

1. A GYÓGYSZER MEGNEVEZÉSE

AURORIX 150 mg filmtabletta

AURORIX 300 mg filmtabletta

2. MINŐSÉGI ÉS MENNYISÉGI ÖSSZETÉTEL

150 mg ill. 300 mg moklobemid filmtablettánként.

A segédanyagok teljes listáját lásd a 6.1 pontban.

3. GYÓGYSZERFORMA

150 mg: halványsárga színű, ovális, lekerekített élű, bikonvex filmbevonatú tablettá, egyik oldalán felezővonallal, másik oldalán " 150" jelzéssel ellátva. Törési felülete fehér színű.

300 mg: ovális, fehér, lekerekített élű, bikonvex, filmbevonatú tablettá egyik oldalán felezővonallal, másik oldalán, " 300" jelzéssel ellátva. Törési felülete fehér színű.

4. KLINIKAI JELLEMZŐK

4.1 Terápiás javallatok

Depresszív szindrómák.

Szociális fóbia kezelése.

4.2 Adagolás és alkalmazás

Az Aurorix tablettát étkezés után kell bevenni.

Felnőttek

Depresszív szindróma

Az ajánlott napi kezdő adag 300 mg, mely súlyos depresszióban 600 mg-ig emelhető. A napi adagot 2-3 részre osztva kell bevenni. Az adag nem emelhető az első héten, mert a biológiai hasznosulás nő ez idő alatt (lásd 5.2 pont) A napi dózis 150 mg-ra csökkenthető, az egyéni érzékenység figyelembevételével.

Szociális fóbia

Az ajánlott adag 600 mg naponta, 2 részre osztva. A moklobemid kezdő adagja 300 mg/nap, melyet a 4. napon szabad 600 mg/nap adagra emelni. A 300 mg/nap adagot nem célszerű tovább adni, mert a hatékony adag a 600 mg/nap. A 600 mg napi adagot 8-12 hétig kell adni, hogy a hatás értékelhető legyen. A szociális fóbia krónikusan fennálló állapot lehet, ezért az ilyen beteget - ha jól reagál a terápiára - célszerű tovább kezelni. Krónikus kezelés során az Aurorix hatékonysága nem csökken. A betegeket időnként ellenőrizni kell, hogy további kezelésük szükséges-e.

Időskor:

Időskorban nem szükséges a dózist módosítani.

Gyermekkor:

Klinikai adatok hiányában az Aurorix nem adható gyermekeknek. (lásd 4.3 pont)

Vese- és májkárosodás

Csökkent veseműködésű beteg dózisének módosítására nincs szükség.

Ha májbetegség miatt a májmetabolizmus súlyosan károsodott vagy gátolt a mikroszomális kevert funkciójú oxidáz aktivitásának gátlása miatt (pl. cimetidin), az Aurorix dózisát felére vagy harmadára kell csökkenteni (lásd 5.2 pont).

4.3 Ellenjavallatok

A készítmény hatóanyagával, vagy bármely segédanyagával szembeni túlérzékenység.

Akut zavart tudatállapot.

Phaeochromocytoma.

Együttadása szelegilinnel vagy petidinnel nem ajánlott.

Az Aurorix nem adható együtt 5-HT visszavétel gátlókkal (a triciklikus antidepresszánsok sem) (lásd 4.4 és 4.5 pont). Az 5-HT visszavétel gátlókkal való kezelés abbahagyása után a gyógyszer vagy bármelyik aktív metabolit felezési idejének 4-5-szöröse kell, hogy elteljen az Aurorix terápia megkezdése előtt. Az Aurorix nem adható együtt dextrometorfánnal, mely sok köhögéscsillapító összetevőjét képezi (lásd 4.5 pont).

Gyermekkor (megfelelő klinikai adatok hiányában).

4.4 Különleges figyelmeztetések és az alkalmazással kapcsolatos óvintézkedések

Az Aurorix a MAO-A reverzibilis gátlója (RIMA). Kevésbé potenciálja a tiramint, mint az irreverzibilis MAO-gátlók, ezért nem szükségesek az ezen gyógyszereknél szokásos diétás megszorítások. Azonban tiramin érzékenység bizonyos betegekben fennállhat, minden betegnek tanácsos a tiraminban gazdag ételek (pl. sajt, élesztő kivonatok és fermentált szója készítmények) túlzott mennyiségű fogyasztását kerülni.

A betegeknek kerülniük kell a szimpatomimetikus szereket, mint pl. efedrin, pszeudoefendrin és fenilpropanolamin (ezek sok megfázás elleni gyógyszerben benne vannak) (lásd 4.5 pont).

Az izgatott vagy agított depressziós betegeket vagy nem szabad Aurorix-szel kezelni, vagy csak szedatívvummal (pl. benzodiazepinnel) kombinálva. A nyugtató legfeljebb 2-3 hétig adható. Szuicid tendenciát mutató betegeket szigorúan ellenőrizni kell a kezelés kezdetén.

Ha bipoláris zavar depresszív epizódját kezelik Aurorix-szel, maniás epizódok jelentkezhetnek.

Klinikai adatok hiányában egyidejű schizofrenia vagy schizo-affektív organikus zavar esetén a beteg nem kezelhető Aurorix-szel.

Elméleti és farmakológiai adatok szerint a MAO-gátlók hipertenzív reakciót válthatnak ki thyreotoxicosisos betegeken. Moklobemiddel nincs megfelelő tapasztalat, ezért az ilyen betegnek a moklobemid csak fokozott óvatossággal adható.

Aurorix kezelés mellett szerotonin növelő szerek, mint pl. sok egyéb antidepresszáns, szerotoninerg szindrómát válthatnak ki (lásd 4.3. és 4.5 pont). Ezek különösen többszörös kombinációban óvatosan adhatók. Ez különösen vonatkozik a klomipraminra. Érzékeny egyének esetében túlérzékenység fordulhat elő, kiütés és ödéma jelentkezhet.

Laktóz intoleranciában figyelembe kell venni, hogy a 150 mg-os készítmény 148 mg, a 300 mg-os 26,5 mg laktózt is tartalmaz tablettánként.

Öngyilkosság/öngyilkossági gondolatok vagy a klinikai állapot romlása

Depresszió esetén fokozott az öngyilkossági gondolatok, az önkárosító magatartás és az öngyilkosság (öngyilkossággal kapcsolatos események) megjelenésének veszélye. A kockázat mindaddig fennáll, amíg jelentős remisszió nem következik be. Mivel előfordulhat, hogy a kezelés első néhány hete alatt, vagy még később sem történik javulás, a betegeket állapotuk javulásáig szoros ellenőrzés alatt kell tartani. Általános klinikai tapasztalat, hogy az öngyilkosság veszélye a gyógyulás korai szakaszában fokozódhat.

Más olyan pszichiátriai állapotok is összefüggésbe hozhatók az öngyilkossággal kapcsolatos események megnövekedett kockázatával, melyek kezelésére az Aurorix szintén rendelhető. Ráadásul, ezek az állapotok major depresszióval is együtt járhatnak. Ezért az egyéb pszichiátriai kórképekkel kezelt betegek esetén ugyanazokra az elővigyázatossági intézkedésekre van szükség, mint a major depresszióval kezelt betegeknél.

Azok a betegek, akiknek kórelőzményében öngyilkossággal kapcsolatos események szerepelnek, vagy akiket jelentős mértékben foglalkoztatnak öngyilkossági gondolatok a terápia megkezdése előtt, az öngyilkossági gondolatok és kísérletek fokozott kockázatának vannak kitéve, ezért a kezelés alatt gondos megfigyelést igényelnek. A pszichiátriai betegségekben szenvedő felnőttek bevonásával végzett, antidepresszánsokat vizsgáló, placebo-kontrollos klinikai vizsgálatok metaanalízise kimutatta,

hogy a 25 événél fiatalabb betegekben az öngyilkos magatartás kockázata az antidepresszánt szedőkben fokozottabb, mint a placebót szedőkben.

A betegeket, különösen a magas kockázati csoportba tartozókat a gyógyszeres kezelés során gondos felügyelet mellett kell tartani, főként a terápia kezdetén, és a dózismódosításokat követően. A betegeket (és gondviselőiket) figyelmeztetni kell arra, hogy figyeljék a klinikai rosszabbodás, az öngyilkossági gondolatok, vagy szokatlan magatartásbeli változások bármilyen megjelenését, és ha a felsorolt tünetek valamelyikét észlelik, sürgősen forduljanak orvoshoz.

4.5 Gyógyszerkölsönhatások és egyéb interakciók

Állatokban az Aurorix potenciálja az ópiátok hatásait. A morfint és fentanilt óvatosan kell adagolni. Szükség lehet a dózisok módosítására is.

A cimetidin meghosszabbítja a moklobemid metabolizálódását. Az Aurorix szokásos adagját ezért felére kell csökkenteni azokon, akik cimetidint szednek.

Aurorix-szel kezelt betegeken az olyan gyógyszereket, melyek növelik a szerotonin szintet, mint sok egyéb antidepresszáns, különösen ha kombinációban adják, óvatosan kell adni. Ez különösen vonatkozik a klomipraminra. Elszórt esetekben veszélyes tünetek jelentkezhetnek, pl. hyperthermia, zavartság, hyperreflexia és izomgörcsök, ezek a szerotoninerg hiperaktivitás jelei. (lásd 4.3. és 4.4 pont). Ha ezen tünetek kombinációi megjelennek, a beteget szigorú orvosi megfigyelés alatt kell tartani és esetleg kórházban kell kezelni. Az Aurorix kezelés abbahagyása után azonnal el lehet kezdeni a kezelést egy triciklusos vagy egyéb antidepresszánsal ("wash-out" nélkül), ha a fenti óvatossággal járnak el.

Jelenleg nincs tapasztalat moklobemid és buspiron együttadásával.

Elszórt esetekben központi idegrendszeri mellékhatásokat közöltek Aurorix és dextrometorfán együtt adásakor. Minthogy a köhögéscsillapítók gyakran tartalmaznak dextrometorfánt, ezeket nem szabad előzetes orvossal való konzultáció nélkül szedni, és ha lehet egyéb köhögéscsillapítót kell alkalmazni (lásd 4.3 pont).

A szisztémásan adott szimpatomimetikumok hatását a moklobemid erősítheti és meghosszabbíthatja.

4.6 Terhesség és szoptatás

Állatkísérletek nem utalnak a magzatra gyakorolt káros hatására, de terhes nők esetében azonban a készítmény biztonságosságát még nem vizsgálták. Terhes nőknek csak gondos mérlegelést követően rendelhető.

A moklobemid elhanyagolható mennyiségben jut be az anyatejbe (kb. a dózis 1/30-a testsúlykülönbségekre korrigálva). Szoptatás alatt az előny/kockázat mérlegelésével alkalmazható.

4.7 A készítmény hatásai a gépjárművezetéshez és gépek üzemeltetéséhez szükséges képességekre

A koncentrációképpességet alig befolyásolja, de alkalmazásának első szakaszában - egyéenként meghatározandó ideig - gépjárművet vezetni, vagy baleseti veszéllyel járó munkát végezni tilos. A továbbiakban egyénileg határozandó meg a tilalom mértéke.

4.8 Nemkívánatos hatások, mellékhatások

Ritkán átmeneti alvászavar, izgatottság, szorongásérzés, ingerlékenység, szédülés, fejfájás, paraesthesia, szájszárazság, látászavar, émelygés, hasmenés, székrekedés, hányás, oedema, bőrtünetek (kiütés, pruritus, urticaria, kivörösödés). Egyes esetekben zavart tudatállapotot figyeltek meg, ami azonban a kezelés megszakítását követően gyorsan megszűnt.

Ritkán előfordult a májenzimek szintjének emelkedése, de ennek nincs klinikai jelentősége.

Öngyilkossági gondolatról és öngyilkossági magatartásról szóló eseteket jelentettek a moklobemid terápia alatt, vagy a kezelés megszakítását követő korai időszakban (lásd 4.4 pont).

4.9 Túladagolás

Monoterápiában általában központi idegrendszeri és a gastrointestinalis tünetek enyhe és reverzibilis megjelenését váltja ki.

Túladagolás kezelésekor mindenképp a vitális funkciók fenntartására kell törekedni. A többi antidepresszánshoz hasonlóan egyéb gyógyszerekkel együttesen túladagolva (pl. egyéb központi idegrendszeri hatású szerekkel) a túladagolás életet veszélyeztetővé válhat. Ezért a beteg kórházi ellátása, monitorozása és megfelelő kezelése indokolt.

5. FARMAKOLÓGIAI TULAJDONSÁGOK

5.1 Farmakodinámiás tulajdonságok

Farmakoterápiás csoport: Psychoanalepticumok, antidepresszánsok, MAO-inhibítorok
ATC: N06AG02

A moklobemid antidepresszáns, mely az agy monoaminerg pályarendszereire hat a monoamin-oxidáz-A (MAO-A) reverzibilis gátlása révén. A noradrenalin, dopamin és szerotonin metabolizmusa tehát csökken, minek következtében nő ezeknek a transzmittereknek az extracelluláris koncentrációja.

5.2 Farmakokinetikai tulajdonságok

Felszívódás

A gyomor-bélrendszerből teljes mértékben felszívódik a portális keringésbe. A plazma csúcskoncentráció a bevételt követő egy órán belül alakul ki. A májon történő áthaladás adagfüggően csökkenti a biohasznosulást a szisztémás keringésben. A csökkenés kifejezettebb egyszeri adag után (biohasznosulás 60%) mint többszörös adag után (80%). Ezen metabolikus utak telítődése után az első heti kezelés során (300-600 mg/nap) lényegében teljes lesz az orális biológiai hasznosulás. Ismételt adagolás során a plazmakoncentráció a kezelés első hetében növekszik, majd állandó értékre áll be. A steady state koncentráció a napi dózis emelésekor az arányosnál nagyobb mértékben növekszik.

Eloszlás

Zsírolékonyságának köszönhetően kiterjedten oszlik el a szervezetben. Eloszlási térfogata 1,2 l/kg. A plazmafehérjékhez - elsősorban albuminhoz - való kötődése viszonylag alacsony (50%). A humán anyatejbe nem szignifikáns mennyiségben jut át.

Metabolizmus

Csaknem teljesen metabolizálódik kiürülés előtt. A metabolizmus nagyrészt a molekula morfolin alkotórészén történő oxidációs reakciók révén zajlik. Az aktív metabolitok a humán szisztémás keringésben csak nagyon kis koncentrációban találhatók meg. A fő metabolitok: egy laktám származék és egy N-oxid származék. A moklobemidet részben a polimorf izoenzimek a CYP2C19 és CYP2D6 metabolizálják. A genetikailag vagy gyógyszer miatti (metabolizmus gátlók) rossz metabolizálókban a metabolizmus változhat, de ennek nincs klinikai jelentősége és dózismódosítás nem szükséges.

Elimináció

A moklobemid gyorsan kiürül a szervezetből. A clearance 20-050l/óra. Az átlagos eliminációs felezési idő többszöri adagolás után (300 mg naponta kétszer) 2-4 óra. Kevesebb, mint 1% ürül változatlan formában a vesén keresztül. A metabolitok is a vesén keresztül ürülnek. Jelentéktelen mennyiség választódik ki az anyatejbe.

Farmakokinetika speciális populációban

Időskor: Időskorban nem változik a felszívódás és eloszlás.

Veseelégtelenség: Vesebetegség nem változtatja meg az eliminációs paramétereket.

Májelégtelenség: Súlyos májelégtelenségben a moklobemid metabolizmusa csökken (lásd 4.2 pont).

5.3 A preklinikai biztonságossági vizsgálatok eredményei

Nincsenek.

6. GYÓGYSZERÉSZETI JELLEMZŐK

6.1 Segédanyagok felsorolása

150 mg filmtabletta:

Mag: magnézium-sztearát, kukoricakeményítő, nátrium-karboxi-metil-amilopektin, laktóz, povidon.
Bevonat: sárga vas-oxid, makrogol 6000, etilcellulóz (diszperzió formájában), talkum, titán-dioxid, hipromellóz.

300 mg filmtabletta:

Mag: magnézium-sztearát, kukoricakeményítő, nátrium-karboxi-metil-amilopektin, laktóz, povidon K30.

Bevonat: Makrogol 6000, titán-dioxid, talkum, hipromellóz, etilcellulóz.

6.2 Inkompatibilitások

Nem értelmezhető.

6.3 Felhasználhatósági időtartam

5 év.

6.4 Különleges tárolási előírások

Legfeljebb 25°C-on tárolandó.

6.5 Csomagolás típusa és kiszerelése

100 db filmtabletta (150mg), vagy 60 db filmtabletta (300 mg) buboréksomagolásban és dobozban.

6.6 A megsemmisítésre vonatkozó különleges óvintézkedések és egyéb, a készítmény kezelésével kapcsolatos információk

Megjegyzés: ☒ (egy kereszt)

Osztályozás: **II. csoport**

Kizárólag orvosi rendelvényhez kötött gyógyszer (V).

Bármilyen fel nem használt készítmény, illetve hulladékanyag megsemmisítését a helyi előírások szerint kell végrehajtani.

7. A FORGALOMBA HOZATALI ENGEDÉLY JOGOSULTJA

Meda Pharma Hungary Kft
1139 Budapest, Váci út 91.

8. A FORGALOMBA HOZATALI ENGEDÉLY SZÁMA

OGYI-T-1809/02 (Aurorix 150 mg)

OGYI-T-1809//03 (Aurorix 300 mg)

9. A FORGALOMBA HOZATALI ENGEDÉLY ELSŐ KIADÁSÁNAK/ MEGÚJÍTÁSÁNAK DÁTUMA

1992. január 1. / 2007. november 26.

10. A SZÖVEG ELLENŐRZÉSÉNEK DÁTUMA

2011. március 2.