

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Selgres, 5 mg, tabletki powlekane.

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Jedna tabletki powlekana zawiera 5 mg selegiliny chlorowodoru (*Selegilini hydrochloridum*).

Substancja pomocnicza o znanym działaniu: laktoza jednowodna 70 mg.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletki powlekane.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1. Wskazania do stosowania

Choroba Parkinsona i objawowy parkinsonizm – we wczesnej fazie jako jedyny lek, w fazach późniejszych w skojarzeniu z lewodopą lub lewodopą i karbidopą.

4.2. Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

Dorośli

Doustnie, zwykle w dawce dobowej 10 mg podawanej jednorazowo (rano) lub w 2 dawkach podzielonych (5 mg rano i 5 mg wczesnym popołudniem).

Nie należy stosować dawek większych niż 10 mg na dobę.

Jednoczesne stosowanie selegiliny i lewodopy lub selegiliny i lewodopy z karbidopą pozwala na zmniejszenie dawek lewodopy średnio o 30% (maksymalnie o 50%).

Dzieci i młodzież

Nie ma doświadczenia dotyczącego stosowania u dzieci i młodzieży.

Pacjenci w podeszłym wieku

Nie ma potrzeby zmiany dawkowania.

Zaburzenia czynności wątroby lub nerek

Brak danych na temat dostosowywania dawki u pacjentów z łagodnymi zaburzeniami czynności wątroby lub nerek.

Selegilinę należy stosować ostrożnie u osób z umiarkowanymi i ciężkimi zaburzeniami czynności wątroby lub nerek.

4.3. Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na selegilinę lub na którąkolwiek substancję pomocniczą, wymienioną w punkcie 6.1.

Nie należy stosować selegiliny w skojarzeniu z selektywnymi inhibitorami zwrotnego wychwytu serotoniny (SSRI), inhibitorami zwrotnego wychwytu noradrenaliny i serotoniny (SNRI) (wenlafaksyna), trójpierścieniowymi lekami przeciwdepresyjnymi, sympatykomimetykami, inhibitorami monoaminooksydazy (np. linezolid) i z opioidami (petydyna) - patrz punkt 4.5.

Nie należy stosować selegiliny u pacjentów z czynnym wrzodem dwunastnicy lub żołądka.

Jeśli selegilina jest przepisana w połączeniu z lewodopą, należy uwzględnić przeciwwskazania dotyczące lewodopy.

4.4. Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Z uwagi na ryzyko niedociśnienia zaleca się zachowanie ostrożności przy zmianie pozycji ciała z leżącej lub siedzącej na stojącą.

Z powodu ryzyka wystąpienia niedociśnienia ortostatycznego trójpierścieniowe leki przeciwdepresyjne można stosować nie wcześniej, niż po 14 dniach od zaprzestania podawania selegiliny.

Ponieważ selegilina wzmacnia działanie lewodopy, działania niepożądane lewodopy mogą być bardziej nasilone, szczególnie u pacjentów, którzy stosują w terapii duże dawki lewodopy. Takich pacjentów należy monitorować. Dodanie selegiliny do leczenia lewodopą może powodować powstawanie ruchów mimowolnych i (lub) pobudzenie. Te działania niepożądane znikają po zmniejszeniu dawek lewodopy. Dawkę lewodopy można zmniejszyć do około 30% w skojarzeniu z selegiliną.

Jeśli selegilina jest stosowana w dawce większej niż zalecana (10 mg), może stracić swoje właściwości selektywnego inhibitora MAO-B i tym samym zwiększać ryzyko nadciśnienia.

Należy szczególnie ostrożnie stosować selegilinę u pacjentów z chwiejnym nadciśnieniem, arytmiami serca, ciężką dławicą piersiową, psychozą lub wcześniej występującymi wrzodami trawiennymi, ponieważ podczas leczenia może wystąpić zaostrzenie tych chorób.

Należy zachować ostrożność w przypadku pacjentów przyjmujących inhibitory MAO podczas znieczulenia ogólnego w trakcie zabiegów chirurgicznych. Inhibitory MAO, w tym selegilina, mogą nasilać działanie depresyjne leków stosowanych do znieczulenia ogólnego na ośrodkowy układ nerwowy. Zgłaszano przemijającą depresję oddechową i sercowo-naczyniową, niedociśnienie i śpiączkę (patrz punkt 4.5).

Niektóre badania wykazały zwiększone ryzyko śmiertelności u pacjentów przyjmujących selegilinę i lewodopę w porównaniu z pacjentami przyjmującymi tylko lewodopę. Jednak warto zauważyć, że w badaniach tych stwierdzono liczne błędy metodologiczne oraz, że w meta-analizie i dużych badaniach kohortowych wykazano, iż nie ma znaczących różnic w śmiertelności pacjentów leczonych selegiliną w porównaniu z pacjentami leczonymi lekiem porównywanym lub połączeniem selegilina/lewodopa.

W badaniach powiązано ryzyko nasilonej odpowiedzi hipotensyjnej na skojarzone podawanie selegiliny i lewodopy u pacjentów z ryzykiem sercowo-naczyniowym.

Dodanie selegiliny do lewodopy może nie przynieść korzyści pacjentom, u których występują fluktuacje odpowiedzi niezależne od dawki.

Zaleca się ostrożność w przypadku przyjmowania selegiliny w połączeniu z innymi substancjami i produktami leczniczymi o działaniu ośrodkowym. Należy unikać równoczesnego spożywania alkoholu.

Ostrzeżenia dotyczące substancji pomocniczych

Laktoza jednowodna

Produkt leczniczy nie powinien być stosowany u pacjentów z rzadko występującą dziedziczną nietolerancją galaktozy, brakiem laktazy lub zespołem złego wchłaniania glukozy-galaktozy.

Sód

Produkt leczniczy zawiera mniej niż 1mmol (23 mg) sodu w jednej tabletkie, to znaczy produkt leczniczy uznaje się za „wolny od sodu”.

4.5. Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Połączenia przeciwwskazane (patrz punkt 4.3)

Sympatykomimetyki

Z powodu ryzyka nadciśnienia równoczesne podawanie selegiliny i sympatykomimetyków jest przeciwwskazane.

Petydyna

Równoczesne podawanie selegiliny, która jest selektywnym inhibitorem MAO-B, oraz petydyny jest przeciwwskazane.

Selektywne inhibitory zwrotnego wychwytu serotoniny (SSRI) i inhibitory zwrotnego wychwytu noradrenaliny i serotoniny (SNRI)

Ze względu na ryzyko wystąpienia splątania, łagodnych stanów maniakałnych, halucynacji i epizodów maniakałnych, pobudzenia, hiperrefleksji, bezładu, dreszczy, drżenia, drgawek, w tym drgawek klonicznych mięśni, ataksji, wzmożonego pocenia się, biegunki, gorączki, nadciśnienia, które mogą być częścią zespołu serotoninowego, równoczesne podawanie selegiliny i leków SSRI lub SNRI jest przeciwwskazane.

Nie należy stosować fluoksetyny przed upływem 14 dni od przerwania stosowania selegiliny. Ponieważ fluoksetyna charakteryzuje się bardzo długim okresem półtrwania w fazie eliminacji, należy zachować co najmniej pięćtygodniowy odstęp od zakończenia stosowania fluoksetyny do rozpoczęcia stosowania selegiliny.

Trójpierścieniowe leki przeciwdepresyjne

U pacjentów przyjmujących jednocześnie trójpierścieniowe leki przeciwdepresyjne i selegilinę sporadycznie zgłaszano nasilone toksyczne działanie na ośrodkowy układ nerwowy (zespół serotoninowy), czasem powiązane z nadciśnieniem, niedociśnieniem i nadmierną potliwością. Dlatego równoczesne stosowanie selegiliny i trójpierścieniowych leków przeciwdepresyjnych jest przeciwwskazane.

Inhibitory MAO

Równoczesne podawanie selegiliny i inhibitorów MAO może powodować zaburzenia ośrodkowego układu nerwowego i układu krążenia (patrz punkt 4.4.).

Połączenia niezalecane

Doustne środki antykoncepcyjne

Należy unikać połączenia selegiliny i doustnych środków antykoncepcyjnych, ponieważ skojarzenie takie może zwiększyć dostępność biologiczną selegiliny.

Równoczesne podawanie z produktami leczniczymi o wąskim indeksie terapeutycznym, jak np. leki zawierające naparstnicę i/lub leki przeciwzakrzepowe, wymaga ostrożności i szczegółowego monitorowania.

Interakcje z żywnością

Ponieważ selegilina jest specyficznym inhibitorem MAO-B, nie zgłaszano, aby pokarmy zawierające tyraminę powodowały nadciśnienie podczas leczenia selegiliną w zalecanej dawce (oznacza to, że selegilina nie wywołuje tzw. „efektu żółtego sera”). Dlatego nie są wymagane żadne ograniczenia dietetyczne. Jednak w przypadku skojarzenia selegiliny z konwencjonalnymi inhibitorami MAO lub MAO-A zalecane są ograniczenia dietetyczne (np. unikanie pokarmów z dużą zawartością tyraminy, takich jak sery dojrzewające i produkty drożdżowe).

4.6. Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Dostępne są bardzo ograniczone dane na temat pacjentek w ciąży.

W badaniach na zwierzętach wykazano toksyczość reprodukcyjną jedynie przy dużych wielokrotnościach dawek stosowanych u ludzi.

Jako środek ostrożności zaleca się unikanie stosowania selegiliny w okresie ciąży.

Nie wiadomo, czy selegilina przenika do mleka ludzkiego. Wydzielanie selegiliny do mleka nie było dotychczas badane u zwierząt. Dane fizykochemiczne na temat selegiliny wskazują na wydzielanie do mleka i nie można wykluczyć ryzyka dla dziecka karmionego piersią. Nie należy stosować selegiliny w okresie karmienia piersią.

4.7. Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Ponieważ selegilina może powodować zawroty głowy, należy zalecić pacjentom, aby nie prowadzili pojazdów ani nie obsługiwali maszyn, jeśli w trakcie leczenia wystąpi u nich takie działanie niepożądane

4.8. Działania niepożądane

W obrębie każdej grupy o określonej częstości występowania objawy niepożądane są wymienione zgodnie ze zmniejszającym się nasileniem Bardzo często ($\geq 1/10$); często ($\geq 1/100$ do $< 1/10$); niezbyt często ($\geq 1/1000$ do $< 1/100$); rzadko ($\geq 1/10\ 000$ do $< 1/1000$); bardzo rzadko ($< 1/10\ 000$); częstość nieznana (częstość nie może być określona na podstawie dostępnych danych).

Zaburzenia psychiczne:

Niezbyt często: zmiany nastroju.

Częstość nieznana: hiperseksualność.

Zaburzenia układu nerwowego:

Często: zawroty głowy, ból głowy.

Niezbyt często: łagodne przejściowe zaburzenia snu.

Zaburzenia serca:

Często: rzadkoskurcz.

Niezbyt często: częstoskurcz nadkomorowy.

Zaburzenia naczyniowe:

Rzadko: niedociśnienie ortostatyczne.

Zaburzenia żołądka i jelit:

Często: nudności.

Niezbyt często: uczucie suchości w ustach.

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej:

Rzadko: reakcje skórne.

Zaburzenia nerek i dróg moczowych:

Częstość nieznana: zatrzymanie moczu.

Badania diagnostyczne:

Często: łagodne zwiększenie aktywności enzymów wątrobowych.

W leczeniu skojarzonym z lewodopą

Ponieważ selegilina wzmacnia działanie lewodopy, działania niepożądane lewodopy (niepokój, hiperkineza, zaburzone ruchy, pobudzenie, splątanie, halucynacje, niedociśnienie ortostatyczne, arytmie serca) mogą nasilić się w czasie terapii skojarzonej (lewodopę należy zwykle podawać w połączeniu z inhibitorem obwodowej dekarboksylazy). Terapia skojarzona z zastosowaniem selegiliny może pozwolić na dalsze zmniejszenie dawki lewodopy (nawet o 30%).

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych

Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych

Al. Jerozolimskie 181 C, 02-222 Warszawa

Tel.: +48 22 49 21 301, Faks: + 48 22 49 21 309, Strona internetowa: <https://smz.ezdrowie.gov.pl>

Działania niepożądane można zgłaszać również podmiotowi odpowiedzialnemu.

4.9. Przedawkowanie

Przedawkowanie nie ma konkretnego obrazu klinicznego. Ponieważ selektywne hamowanie MAO-B przez selegilinę jest osiągnięta jedynie przy dawkach zalecanych w leczeniu choroby Parkinsona (5 do 10 mg/dobę), objawy przedawkowania mogą przypominać objawy obserwowane w przypadku nieselektywnych inhibitorów MAO (zaburzenia ośrodkowego układu nerwowego i układu krążenia). Objawy przedawkowania nieselektywnych inhibitorów MAO mogą narastać w ciągu 24 godzin, obejmując pobudzenie, drżenie, naprzemienne niskie i wysokie ciśnienie krwi, depresję oddechową, nasilone skurcze mięśni, bardzo wysoką gorączkę, śpiączkę i drgawki. Nie ma swoistego antidotum i leczenie powinno być objawowe.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1. Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: leki stosowane w chorobie Parkinsona, dopaminergiczne, inhibitory monoaminooksydazy typu B; kod ATC: N04BD01.

Selegilina należy do grupy selektywnych inhibitorów monoaminooksydazy typu B. Dzięki zmniejszaniu aktywności tego enzymu selegilina spowalnia proces enzymatycznego rozkładu dopaminy w mózgu. Hamuje również wychwyt zwrotny dopaminy. W efekcie, selegilina zwiększa ilość i wydłuża działanie dopaminy (zarówno endogennej, jak i egzogennej) w mózgu. Dzięki temu nasila i wydłuża również działanie lewodopy podawanej w celu leczenia choroby Parkinsona.

W badaniach klinicznych wykazano, że selegilina pozwala na zmniejszenie dawek lewodopy średnio o około 30% (niezależnie od tego, czy lewodopa podawana jest z inhibitorem dekarboksylazy, czy też bez niego). Ponieważ selegilina jest selektywnym inhibitorem monoaminooksydazy typu B, w przeciwieństwie do leków nieselektywnie hamujących monoaminooksydazę może być bezpiecznie stosowana jednocześnie z lewodopą.

5.2. Właściwości farmakokinetyczne

Po podaniu doustnym selegilina jest szybko wchłaniana z przewodu pokarmowego. Maksymalne stężenie we krwi osiąga około 30 minut po przyjęciu doustnym. Biodostępność selegiliny wynosi średnio około 10%. Szybko przenika do tkanek, w tym do mózgu. Pozorna objętość dystrybucji po dożylnym podaniu selegiliny w dawce 10 mg wynosi 500 l. Po osiągnięciu terapeutycznego stężenia we krwi około 75 – 85% związane jest z białkami osocza.

Selegilina jest szybko i prawie całkowicie metabolizowana, głównie w wątrobie, do N-demetylodeprenylu, l-metamfetaminy i l-amfetaminy. Średni okres półtrwania selegiliny wynosi około 1,6 godziny, zaś jej metabolitów (N-demetylodeprenylu, l-metamfetaminy i l-amfetaminy) odpowiednio: 2, 17,7 oraz 20,5 godziny.

Selegilina wydalana jest z organizmu w postaci metabolitów, głównie z moczem (tylko około 15% leku eliminowane jest z kałem).

Działanie selegiliny rozpoczyna się około 1 godziny po doustnym podaniu pojedynczej dawki i utrzymuje się przez 1 – 3 dni.

5.3. Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Długookresowe badania na zwierzętach nie wykazały, aby selegilina wywierała działanie rakotwórcze. Nie stwierdzono również działania mutagennego.

Badania przeprowadzone u zwierząt nie wykazały niekorzystnego wpływu na płód. W badaniach, w których szczurom i królikom podawano selegilinę w dawkach wielokrotnie większych niż dawki zalecane dla ludzi, nie wykazano działania teratogennego.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1. Wykaz substancji pomocniczych

Laktoza jednowodna
Skrobia kukurydziana
Celuloza mikrokrystaliczna
Krzemionka koloidalna
Magnezu stearynian

Otoczka:

Krzemionka koloidalna
Hypromeloza
Sodu dokuzynian
Tytanu dwutlenek (E 171)
Żelaza tlenek żółty (E 172)
Hydroksypropyloceluloza
Makrogol 400
Makrogol 6000

Talk

6.2. Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy

6.3. Okres ważności

3 lata

6.4. Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C. Przechowywać w oryginalnym opakowaniu

6.5. Rodzaj i zawartość opakowania

Blistry z folii Al/PCV w tekturowym pudełku
50 tabletek (2 blistry po 25 sztuk)

6.6. Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania produktu leczniczego do stosowania

Bez specjalnych wymagań

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Bausch Health Ireland Limited
3013 Lake Drive
Citywest Business Campus
Dublin 24, D24PPT3
Irlandia

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Pozwolenie nr 4043

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU I DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 05.03.1999 r.
Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 23.09.2013

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO