъде усилено и удължено при едновременно лечение с моклобемид.

4.6. Употреба при бременност и кърмене

При експериментални репродуктивни проучвания с моклобемид върху животни не е установен никакъв риск за фетуса, но безопасността на продукта по отношение бременността у жената не е доказана. Поради недостатъчен опит от приложението на моклобемид не се препоръчва неговата употреба от бременни и кърмачки.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

При лечение с моклобемид не се очаква засягане на способностите, изискващи пълно психическо съсредоточаване, както е при шофиране и работа с машини, но в началото

на прилагането му е необходимо повече внимание при упражняване на подобни дейности.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Моклобемид е медикамент с много добра поносимост, сравнително малко на брой и слабо изразени нежелани реакции.

Най-често срещаните от тях са: нарушения в съня (безсъние или сънливост), замаяност, повишение на артериалното налягане, гадене и сухота в устата. Описани са единични случаи на периферни моторни и сензорни невропатии, безпокойство, възбуда, нарушения в говора, зрителни смущения и гастроинтестинални нарушения (болки в епигастриума, диария или констипация). Изключително рядко - хепатит.

Тахикардия или брадикардия, аритмия, ригидност на вратната мускулатура, остро главоболие изискват преосмисляне на терапевтичния подход и евентуално спиране на лечението с моклобемид.

4.9. Предозиране

Симптоми: включват най-често средно изразени и обратими явления от страна на ЦНС и храносмилателния тракт като дезориентация, възбудено състояние, обърканост, конвулсии, понижени рефлексии, хипертензивна реакция, паметови нарушения, гадене, повдигане, повръщане.

Лечение: при необходимост може да се направи промивка на стомаха с активен въглен и да се приложат общи поддържащи жизнените функции процедури.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1. Фармакодинамични свойства

Моклобемид е мощен, краткодействащ, селективен и обратим MAO-A-инхибитор с много добра поносимост и съвместимост с други медикаменти и храни. При това бензамидиново производно са избегнати значителен брой от нежеланите лекарствени реакции, характерни за MAO-инхибиторите от първо поколение. В резултат на потискането на моноаминooksидазата тип А се повишава нивото на плазмения и везикуларния норадrenalин и серотонин и се потенцира допаминовата активност. По този начин антидепресантът моклобемид въздейства върху трите моноамини, чийто дефицит и нарушено равновесие води до развитие на депресии. В резултат продуктът редуцира депресивната симптоматика и води до преодоляване на дисфорията,

потиснатото настроение, невъзможността за концентрация. Тези ефекти най-често се проявяват в рамките на първата седмица от лечението.

5.2. Фармакокинетични свойства

Все още има неизяснени страни от фармакокинетичното поведение на моклобемид. Приема се, че за получаване на терапевтичен ефект е необходимо потискане на повече от 60% от MAO. Терапевтичният ефект настъпва след 1-3 седмици. Инхибиране на MAO_A при еднократна доза се постига след около 16 часа. Няма корелация между терапевтичния ефект и плазмените концентрации или MAO-инхибиторната активност. Времето за достигане на максимални плазмени концентрации е 0,5-3,5 часа. Плазмената концентрация при многократно прилагане на моклобемид нараства през първата седмица от лечението и след това се стабилизира. Бионаличността е 55-95% (в зависимост от first pass метаболизма). Храната забавя, но не намалява резорбцията. Наблюдавано е повишаване на бионаличността при прием с богати на протеини храни. Моклобемид е липофилен препарат. Свързването му с плазмените протеини е 50%. Той се метаболизира в значителна степен в черния дроб, главно чрез морфолин-N-окисление, ароматно хидроксилиране, морфолин-C-окисление и деаминиране до 19 метаболита. Моклобемид (или някои от неговите метаболити) може да инхибира собствения си метаболизъм. Незначителни количества се екскретират с кърмата, като все още не е изяснен ефекта му върху кърмачето. По-голяма част от резорбираното лекарство се отделя с урината. С фекалиите се отделят около 5%. Времето на полуелиминиране е 2 часа, но е удължено до 4,6 часа при възрастни пациенти.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Изследването на острата токсичност (LD₅₀) на субстанция моклобемид е проведено върху бели мишки линия Н₁ и бели плъхове Wistar.

Моклобемид е прилаган еднократно перорално и интраперитонеално.

Получени са следните резултати:

LD₅₀ - мишки, перорално - 1126,7 mg/kg т.м.

LD₅₀ - плъхове, перорално - над 2000 mg/kg т.м.

LD₅₀ - мишки, интраперитонеално - 437,5 mg/kg т.м.

LD₅₀ - плъхове, интраперитонеално - 633,4 mg/kg т.м.

При изследване на подостра едномесечна токсичност моклобемид е прилаган перорално на плъхове под формата на 1%-на водна суспензия с Твин 80 в дози 50 и 100 mg/kg т.м. Проведените клиниколабораторни изследвания не са показали данни за токсични изменения у опитните животни.

Получените данни за острата токсичност на моклобемид дават основание той да се причисли към слабо токсичните вещества според класификацията на Hodge и Sterner при перорално приложение върху плъхове. Резултатите от изследванията за субакутна токсичност показват липса на промени в клиниколабораторните показатели и патоморфологията на вътрешните органи.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества и техните количества в една таблетка:

| | |
|----------------------------|----------|
| Lactose monohydrate | 210,0 mg |
| Microcrystalline cellulose | 57,0 mg |
| Wheat starch | 75,0 mg |
| Pregelatinised starch | 90,0 mg |
| Povidone | 15,0 mg |
| Magnesium stearate | 3,0 mg |
| Purified water | |

Състав на филмовата обвивка (Opadry II yellow 33G 22704 12,0 mg):

Hypromellose (E 464),
Lactose monohydrate,
Titanium dioxide (E 171),
Triacetin,
Iron oxide yellow E 172

6.2. Физико-химични несъвместимости

Не са установени.

6.3. Срок на годност

3 години

6.4. Специални условия на съхранение

Да се пази от достъп на деца!

6.5. Данни за опаковката

Първична опаковка

Десет филмирани таблетки се опаковат в блистер от твърдо, прозрачно, безцветно PVC фолио и алуминиево фолио.

Вторична опаковка

Три блистера, заедно с листовка, се поставят в единична сгъваема картонена кутия.

6.6. Препоръки при употреба

Да не се прилага след изтичане срока на годност, посочен върху опаковката!

7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРОИЗВОДИТЕЛЯ И ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

НИХФИ АД, София 1797, бул. "Кл. Охридски" 3

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТРЕБА

10. ДАТА НА РЕВИЗИЯ НА ТЕКСТА

07.01.2003 г.