

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Aurorix® 150 mg film-coated tablets
Аурорикс 150 mg филмирани таблетки

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

1 филмирана таблетка съдържа 150 mg moclobemide.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филмирани таблетки, съдържащи 150 mg moclobemide.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Показания

Тежка депресия.

Лечение на социална фобия.

4.2 Дозировка и начин на употреба

Aurorix таблетки са предназначени за перорална употреба.

Таблетките трябва да се вземат в края на храненето.

Възрастни

Тежка депресия

Препоръчваната 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

Препоръчваната 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. 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 напреднала възраст

Пациентите в напреднала възраст не се нуждаят от специална корекция на дозата на Aurorix.

Деца

Тъй като липсват клинични данни, Aurorix не се препоръчва за употреба при деца.

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-13804/11.05.06	
700/04.07.06	<i>Ment.</i>



Бъбречно/чернодробно увреждане

Не се налага специално коригиране на дозата на AugoGix 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 AugoGix наполовина или с една трета (виж раздел 5.2. Фармакокинетика при специални популации).

4.3. Противопоказания

AugoGix 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.

AugoGix не трябва да се прилага едновременно с петидин или сележилин.

AugoGix не трябва да се прилага едновременно с инхибитори на обратното залавяне на 5-НТ (включително тези, които са трициклически антидепресанти), за да се избегне появата на прекомерна серотонергична активност (виж раздел 4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки за употреба и раздел 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 AugoGix трябва да измине период, равен на 4-5 времена на полуелиминиране на лекарството или на някой активен метаболит.

AugoGix 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.

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

4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки за употреба

AugoGix е обратим инхибитор на моноамино оксидазата 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 AugoGix 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 се съветват да избягват консумацията на големи количества храни, богати на тирамин (зряло сирене, екстракти от дрожди и ферментирани продукти от соеви зърна).

Пациентите трябва да се съветват да избягват симпатикомиметици като ефедрин, псевдоефедрин и фенилпропаноламин (съдържащи се в много лекарства против кашлица и простуда) (виж раздел 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 AugoGix 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.

Пациенти със суицидни тенденции трябва да се наблюдават внимателно в началото на лечението.



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 Augorix.

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

При пациенти, които се лекуват с Augorix, трябва да се внимава при едновременно прилагане на лекарства, които увеличават серотонина, за да се предотврати появата на серотонинергичен синдром (виж раздел 4.3. Противопоказания и раздел 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 напреднала възраст и вероятно поради неправилна секреция на антидиуретичен хормон) се е свързвала с приложението на всички видове антидепресанти, макар и много рядко с Augorix, (виж раздел 4.8. Нежелани ефекти) и трябва да се има предвид при всички пациенти, при които има проява на сънливост, объркване или гърчове след употреба на антидепресанти.

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

При животни Augorix 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 Augorix. Поради това обичайната доза на Augorix 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 Augorix. В отделни случаи са наблюдавани комбинации от сериозни симптоми и признаци, включващи хипертермия, объркване, хиперрефлексия и миоклонус, които показват прекомерна серотонергична активност (виж раздел 4.3. Противопоказания и 4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки за 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 лактация

Репродуктивните проучвания при животни не са показали никакъв риск за фетуса, но безопасността на Augorix 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 Augoḡix 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 Augoḡix 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 ефекти

Наблюдавани са следните нежелани ефекти: 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 последици.

Много рядко е имало съобщения за случаи на хипонатриемия (виж раздел 4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки за употреба).

4.9. Предозиране

Предозиране само на моклобемид предизвиква обикновено слабо изразени 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

Augoḡix 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 увеличава 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 метаболизатори. Две проучвания, проведени с цел да се изследва размера 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. Образуваните метаболити се елиминират през бъбреците. Незначителни количества се екскретират в кърмата при човека.

Фармакокинетика при специални популации

Пациенти в напреднала възраст

Показателите на резорбция и диспозиция са непроменени при пациенти в напреднала 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 (виж раздел 4.2. Дозировка и начин на употреба).

5.3. Предклинични данни за безопасност

Не е приложимо.

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, титаниев диоксид (E171). Таблетките от 150 mg съдържат още и жълт железен оксид (E172).

6.2. Несъвместимости

Не е приложимо.

6.3. Срок на годност

5 години

6.4. Специални предпазни мерки при съхранение

Няма специални изисквания за съхранение.

6.5. Вид и състав на контейнера

Блистерна опаковка.

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

6.6. Специални предпазни мерки при изхвърляне

Не е приложимо.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Рош България ЕООД, ул. "Бяло поле" 16, 1618 София, България

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

П- 3502/09.05.2001г.

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 09.05.2001 г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Февруари 2006 г.

Aurogix е регистрирана търговска марка.

