

## 1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Деслоратадин Алвоген 5 mg филмирани таблетки  
Desloratadine Alvogen 5 mg film-coated tablets

## 2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка филмирана таблетка съдържа 5 mg деслоратадин

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

## 3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филмирана таблетка

Сини, кръгли, двойно-изпъкнали филмирани таблетки с размери 6.5mm x 3.2 mm.

## 4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

### 4.1 Терапевтични показания

Деслоратадин Алвоген е показан за облекчаване на симптоми, свързани с:

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

### 4.2 Дозировка и начин на приложение

Възрастни и юноши (12-годишни и повече): една таблетка дневно, с или без храна за облекчаване симптомите, свързани с алергичен ринит (включително интермитентен и персистиращ алергичен ринит) и уртикария (вж. точка 5.1).

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

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 от анамнезата на пациента, като лечението може да се прекъсне след овладяване на симптомите и да се възобнови при тяхното повторно появяване.

При персистиращия алергичен ринит (наличие на симптоми в продължение на 4 или 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.

### Начин на приложение

Дозата може да се приема независимо от храненето.

### 4.3 Противопоказания

<b>ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВЕТА</b>	
Кратка характеристика на продукта - Приложение I	
Към Рег. №	20122261
Разрешение №	18879 / 20.07.2012
Област №	1



Свръхчувствителност 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**

Ефикасността и безопасността на Деслоратадин Алвоген таблетки при деца под 12-годишна възраст не е установена.

В случаи на тежка бъбречна недостатъчност Деслоратадин Алвоген трябва да се прилага с внимание (вж. точка 5.2).

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

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

При клинично-фармакологично изпитване на съвместния прием на деслоратадин таблетки и алкохол, деслоратадин не потенцира ефектите на алкохола, изявяващи се с разстройство в поведението (вж. точка 5.1).

При клиникофармакологичен изпитване деслоратадинови таблетки, приети едновременно с алкохол, не потенцират вредните ефекти на алкохола (вж точка 5.1).

Ензимът, отговорен за метаболизирането на деслоратадин все още не е установен и поради това взаимодействия с други лекарствени продукти не могат да бъдат напълно изключени. Деслоратадин не инхибира CYP3A4 *in vivo*, *in vitro* изследванията показват, че лекарственият продукт не инхибира CYP2D6 и не е нито субстрат, нито инхибитор на Р-гликопротеина.

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

##### **Бременност**

Деслоратадин не е тератогенен при изпитвания върху животни. Безопасната употреба на този продукт по време на бременност не е установена. Поради това не се препоръчва употребата на деслоратадин таблетки, диспергиращи се в устата по време на бременност.

##### **Кърмене**

Деслоратадин се излъчва в кърмата и поради това употребата на деслоратадин таблетки, диспергиращи се в устата при кърмачки не се препоръчва.

##### **Фертилитет**

Няма данни за фертилитет.

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

При клинични изпитвания за оценка на въздействието върху способността за шофиране, не се установява нарушение в способността за шофиране при пациенти, приемачи деслоратадин. Въпреки това пациентите трябва да бъдат информирани, че много рядко при



някои хора се наблюдава сънливост, която може да повлияе способността им за шофиране или работа с машини.

#### 4.8 Нежелани лекарствени реакции

При клинични изпитвания при голям брой показания, включително алергичен ринит и хронична идиопатична уртикария, при препоръчителна дозировка от 5 mg, е съобщено за нежелани ефекти на деслоратадин таблетки с 3% повече, в сравнение с пациентите, получаващи плацебо.

Най-честите нежелани събития, докладвани в повече в сравнение с плацебо са: умора (1,2%), сухота в устата (0,8%) и главоболие (0,6%). При клинично изпитване с 578 пациенти в юношеска възраст, от 12 до 17 години, най-честата нежелана реакция е главоболие; то се наблюдава при 5,9% от пациентите, лекувани с деслоратадин, и при 6,9% от пациентите, получаващи плацебо.

Други нежелани ефекти, съобщавани много рядко по време на постмаркетинговия период, са:

**Психични нарушения:** халюцинации.

**Нарушения на нервната система:** замаяност, сънливост, безсъние, психомоторна възбуда, хиперактивност, припадъци.

**Сърдечни нарушения:** тахикардия, сърцебиене.

**Стомашно-чревни нарушения:** болка в корем, гадене, повръщане, диспепсия, диария.

**Хепато-билиарни нарушения:** повишаване на чернодробните ензими, повишаване на билирубина, хепатит.

**Нарушения на мускулно-скелетната система и на съединителната тъкан:** миалгия

**Общи нарушения:** реакции на свръхчувствителност (като анафилаксия, ангиоедем, задух, сърбеж, обрив и уртикария).

#### 4.9 Предозиране

В случай на предозиране се препоръчва стандартното поведение за почистване от нерезорбираната активна съставка. Препоръчва се симптоматично и поддържащо лечение.

При клинично изпитване на различни дозови режими при възрастни юноши, при което са достигнати дозировки от 45 mg деслоратадин (девет пъти по-високи от терапевтичната доза), не са установени клинично значими ефекти на предозиране.

Деслоратадин 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

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

Деслоратадин е показал антиалергични свойства при изследвания *in vitro*. Те включват инхибиране на освобождаването 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 молекула Р-селектин върху ендотелните клетки. Клиничната релевантност на тези изследвания все още не е потвърдена.

При клинично изпитване на различни дозови режими, при което се приема 20 mg деслоратадин 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 се приема в доза от 45 mg дневно (девет пъти по-висока от терапевтичната доза) в продължение на 10 дни не се наблюдава удължаване на QT интервала.

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

Деслоратадин не прониква лесно в централната нервна система. При клинични изпитвания при препоръчителната дневна доза от 5 mg, не е наблюдавана по-висока честота на сънливост в сравнение с плацебо. При клинични изпитвания на деслоратадин таблетки от 7.5 mg, прилагани в еднократна дневна доза не са установени промени в психомоторното поведение. При изпитване на еднократна дневна доза деслоратадин от 5 mg 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 таблетки е ефикасен за облекчаване на симптоми като кихане, секреция от носа и сърбеж, както и при сърбеж, сълзене и зачервяване на очите и сърбеж на небцето. Деслоратадин ефикасно овладява симптомите за 24 часа. Ефикасността на деслоратадин таблетки не е ясно демонстрирана при клинични изпитвания с пациенти в юношеска възраст от 12 до 17 години.

Освен по утвърдените класификации 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 таблетки ефикасно облекчава тежестта на сезонния алергичен ринит, както се вижда от общия резултат от въпросника за качество на живот при риноконюнктивит. Най-голямо подобрене се наблюдава в разделите за практически проблеми и ограничаване на ежедневната дейност вследствие на симптомите.

Хроничната идиопатична уртикария е била проучена като клиничен модел за уртикариални състояния, тъй като независимо от етиологията подлежащата патофизиология е сходна 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 при облекчаване на сърбежа и намаляване размера и броя на уртиките 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 антихистамин за хронична идиопатична уртикария, малък брой от пациентите, идентифицирани като неотговарящи на антихистамини, са били изключвани. Облекчаване на сърбежа над 50% е наблюдавано при 55% от пациентите, лекувани с деслоратадин, в сравнение с 19% от пациентите, получавали плацебо. Лечението с деслоратадин е намалило значително нарушението на ритъма сън и бодърстване, измерено по 4-точковата скала, използвана за оценка на тези променливи.

## 5.2 Фармакокинетични свойства

### Абсорбция

В плазмата деслоратадин може да бъде открит до 30 мин след приемането му при възрастни и юноши. Деслоратадин се резорбира добре, като максимална плазмена концентрация се достига приблизително след 3 часа.

### Разпределение

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

### Биотрансформация

Ензимът, отговорен за метаболизирането на деслоратадин все още не е установен и поради това взаимодействия с други лекарствени продукти не могат да бъдат напълно изключени. Деслоратадин не инхибира CYP3A4 *in vivo*, *in vitro* изследванията показват, че лекарственият продукт не инхибира CYP2D6 и не е нито субстрат, нито инхибитор на Р-гликопротеина.

При изпитване на единична доза от 7.5 mg деслоратадин не е установена зависимост на разпределението на деслоратадин от вида на храната (богата на мазнини висококалорична закуска). В отделно изпитване приемът на сок от грейпфрут не е оказал влияние върху разпределението на деслоратадин.



### Елиминиране

Полуживотът на терминалната фаза е приблизително 27 часа. Степента на кумулиране на деслоратадин е в съответствие с неговия плазмен полуживот (приблизително 27 часа) и еднократния дневен прием.

При фармакокинетично изпитване, при което демографските данни на пациентите са били сравними с тези на общата популация при сезонен алергичен ринит, при 4 % от пациентите е постигната по-висока концентрация на деслоратадин. Този процент може да варира според етническата принадлежност. Максималната концентрация на деслоратадин е приблизително 3 пъти по-висока за около 7 часа с полуживот на терминалната фаза от приблизително 89 часа. Профилът на безопасност на тези пациенти не се различава от този на общата популация.

### Линейност/ нелинейност

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

## **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:

Целулоза, микрокристална  
Царевично нишесте, прежелатинирано  
Магнезиев стеарат  
Силициев диоксид, колоиден безводен

#### Обвивка на таблетката:

Опадрай син 03A30735 (който се състои от:  
Хипромелоза  
Титанов диоксид (E171)  
Целулоза, микрокристална  
Стеаринова киселина  
Индигодин (E132)

### **6.2 Несъвместимости**

Неприложимо



### **6.3 Срок на годност**

24 месеца

### **6.4 Специални условия на съхранение**

Съхранявайте в оригиналната опаковка, за да предпазите от светлина и влага.

### **6.5 Вид и съдържание на опаковката**

PVC/PE/PVDC - Al блистери

1, 2, 3, 5, 7, 10, 14, 15, 20, 21, 30, 50, 90 и 100 филмирани таблетки

PVC/PCTFE (Aclar) – Al блистери

1, 2, 3, 5, 7, 10, 14, 15, 20, 21, 30, 50, 90 и 100 филмирани таблетки

Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати в продажба..

### **6.6 Специални условия на изхвърляне**

Всеки неизползван лекарствен продукт или отпадъчен материал трябва да се изхвърли в съответствие с местните изисквания.

## **7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

Alvogen IPCo S.ar.l

5, rue Heienhaff, L-1736 Senningerberg

Люксембург

## **8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

## **9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШЕНИЕ И ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО**

10. **ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШЕНИЕ:** {ДД месец ГТТГ}

Дата на последното подновяване: {ДД месец ГТТГ}

## **11. ДАТА НА АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА**

{ММ/ГТТГ}

