

ПРИЛОЖЕНИЕ 1

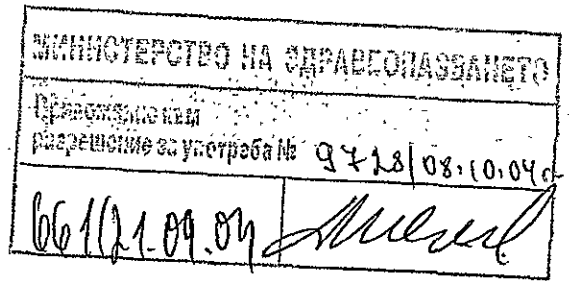
КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА



КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. Име на лекарствения продукт

AERIUS® 5 mg film-coated tablets
ЕРИУС 5 mg филмирани таблетки



2. Качествен и количествен състав

Всяка филмирана таблетка съдържа 5 mg desloratadine. За помощните вещества виж 6.1.

3. Лекарствена форма

Филмирани таблетки.

4. Клинични данни

4.1. Показания

Aerius е показан за облекчаване симптомите свързани със:

- Алергичен ринит (АР);
- Хронична идиопатична уртикария (ХИУ).

4.2. Дозировка и начин на приложение

За възрастни и юноши (над 12-годишна възраст): по една таблетка веднъж дневно, независимо от приема на храна.

4.3. Противопоказания

Свръхчувствителност към активното вещество, някое от помощните вещества или към лоратадин.

4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

Ефикасността и безопасността на Aerius таблетки при деца под 12-годишна възраст все още не е установена.

При тежка бъбречна недостатъчност, Aerius трябва да се прилага внимателно (виж 5.2.).

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Не са наблюдавани клинично значими взаимодействия при клинични изпитвания с Aerius таблетки при ко-администрация на еритромицин и кетоконазол (виж 5.1.). Ензимът, отговорен за метаболизма на desloratadine все още не е идентифициран и затова взаимодействия с други лекарства не могат да бъдат напълно изключени.

При клинично фармакологично изпитване на Aerius, приемането му едновременно с алкохол не потенцира влошаващите психомоторната дейност ефектите на алкохола.

4.6. Бременност и кърмене



Desloratadine не показва тератогенни ефекти при изследвания върху животни. Безопасността на Aerius по време на бременност не е установена. По тази причина не се препоръчва употребата на Aerius по време на бременност.

Дезлоратадин се екскретира в кърмата и затова употребата на Aerius не се препоръчва при кърмачки.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

По време на клинични проучвания сред пациентите приемачи Desloratadine, не е установено нарушение в способността за шофиране. Въпреки това пациентите трябва да бъдат предупреждавани, че макар и много рядко отделни пациенти могат да почувстват сънливост, която да повлияе способността им за шофиране или работа с машини. Aerius няма или притежава незначително влияние върху способността за шофиране и работа с машини.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

При клинични изследвания, включващи индикации като алергичен ринит и хронична идиопатична уртикария в препоръчаната доза от 5 mg на ден, нежелани лекарствени реакции при употребата на Aerius са били съобщени при 3% пациенти повече в сравнение с тези, третирани с плацебо.

Най-често съобщаваните нежелани реакции в сравнение с плацебо са: отпадналост (1.2 %), сухота в устата (0.8 %), главоболие (0.6 %).

Други видове нежелани лекарствени реакции докладвания много рядко в пост-маркетинговия период са представени в следващата таблица:

<u>Нервна система</u>	<u>Световъртеж, сомнолентност</u>
<u>Сърдечно-съдова система</u>	<u>Тахикардия, сърцебиене</u>
<u>Храносмилателна система</u>	<u>Коремна болка, гадене, повръщане, диспепсия, диария</u>
<u>Черен дроб и жлъчни пътища</u>	<u>Повишени чернодробни ензими, повишен билирубин</u>
<u>Общи</u>	<u>Реакции на свръхчувствителност (като анафилаксия, ангиоедем, сърбеж, обрив и уртикария)</u>

В постмаркетинговия период на Aerius са докладвани много редки случаи на реакции на свръхчувствителност, включително анафилактичен шок и обрив.

4.9. Предозиране

В случай на предозиране да се предприемат общоприети мерки за премахване на неабсорбираното активно вещество. Препоръчва се симптоматично и поддържащо лечение.

На базата на клинично изпитване с многократно прилагане, при което се приложи до 45 mg desloratadine (девет пъти повече от лечебната доза), не се наблюдаваха никакви клинично значими ефекти.

Desloratadine не се елиминира чрез хемодиализа; не е известно дали се елиминира чрез перитонеална диализа.

5. Фармакологични свойства

5.1. Фармакодинамични свойства



Фармакотерапевтична група: антихистамини - H₁ антагонист, АТС код: R06A X27

Desloratadine е неседативен хистаминов антагонист с продължително действие и селективна периферна H₁-рецепторна антагонистична активност. След перорално приложение, desloratadine селективно блокира периферните хистаминови H₁-рецептори, защото се изключва от навлизане в централната нервна система.

Desloratadine е показал антиалергични свойства при *in vitro* изследвания. Те включват блокиране освобождаването на про-възпалителни цитокини като IL-4, IL-6, IL-8 и IL-13 от човешки мастоцити/базофили, както и блокиране експресията на адхезионната молекула Р-селектин върху ендотелните клетки. Клиничното значение на тези наблюдения предстои да бъде потвърдено.

При клинично изпитване с многократно приложение, в което в продължение на 14 дни са прилагани до 20 mg desloratadine на ден, не са наблюдавани статистически или клинично значими сърдечно-съдови ефекти. В клинично фармакологично изпитване, в което desloratadine се е прилагал в доза от 45 mg на ден (девет пъти по-голяма от препоръчаната) в продължение на 10 дни, не е наблюдавано удължаване на QTc-интервала.

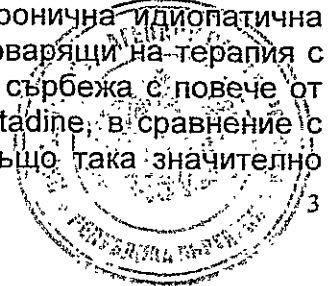
Не е наблюдавана клинично значима промяна в плазмените концентрации на desloratadine при изпитвания на взаимодействието с кетоконазол и еритромицин при многократно прилагане.

Desloratadine не прониква в централната нервна система. По време на клиничните проучвания Вс препоръчителната доза от 5 mg на ден не е установено повишение на честотата на сомнолентност в сравнение с плацебо. Aelius приложен в еднократна дневна доза от 7.5 mg, не е повлиял психомоторните функции в клинични изпитвания. В проведено клинично проучване с еднократна доза при възрастни, desloratadine 5 mg не повлиява общоприетите мерки при изпълнението на полет, включително и усилване на сънливостта или дейностите свързани с полета.

В клинични фармакологични изпитвания съвместното приложение с алкохол не е увеличило предизвиканите от алкохола влошаване на психомоторните функции или повишаване на сънливостта. Не са установени значими разлики в резултатите от психомоторните тестове между групите приемали desloratadine и тези приемали плацебо, независимо от това дали е прилаган или не алкохол.

При пациенти с алергичен ринит Aelius е бил ефективен в облекчаване на симптоми като: кихане, носна секреция и сърбеж, а също така сърбеж, сълзене и зачервяване на очите и сърбеж на небцето. Aelius ефективно контролира симптомите в продължение на 24 h. Ефикасността при пациенти на възраст от 12 -17 години не е ясно демонстрирана.

В две контролирани с плацебо шестседмични изследвания при пациенти със хронична идиопатична уртикария, Aelius ефективно е облекчил сърбежа и е довел до намаляване на големината и броя на обривите до края на първия дозов интервал. Във всяко от изследванията ефектите са се запазили през целия дозов интервал. Както и при други изследвания на антихистаминови препарати при хронична идиопатична уртикария, малцинството от пациентите, определени като неотговарящи на терапия с антихистаминови препарати са били изключени. Облекчение на сърбежа с повече от 50% се наблюдава при 55% от пациентите получавали desloratadine, в сравнение с 19% от пациентите получавали плацебо. Лечението с Aelius също така значително



намали влиянието върху съня и дневните функции, както бе измерено чрез четири степенна скала за оценка на тези променливи.

Aerius е бил ефективен за облекчаване тежестта на алергичен ринит, което личи и от общия резултат от анкетата за качеството на живот при ринит и конюнктивит. Най-голямо подобрене е имало в сферите на практическите проблеми и ежедневните дейности ограничавани от симптомите.

5.2. Фармакокинетични свойства

Плазмени концентрации на desloratadine могат да бъдат установени до 30 min от приложението. Desloratadine се абсорбира добре като максимална концентрация се постига след приблизително 3 h; времето на полуелиминиране е приблизително 27 h. Степента на натрупване на desloratadine зависи от неговия полуживот (приблизително 27 h) и еднократния му дневен прием. Бионаличността на desloratadine е пропорционална на дозата, в границата от 5 mg до 20 mg .

Във фармакокинетично изпитване, в което демографските характеристики на пациентите бяха сравними с тези на общата популация с алергичен ринит, 4% от изследваните имаха по-висока концентрация на desloratadine. Процентът може да варира в зависимост от етническия произход. Максималната измерена концентрация на desloratadine беше над три пъти по-висока за приблизително 7 h с период на полуелиминиране приблизително 89 h. Профилът на безопасност на тези пациенти не се различаваше от този на общата популация.

Desloratadine умерено се свързва с плазмените протеини (83 % - 87 %). Няма данни за клинично значимо натрупване на лекарството при еднократен дневен прием (5 mg до 20 mg) в продължение на 14 дни.

Ензимът отговорен за метаболизма на desloratadine още не е идентифициран и по тази причина някои взаимодействия с други лекарствени продукти не могат да се изключат напълно. В *in vivo* проучвания със специфични инхибитори на CYP3A4 и CYP2D6 беше установено, че тези ензими не са важни за метаболизма на desloratadine. Desloratadine не инхибира CYP3A4 или CYP2D6 и не е нито субстрат нито инхибитор на P-гликопротеин.

При изпитване с еднократна доза от 7.5 mg desloratadine не се установи влияние на храната (висококалорийна, богата на мазнини закуска) върху наличността на desloratadine .

5.3. Предклинични данни за безопасност

Desloratadine е първичният активен метаболит на лоратадин. Предклинични изпитвания проведени с лоратадин и desloratadine показаха, че няма качествени или количествени разлики в профила на токсичност на лоратадин и desloratadine при сравними нива на излагане на desloratadine.

Предклиничните данни за desloratadine не показват определен риск за хора, основавайки се на традиционните изследвания за фармакологична безопасност, токсичност при повторно приложение, генотоксичност и репродуктивна токсичност. При проведени изследвания с лоратадин е доказана липсата на карциногенен потенциал.

6. Фармацевтични данни



6.1. Списък на помощните вещества и техните количества

Сърцевина на таблетката: calcium hydrogen phosphate dihydrate, microcrystalline cellulose, maize starch, talc.

Обвивка: film coat (containing lactose monohydrate, hypromellose, titanium dioxide, macrogol 400, indigotin (E 312)), clear coat (containing hypromellose, macrogol 400), carnauba wax, white wax.

6.2. Физико-химични несъвместимости

Не е приложимо.

6.3. Срок на годност

2 години.

6.4. Специални условия на съхранение

Да се съхранява при температура под 30°C.

Да се съхранява в оригиналната опаковка.

6.5. Данни за опаковката

Aegius таблетки се съдържат в блистери състоящи се от ламиниран блистерен филм с покритие от фолио.

Материалът, от който е направен блистерът е полихлортрифлуоретилен/ПВЦ филм (контактна повърхност с продукта) и покриващо алуминиево фолио с поливинилхлоридно топ-залепващо покритие (контактна повърхност с продукта) запечатан топлинно.

Опаковки от 7, 10, 30, 50 и 100 таблетки.

6.6. Препоръки при употреба

Няма специални изисквания .

7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба

SP Europe
Rue de Stalle 73, B - 1180 Brussels, Belgium

Име и адрес на производителя

Schering-Plough S.p.A., Via F. Kennedy 5, I - 26833 , Comazzo, Italy.
Schering-Plough Labo N.V., Industriepark 30, B-2220, Heist-op-den-Berg, Belgium.

8. Регистрационен номер в регистъра по чл. 28 от ЗЛАХМ

20020038/08.01.2002

9. Дата на първо разрешаване за употреба на лекарствения продукт

II-4666/08.01.2002



10. Дата на последна актуализация на текста
Януари 2003 г.

