

НАЦИОНАЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА  
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1  
Към Рег. № 20120172  
B6/M/M/6-6053  
18-10-2022

**ПРИЛОЖЕНИЕ I**  
**КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА**

**1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ**

Ефестад 5 mg филмирани таблетки  
Efestad 5 mg film-coated tablets

**2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ**

Всяка таблетка съдържа 5 mg деслоратадин (*desloratadine*).

Помощно вещество с известно действие:

31,5 mg изомалт (E953) на филмирана таблетка.

За пълния списък на помощните вещества, вижте точка 6.1.

**3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА**

Филмирани таблетки.

Ефестад 5 mg филмирани таблетки са сини, кръгли, двойноизпъкнали с приблизителен диаметър 6,5 mm.

**4. КЛИНИЧНИ ДАННИ**

**4.1 Терапевтични показания**

Ефестад е показан за облекчаване на симптомите на:

- алергичен ринит (вж. точка 5.1)
- уртикария (вж. точка 5.1).

**4.2 Дозировка и начин на приложение**

Възрастни и юноши (над 12 години):

Препоръчаната доза е една таблетка Ефестад веднъж дневно.

Интермитентният алергичен ринит (наличие на симптоми в продължение на по-малко от 4 дни седмично или в продължение на по-малко от 4 седмици) трябва да бъде лекуван в съответствие с оценката на анамнезата на конкретния пациент, като след овладяване на симптомите лечението може да се спре, а при рецидивирането им – да се възобнови. При персистиращ алергичен ринит (наличие на симптоми в продължение на 4 и повече дни седмично и в продължение на повече от 4 седмици) на пациентите може да се предложи постоянно лечение по време на периодите на експозиция на алергена.

Педиатрична популация

Има ограничен опит от клинични изпитвания по отношение на ефикасността при приложението на деслоратадин при юноши от 12 до 17 години (вж. точки 4.8 и 5.1).

Безопасността и ефикасността на Ефестад 5 mg филмирани таблетки не е установена при деца под 12 години. Липсват данни.

Начин на приложение

Перорално приложение.

Дозата може да се приема със или без храна.

**4.3 Противопоказания**



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

#### **4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба**

##### **Бъбречно увреждане**

При тежка бъбречна недостатъчност, Ефестад трябва да се прилага с повишено внимание (вж. точка 5.2).

##### **Гърчове**

Деслоратадин трябва да се прилага с повишено внимание при пациенти с медицинска или фамилна анамнеза за гърчове и най-вече при малки деца, които са предразположени да развият нови гърчове по време на лечение с деслоратадин. Медицинските специалисти могат да обмислят преустановяване на деслоратадин при пациенти, които получават гърч по време на лечението.

##### **Изомалт (E953)**

Този лекарствен продукт съдържа изомалт (E953). Пациенти с редки наследствени проблеми като непоносимост към фруктоза, не трябва да приемат този лекарствен продукт.

#### **4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие**

При клинични изпитвания с деслоратадин не са наблюдавани клинично значими лекарствени взаимодействия при съвместно приложение с еритромицин или кетоконазол (вж. точка 5.1)

##### **Педиатрична популация**

Проучвания за лекарствени взаимодействия са провеждани само при възрастни.

При клинично-фармакологично изпитване на съвместен прием на Ефестад и алкохол не са установени данни, че Ефестад потенцира ефектите на алкохола, извяващи се с разстройство в поведението (вж. точка 5.1). По време на постмаркетингова употреба обаче са съобщавани случаи на алкохолна непоносимост и интоксикация. Затова се препоръчва повишено внимание, ако едновременно се приема алкохол.

#### **4.6 Фертилитет, бременност и кърмене**

##### **Бременност**

Голям обем данни за бременни жени (за изхода на повече от 1 000 случая на бременност) не показват малформативна или фетална/неонатална токсичност на деслоратадин. Проучванията при животни не показват преки или непреки вредни ефекти, свързани с репродуктивна токсичност (вж. точка 5.3). За предпочитане е, като предпазна мярка, да се избягва употребата на Ефестад по време на бременност.

##### **Кърмене**

Деслоратадин е установен в новородени/кърмачета, кърмени от лекувани жени. Ефектът на деслоратадин при новородени/кърмачета не е известен. Трябва да се вземе решение дали да се преустанови кърменето или да се преустанови терапията с Ефестад, като се вземат предвид ползата от кърменето за детето и ползата от терапията за майката.

##### **Фертилитет**

Липсват данни по отношение на мъжкия или женския фертилитет.

#### **4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини**

Деслоратадин не повлиява или повлиява пренебрежимо способността за шофиране и работа с машини на базата на клинични проучвания. Пациентите трябва да бъдат информирани, че при повечето хора не се наблюдава сънливост. Въпреки това поради индивидуалната реакция на



организма към всички лекарствени продукти, препоръчително е пациентите да се посъветват да не извършват дейности, изискващи умствена концентрация, като шофиране или работа с машини, докато не установят своята собствена реакция към лекарствения продукт.

#### 4.8 Нежелани лекарствени реакции

##### Резюме на профила на безопасност

При клинични изпитвания при възрастни и юноши при голям брой показания, включително алергичен ринит и хронична идиопатична уртикария, при препоръчаната дозировка, е съобщено за нежелани ефекти от деслоратадин с 3% повече от тези при пациентите, получаващи плацебо. Най-честите нежелани събития, докладвани в повече в сравнение с плацебо са: отпадналост (1,2%), сухота в устата (0,8%) и главоболие (0,6%).

##### Педиатрична популация

При клинични проучвания, проведени с 578 подрастващи пациенти между 12 и 17 години, най-честото нежелано събитие е било главоболие; било е наблюдавано при 5,9% от пациентите, лекувани с деслоратадин и 6,9% при пациентите, лекувани с плацебо.

##### Таблично представяне на нежеланите лекарствени реакции

Честотата на нежеланите реакции, съобщавани в клинични проучвания в повече в сравнение с плацебо и други нежелани реакции, за които се съобщава по време на постмаркетинговия период, са изброени в следващата таблица. Според честотата реакциите се определят като много чести ( $\geq 1/10$ ), чести ( $\geq 1/100$  до  $< 1/10$ ), нечести ( $\geq 1/1\,000$  до  $< 1/100$ ), редки ( $\geq 1/10\,000$  до  $< 1/1\,000$ ), много редки ( $< 1/10\,000$ ) и с неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка).

| Системо-<br>органичен клас           | Нежелани реакции, наблюдавани при прием на деслоратадин              |
|--------------------------------------|--|
| Нарушения на метаболизма и храненето |  |
| С неизвестна честота                 | Увеличен апетит  |
| Психични нарушения                   |  |
| Много редки                          | Халюцинации  |
| С неизвестна честота                 | Абнормно поведение, агресия, депресивно настроение                   |
| Нарушения на нервната система        |  |
| Чести                                | главоболие   |
| Много редки                          | Замаяност, сънливост, безсъние, психомоторна хиперактивност, гърчове |
| Нарушения на очите                   |  |
| С неизвестна честота                 | Сухота в очите   |
| Сърдечни нарушения                   |  |
| Много редки                          | Тахикардия, палпитации   |



|  |  |
|--|--|
| С неизвестна честота   | Удължаване на QT интервала   |
| <b>Стомашно-чревни нарушения</b>                                       |  |
| Чести  | Сухота в устата  |
| Много редки  | Болка в корема, гадене, повръщане, диспепсия, диария   |
| <b>Хепатобилиарни нарушения</b>  |  |
| Много редки  | Повишаване на чернодробните ензими, повишаване на билирубина, хепатит                          |
| С неизвестна честота   | Жълтеница  |
| <b>Нарушения на кожата и подкожната тъкан</b>                          |  |
| С неизвестна честота   | Фоточувствителност   |
| <b>Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан</b> |  |
| Много редки  | Миалгия  |
| <b>Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение</b>                |  |
| Чести  | умора  |
| Много редки  | Реакции на свръхчувствителност (като анафилаксия, ангиоедем, задух, сърбеж, обрив и уртикария) |
| С неизвестна честота   | астения  |
| <b>Изследвания</b>   |  |
| С неизвестна честота   | Увеличено тегло  |

#### Педиатрична популация

Други нежелани лекарствени реакции с неизвестна честота, съобщени по време на постмаркетинговия период при педиатрични пациенти, включват удължаване на QT интервала, аритмия, брадикардия, абнормно поведение и агресия.

#### 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:

Изпълнителна агенция по лекарствата

ул. „Дамян Груев“ №8

1303 София

тел.: +3592 8903417

уебсайт: [www.bda.bg](http://www.bda.bg)

#### **4.9 Предозиране**



Профилът на нежеланите събития свързани с предозиране, наблюдаван по време на постмаркетингова употреба е подобен на този, наблюдаван при терапевтични дози, като степента на въздействие може да бъде по-висока.

#### Лечение

В случай на предозиране обмислете стандартни мерки за отстраняване на неабсорбираното активно вещество. Препоръчва се симптоматично и поддържащо лечение.

Деслоратадин не се елиминира чрез хемодиализа. Не е известно дали се елиминира чрез перитонеална диализа.

#### Симптоми

При клинично изпитване с многократно прилагане, при което е приложен деслоратадин до 45 mg (девет пъти повече от терапевтичната доза), не са установени клинично значими ефекти.

#### Педиатрична популация

Профилът на нежеланите събития, свързани с предозиране, наблюдаван по време на постмаркетингова употреба е подобен на този, наблюдаван при терапевтични дози, като степента на въздействие може да бъде по-висока.

### **5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА**

#### **5.1 Фармакодинамични свойства**

**Фармакотерапевтична група: антихистамини - H1-антагонисти, АТС код: R06A X27**

#### Механизъм на действие

Деслоратадин е дълго действащ хистаминов антагонист със селективна периферна H1-рецепторна антагонистична активност, без седативно действие. След перорален прием, деслоратадин блокира селективно периферните хистаминови H1-рецептори, понеже не прониква в централната нервна система.

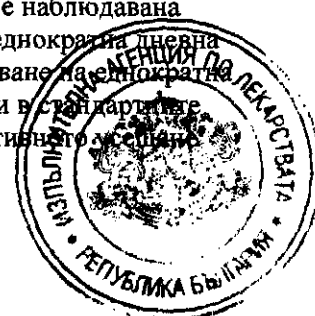
При *in vitro* изследвания деслоратадин е показал антиалергични свойства. Те включват инхибиране на освобождаване на проинфламаторни цитокини като IL-4, IL-6, IL-8 и IL-13 от човешките мастоцити и базофили, както и инхибиране на експресията на адхезионната протеин молекула Р-селектин върху ендотелните клетки. Клиничното значение на тези наблюдения все още не е напълно изяснено.

#### Клинична ефикасност и безопасност

При клинично изпитване на различни дозови режими, при което са достигнати дозировки от 20 mg дневно в продължение на 14 дни, не са установени статистически или клинично значими ефекти от страна на сърдечно-съдовата система. При клинично фармакологично изпитване, при което деслоратадин е прилаган в доза 45 mg дневно (девет пъти по-висока от терапевтичната доза), не е наблюдавано удължаване на QTc-интервала.

При клинично изпитване с многократно приложение на съвместен прием с кетоконазол и еритромицин не са установени клинично значими промени в плазмената концентрация на деслоратадин.

Деслоратадин не прониква лесно в централната нервна система. При контролирани клинични изпитвания, при препоръчителната дневна доза 5 mg, в сравнение с плацебо не е наблюдавана по-висока честота на сънливост. При клинични изпитвания на деслоратадин в еднократна дневна доза 7,5 mg не са установени промени в психомоторното поведение. При изпитване на еднократна дневна доза деслоратадин 5 mg дневно при възрастни не са установени промени в стандартните показатели за поведение по време на полет, включително и засилване на субективното усещане за сънливост или за други дейности, свързани с полета.



При клинични фармакологични изпитвания на съвместен прием с алкохол не е установено повишаване на свързаното с алкохола разстройство в поведението или засилване на сънливостта. Не са установени значими разлики в резултатите от психомоторните тестове между групите, приемащи деслоратадин и тези, приемащи плацебо – както при прием на алкохол, така и без прием на алкохол.

При пациенти с алергичен ринит деслоратадин е ефикасен по отношение облекчаване на симптомите –като кихане, сърбеж и секреция от носа, сърбеж и зачервяване на очите, сълзене, както и сърбеж на небцето. Ефестад ефикасно контролира симптомите в продължение на 24 часа.

#### Педиатрична популация

Ефикасността на деслоратадин таблетки не е демонстрирана категорично в клинични изпитвания с пациенти в юношеска възраст от 12 до 17 години.

Освен по утвърдената класификация на алергичния ринит като сезонен и целогодишен, в зависимост от продължителността на проява на симптомите той може да бъде класифициран и като интермитентен алергичен ринит и персистиращ алергичен ринит. Интермитентният алергичен ринит се дефинира като наличие на симптоми в продължение на по-малко от 4 дни седмично или в продължение на по-малко от 4 седмици. Персистиращият алергичен ринит се дефинира като наличие на симптоми в продължение на 4 или повече дни седмично и в продължение на повече от 4 седмици.

Деслоратадин ефикасно облекчава симптомите на сезонния алергичен ринит, както се вижда от общия скор от въпросника за качество на живот при рино-конюнктивит. Най-голямо подобрене се наблюдава в разделите за практически проблеми и ограничаване на ежедневната дейност от симптомите.

Хроничната идиопатична уртикария е била проучена като клиничен модел на уртикариални състояния, тъй като независимо от етиологията, подлежащите патофизиологични механизми са сходни и защото включването на хронично болни пациенти в проспективни проучвания е по-лесно. Тъй като причинният фактор за всички уртикариални заболявания е освобождаването на хистамин, се очаква деслоратадин да е ефективен по отношение на облекчаване на симптомите и на други свързани с уртикария състояния, освен хроничната идиопатична уртикария, както се препоръчва в клиничните указания.

При две плацебо-контролирани 6-седмични изпитвания при пациенти с хронична идиопатична уртикария деслоратадин е бил ефикасен в облекчаването на сърбежа и намаляване на размера и броя на уртиките още в края на първия дозов интервал. При всяко едно от изпитванията ефектът се е поддържал през целия 24-часов дозов интервал. Както и при други изпитвания на антихистамини за хронична идиопатична уртикария, малък брой от пациентите, идентифицирани като неотговарящи на антихистамини, са били изключвани. Облекчаване на сърбежа с над 50% е наблюдавано при 55% от пациентите, лекувани с деслоратадин, в сравнение с 19% от пациентите, получили плацебо. Лечението с деслоратадин е намалило значително нарушението на ритъма на сън и бодърстване, измерено по четири-точкова скала, използвана за оценка на тези променливи.

## 5.2 Фармакокинетични свойства

### Абсорбция

В плазмата деслоратадин може да бъде открит 30 минути след приема му. Деслоратадин има добра резорбция, като максимална плазмена концентрация се постига приблизително след 3 часа. Полуживотът на терминалната фаза е приблизително 27 часа. Степента на кумулиране на деслоратадина е в зависимост от неговия плазмен полуживот (27 часа) и еднократния прием.



прием. Бионаличността на деслоратадин е пропорционална на дозата в интервала от 5 до 20 mg.

При фармакокинетично изпитване, при което демографският профил на пациентите е бил сравним с този на общата популация пациенти със сезонен алергичен ринит, при 4% от пациентите е постигната по-висока концентрация на деслоратадин. Този процент може да варира в зависимост от етническия произход на пациентите. Максималната концентрация на деслоратадин е била около 3 пъти по-висока приблизително на седмия час, при полуживот на терминалната фаза приблизително 89 часа. Профилът на безопасност на тези пациенти не се е различавал от този на общата популация.

#### Разпределение

Деслоратадин се свързва в умерена степен (83-87%) с плазмените протеини. Няма данни за клинично значимо кумулиране на лекарството при еднократен дневен прием на деслоратадин (5 до 20 mg) в продължение на 14 дни.

#### Биотрансформация

Ензимът отговорен за метаболизирането на деслоратадин все още не е идентифициран и следователно някои лекарствени взаимодействия с други лекарствени продукти не може да бъдат напълно изключени. Деслоратадин не инхибира CYP3A4 *in vivo*, а в *in vitro* проучванията е показано, че лекарственият продукт не инхибира CYP2D6 и не е субстрат, нито инхибитор на Р-гликопротеина.

#### Елиминиране

В проучване с еднократна доза от 7,5 mg деслоратадин, не е била установена зависимост на разпределението на деслоратадин от вида на храната (богата на мазнини, висококалорична закуска). В друго проучване, приемът на сок от грейпфрут не е оказал влияние върху разпределението на деслоратадин.

#### Пациенти с бъбречно увреждане

Фармакокинетиката на деслоратадин е сравнена при пациенти с хронична бъбречна недостатъчност (ХБН) с тази при здрави хора в проучване с единична доза и проучване с многократно прилагане. В проучването с единична доза, експозицията на деслоратадин е била приблизително 2 и 2,5 пъти по-висока при участници с лека степен до умерена и тежка степен на ХБН, сравнена с тази при здрави участници. В проучването с многократно прилагане, стационарно състояние е достигнато след 11-ия ден и експозицията на деслоратадин е около 1,5 пъти по-висока при участници с лека до умерена степен на ХБН, и около 2,5 пъти по-висока при участници с тежка степен на ХБН, в сравнение със здравите участници. И при двете проучвания не са установени клинично значими промени в експозицията (AUC и C<sub>max</sub>) на деслоратадин и 3-хидроксидеслоратадин.

### **5.3 Предклинични данни за безопасност**

Деслоратадин е основният активен метаболит на лоратадин. Неклинични изпитвания на деслоратадин и лоратадин са показали, че няма качествена и количествена разлика в профила на токсичност на деслоратадин и лоратадин при сравними нива на експозиция към деслоратадин.

Неклиничните данни за деслоратадин не показват особен риск за хората на база на конвенционалните фармакологични изпитвания за безопасност, токсичност при многократно приложение, генотоксичност, репродуктивна токсичност. Липсата на карциногенен потенциал е демонстрирана при изпитвания на деслоратадин и лоратадин.

## **6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ**

### **6.1 Списък на помощните вещества**



Ядро на таблетката:  
Изомалт (E953)  
Нишесте, прежелатинизирано (царевично)  
Целулоза, микрокристална  
Магнезиев оксид, тежък  
Хидроксипропилцелулоза  
Кросповидон (тип А)  
Магнезиев стеарат

Обвивка на таблетката:  
Поливинил алкохол  
Титанов диоксид (E171)  
Макрогол /PEG 3350  
Талк  
Брилянтно синьо / индиго кармин алуминиев лак (E132)

**6.2 Несъвместимости**  
Неприложимо.

**6.3 Срок на годност**  
48 месеца

**6.4 Специални условия на съхранение**  
Да не се съхранява над 30°C.  
Да се съхранява в оригиналната опаковка за защита от влага.

**6.5 Данни за опаковката**  
Таблетките Ефестад се доставят в блистери от полихлоротрифлуороетилен (PCTFE)/поливинилхлорид (PVC)/Алуминий.  
Опаковки от 7, 10, 20, 30 филмирани таблетки.  
Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати в продажба.

**6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа**  
Няма специални изисквания.

**7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**  
Stada Arzneimittel AG  
Stadastrasse 2-18, 61118 Bad Vilbel  
Германия

**8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**  
Регистрационен № 20120172

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

Дата на първо разрешаване: 26.03.2012  
Дата на последно подновяване: 15.02.2019

**10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА**  
06/2022

