

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).

Помощно вещество с известно действие:

Всяка филмирана таблетка съдържа 141 mg лактоза (като монохидрат).

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филмирана таблетка

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Лечение на депресивни синдроми.
Лечение на социална фобия.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Възрастни

Депресивни синдроми

Препоръчителната доза е 300-600 mg дневно, обикновено прилагана в 2-4 отделни дози.

Началната доза е 300 mg дневно и може да се повиши до 600 mg/ден в зависимост от тежестта на депресията.

Дозата не трябва да се повишава преди първата седмица, тъй като бионаличността се увеличава през този период.

Лечението трябва да продължи най-малко 4-6 седмици, за да се оцени ефикасността на лекарството.

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към Рег. №	20010448
Разрешение №	62380 / 03-05-2023
BG/MA/MP -	/
Одобрение №	/



Лечение на социална фобия

Препоръчаната доза моклобемид е 600 mg/ден прилагана в 2 отделни дози. Дозирането на моклобемид трябва да започне с 300 mg/ден и трябва да се повиши до 600 mg/ден на 4-ти ден. 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/ден трябва да продължи за 8-12 седмици, за да се прецени ефективността на лекарството. Социалната фобия може да бъде хронично състояние и при отговарящите на лечението 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.

Специални популации

Пациенти в старческа възраст

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

Педиатрична популация

Не се препоръчва употребата на Аурорикс при деца поради липсата на клинични данни за ефикасност.

Бъбречно увреждане

Не се налага специално коригиране на дозата на Аурорикс при пациенти с намалена бъбречна функция.

Чернодробно увреждане

Когато чернодробният метаболизъм е силно засегнат от заболяване на черния дроб или от прием на лекарство, което инхибира микрозомалната смесена оксидазна активност (напр. циметидин), дневната доза на Аурорикс трябва да се намали на половина или с една трета (вж. точка 4.5 и 5.2).

Начин на приложение

Аурорикс таблетки са предназначени за перорална употреба. Таблетките трябва да се приемат след хранене.

4.3 Противопоказания

Свръхчувствителност към активното вещество или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1.

Остри състояния на объркване.

Едновременно прилагане на Аурорикс със следните лекарства е противопоказано:

- Селегилин
- Бупропион
- Триптани
- Петидин
- Трамадол
- Декстрометорфан
- Линезолид

Аурорикс не трябва да се прилага в педиатрията, тъй като засега няма клиничен опит с деца.



4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Предупреждения

Както при другите антидепресанти, лечението може да изостри шизофреничните симптоми при депресивни пациенти с шизофренични или шизоафективни психози. Ако е възможно, лечението с дългодействащи невролептици трябва да продължи при такива пациенти.

Обикновено по време на лечение с Аурорикс не са необходими специални диетични ограничения. Тъй като при някои пациенти може да съществува свръхчувствителност към тирамин, всички пациенти трябва да бъдат съветвани да избягват консумацията на големи количества храни, богати на тирамин.

Свръхчувствителност може да възникне при чувствителни индивиди. Симптомите могат да включват обрив и оток.

Теоретичните фармакологични съображения показват, че МАО-инхибиторите могат да предизвикат хипертонична реакция при пациенти с тиреотоксикоза или феохромоцитом. Тъй като липсва опит с Аурорикс в тази популация, трябва да се подхожда с повишено внимание по отношение на предписването на Аурорикс.

При пациенти, получаващи Аурорикс, допълнителни лекарства, които повишават серотонин, подобно на много други антидепресанти, особено в комбинации от няколко лекарства, трябва да се прилагат с повишено внимание. Това важи особено за кломипрамин (вж. точка 4.5).

Съпътстващото приложение на лекарства, съдържащи моклобемид и бупренорфин, може да доведе до серотонинов синдром, потенциално животозастрашаващо състояние (вж. точка 4.5).

Ако едновременното лечение с други серотонинергични лекарства е клинично оправдано, се препоръчва внимателно наблюдение на пациента, особено по време на започване на лечението и повишаване на дозата.

Симптомите на серотониновия синдром могат да включват промени в психичния статус, автономна нестабилност, невромускулни аномалии и/или стомашно-чревни симптоми.

Ако има съмнение серотонинов синдром, трябва да се обмисли намаляване на дозата или преустановяване на терапията в зависимост от тежестта на симптомите.

Не се препоръчва едновременното приложение на Аурорикс и декстрометорфан, който може да се съдържа в лекарствата против кашлица и настинка (вж. точка 4.5).

Фитотерапевтичните продукти, съдържащи жълт кантарион (*Hypericum*), трябва да се използват внимателно в комбинация с Аурориск, тъй като това може да повиши концентрацията на серотонин.

Информация за помощни вещества

Пациенти с редки наследствени проблеми на непоносимост към галактоза, пълнен лактазен дефицит или глюкозо-галактозна малабсорбция не трябва да приемат това лекарство.

Предпазни мерки

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 терапевтична ремисия.



Тъй като подобрене 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 нарастне 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 идеи, 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 предупреждени 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.

Безсъние, нервност или тревожност в началото на лечението с Аурорикс могат да оправдаят намаление на дозата или временно симптоматично лечение. В случаи на поява на мания или хипомания, или при поява на ранни симптоми на тези реакции (грандиозност, хиперактивност, включително увеличено говорене, неразумна импулсивност), лечението с Аурорикс трябва да се спре и да се започне алтернативно лечение.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Едновременното приемане на Аурорикс със селегилин или с линезолид е противопоказано.

Едновременното приемане на Аурорикс с триптани е противопоказано, защото те са мощни агонисти на серотониновите рецептори и се метаболизират от моноаминооксидазите (МАО) и различни цитохром Р450 ензими и плазмените концентрации на триптаните се увеличава, например суматриптан, ризатриптан, золмитриптан, алмотриптан, наратриптан, фроватриптан и елетриптан.

Едновременното приемане на Аурорикс с трамадол е противопоказано.

При животни моклобемид потенцира ефектите на опиатите. Едновременното приложение на Аурорикс с опиоиди/опиати (напр. бупренорфин, бупренорфин-съдържащи продукти) може да доведе до серотонинов синдром, потенциално животозастрашаващо състояние (вж. точка 4.4). Следователно може да е необходима корекция на дозата на опиати, напр. морфин, фентанил и кодеин.

Комбинацията с петидин е противопоказана поради повишения риск от серотонинергичен синдром (объркване, треска, конвулсии, атаксия, хеперрефлексия, миоклонус, диария).



Тъй като действието на Аурорикс е селективно и обратимо, неговото взаимодействие с триамин е слабо и краткотрайно, както показват фармакологичните проучвания при животни и хора (вж. точка 4.4).

Засилване на пресорния ефект е даже по-слабо или не се проявява, когато Аурорикс се приема след хранене.

Дневната доза на Аурорикс трябва да се намали на половина или с една трета за пациенти, чиито чернодробен метаболизъм е силно инхибиран от лекарство, което блокира микрозомалната смесена оксидазна активност, като циметидин (вж. точка 4.2.).

Трябва да се внимава при едновременното използване на лекарства, които се метаболизират от CYP2C19, тъй като Аурорикс е инхибитор на този ензим. Плазмената концентрация на тези лекарства (като инхибитори на протонната помпа (напр. омепразол), флуоксетин и флувоксамин) могат да се увеличат при използване на моклобемид. По подобен начин, Аурорикс инхибира метаболизма на омепразол при CYP2C19 екстензивни метаболизиращи, което води до удвояване на омепразоловата експозиция.

Трябва да се внимава с едновременното използване на тримипрамин и мапротилин, тъй като плазмената концентрация на тези инхибитори на обратното захващане моноамини се увеличава при прием на моклобемид.

Има вероятност фармакологичното действие при схеми за лечение, съдържащи системни симпатикомиметици, да се интензифицира и удължи при едновременно лечение с Аурорикс (напр. адренергици).

Допълнителни лекарства, които увеличават серотонина, като много други антидепресанти, особено комбинации от много лекарства, трябва да се прилагат предпазливо при пациенти, лекувани с Аурорикс. Това е особено вярно за антидепресанти като венлафаксин, флувоксамин, кломипрамин, циталопрам, есциталопрам, пароксетин, сертралин, бупропион. В отделни случаи са наблюдавани комбинации от сериозни симптоми и признаци, включващи хипертермия, объркване, хиперрефлексия и миоклонус, които показват прекомерна серотонергична свръхактивност. При поява на такива комбинирани симптоми пациентът трябва да се наблюдава внимателно от лекар (и да се хоспитализира при нужда) и да се приложи подходящо лечение. Може да се започне лечение с трициклични или други антидепресанти на следващия ден след спиране на Аурорикс. При преминаване от инхибитор на обратното захващане на серотонин към Аурорикс, трябва да се има предвид полу-живота на инхибитора (вж. точка 4.4). Обикновено, при преминаване от необратим МАО инхибитор (напр. фенелзин, транилципромин) към Аурорикс се препоръчва интервал от 14 дни.

Едновременната употреба с жълт кантарион (*Hypericum*) не се препоръчва, тъй като това може да повиши концентрацията на серотонин в централната нервна система.

Има съобщения за отделни случаи на тежки нежелани реакции от страна на централната нервна система след едновременната употреба на Аурорикс и декстрометорфан. Тъй като лекарствата против кашлица и простуда може да съдържат декстрометорфан, те не трябва да се приемат без предварителна консултация с лекар и по възможност да се приемат алтернативни лекарства, които не съдържат декстрометорфан (вж. точка 4.4).

Данните от клинични изпитвания подсказват, че няма никакви взаимодействия между Аурорикс и хидрохлоротиазид (НСТ) при хипертонични пациенти, такива използващи перорални контрацептиви, дигоксин, фенпрокумон и алкохол.



Тъй като сибутрамин е инхибитор на обратното захващане на норадреналин-серотонин, което би повишило ефекта на МАО-инхибиторите, едновременното използване с Аурорикс не се препоръчва.

Едновременното използване на декстропропоксифен не се препоръчва, тъй като Аурорикс може да засили ефектите на декстропропоксифен.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременост

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 лекарственото лечение при бременност трябва да се прецени по отношение на възможния риск за фетуса.

Кърмене

Тъй като само малко количество Аурорикс преминава в кърмата (приблизително 1/30 от майчината доза), ползата от продължителното лекарствено 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

В базата данни на системно-органичните класове, нежеланите лекарствени реакции са изброени под заглавия за честота (брой пациенти, очаквани да изпитат реакцията), като се използват следните категории:

Много чести (>1/10)

Чести (>1/100 до <1/10)

Нечести (>1/1 000 до <1/100)

Редки (>1/10 000 до <1/1 000)

Много редки (<1/10 000)

С неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка)

Нарушения на метаболизма и храненето	
Редки	Намален апетит*, хипонатриемия*
Психични нарушения	
Много чести	Нарушения на съня
Чести	Ажитация, тревога, безпокойство
Нечести	Мисли за самоубийство, състояние на обърканост (бързо преминават при спиране на лечението)
Редки	Суицидно поведение, заблуда*
Нарушения на нервната система	
Много чести	Замаяност, главоболие



Чести	Парестези
Нечести	Дисгезия
Редки	Серотонинов синдром* (прилага се едновременно с лекарства, които повишават серотонина, като инхибитори на обратното захващане на серотонин и много други антидепресанти, бупренорфин и бупренорфин-съдържащи продукти)
Нарушения на очите	
Нечести	Нарушено зрение
Съдови нарушения	
Чести	Хипотония
Нечести	Зачервяване
Стомашно-чревни нарушения	
Много чести	Сухота в устата, гадене
Чести	Повръщане, диария, запек
Нарушения на кожата и подкожната тъкан	
Чести	Обрив
Нечести	Оток, сърбеж, уртикария
Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение	
Чести	Раздразнителност
Нечести	Астения
Изследвания	
Редки	Повишение на стойностите на чернодробните ензими (без това да е свързано с клинични последици).

Нежелани лекарствени реакции, които не са съобщавани в клинични изпитвания, а са съобщавани само в постмаркетингови наблюдения, са означени с ()

Съобщаване на подозирани нежелани реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез национална система за съобщаване:

Изпълнителна агенция по лекарства (ИАЛ)

ул. Дамян Груев № 8

1303, гр. София

Р. България

Тел.: +359 2 8903 417

Факс: +359 2 8903 434

e-mail: bda@bda.bg

уебсайт: www.bda.bg

4.9 Предозиране

Признаци

Предозиране само на Аурорикс предизвиква обикновено слабо изразени и обратими признаци на дразнене на ЦНС и стомашно-чревния тракт.



Лечение

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 (RMAO-A). Този ефект предизвиква намаление на метаболизма на норадреналин, допамин и серотонин, което води до повишени екстрацелуларни концентрации на тези невронни трансмитери.

Като резултат от неговия повдигащ ефект върху настроението и психомоторната активност, Аурорикс облекчава такива симптоми като дисфория, изтощение, липса на мотивация и неспособност за концентрация. Тези ефекти най-често се появяват през първата седмица на терапията. Аурорикс също облекчава симптоми, свързани със социална фобия.

Въпреки, че Аурорикс няма седативни свойства, той подобрява качеството на съня в най-депресираните пациенти в рамките на няколко дни. Аурорикс не нарушава вниманието.

Краткосрочни проучвания при животни показва ниска токсичност. Не е наблюдавана сърдечна токсичност.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция

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). Въпреки това, насищането на тези метаболитни пътища през първата седмица на дозиране (300-600 mg/ден) води до почти пълна перорална бионаличност след това. 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%).

Биотрансформация

Преди елиминирането му от организма, лекарството се метаболизира почти напълно. Метаболизмът се извършва предимно чрез оксидативни реакции на морфолинговата част от молекулата. Разпадните продукти с фармакологична активност се откриват в системната



циркуляция 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 генетично или лекарство-индуцирани (чрез инхибитори на метаболизма) слаби 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 (вж. точка 4.2).

Елиминиране

Моклобемид бързо се елиминира от метаболитни 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 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).

5.3 Предклинични данни за безопасност

Неклиничните данни, на базата на конвенционални фармакологични проучвания за безопасност, токсичност при еднократно и многократно прилагане, генотоксичност, канцерогенен потенциал и репродуктивна токсичност, не показват особени опасности, свързани с моклобемид, при хора.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Лактоза, царевично нишесте, повидон K30, натриев нишестен гликолат, магнезиев стеарат, хипромелоза, етилцелулоза, полиетилен гликол 6 000, 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 Вид и съдържание на опаковката

Светложълти овални таблетки, с делителна черта от едната страна и надпис 150 от другата страна, в блистерна опаковка, поставена в картонена кутийка
Размери на опаковката: 30 таблетки (таблетки от 150 mg).

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне

Неприложимо.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Майлан ЕООД
Офис сграда „Сердика офиси“
бул. Ситняково № 48, ет. 7
1505 София
България

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Регистрационен номер 20010448

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

Дата на първо разрешаване: 04 декември 1992 г.
Дата на последно подновяване: 11 юли 2006 г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

02/2023

