

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*)
Помощни вещества: 31,5 mg изомалт (E953) на филмирана таблетка.
За пълния списък на помощните вещества, вижте точка

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към Рег. №	20120172
Разрешение №	4-17297 / 26.03.2012
Содобрение №	/

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): една таблетка веднъж дневно, приета със или без храна, за облекчаване на симптомите на алергичен ринит (включително на 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 години (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 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.

4.3 Противопоказания

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

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Липсват достатъчно данни за ефикасността и безопасността на Ефестад таблетки при деца под 12-годишна възраст.

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



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

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

При клинични изпитвания на деслоратадин не са наблюдавани клинично значими лекарствени взаимодействия при съвместно приложение с еритромицин или кетоконазол (вж. точка 5.1)
При клинично-фармакологично изпитване на съвместен прием на Ефестад и алкохол не са установени данни, че Ефестад потенцира ефектите на алкохола, изявяващи се с разстройство в поведението. (вж. точка 5.1).

4.6 Бременност и кърмене

При изпитвания на деслоратадин върху животни не са установени данни за тератогенност. Няма данни за безопасността на лекарствения продукт по време на бременност. Поради това не се препоръчва приемът на Ефестад от бременни жени.
Деслоратадин се излъчва в кърмата и поради това приемът на Ефестад от кърмачки не се препоръчва.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

При клинични изпитвания за оценка на въздействието върху способността за шофиране не са установени данни, че Ефестад повлиява способността за шофиране и работа с машини. Въпреки това, пациентите трябва да бъдат предупреждавани, че макар и много рядко, при някои хора се наблюдава сънливост, която може да се отрази върху способността им за шофиране и работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

При клинични изпитвания на голям брой показания, включително алергичен ринит и хронична идиопатична уртикария, при препоръчаната дозировка от 5 mg дневно, е съобщено за нежелани ефекти от Ефестад 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%). 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. Останалите нежелани ефекти, за които се съобщава изключително рядко по време на постмаркетинговия период, са изброени в следващата таблица.

Психични нарушения	Халюцинации
Нарушения на нервната система	Замаяност, сънливост, безсъние, психомоторна възбуда, гърчове
Сърдечни нарушения	Тахикардия, сърцебиене
Стомашно-чревни нарушения	Болка в корема, гадене, повръщане, диспептични оплаквания, диария
Хепато-билиарни нарушения	Повишаване на чернодробните ензими, повишаване на билирубина, хепатит
Нарушения на мускулно-	Миалгия



скелетната система и съединителната тъкан	
Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение	Реакции на свръхчувствителност (като анафилактични реакции, ангиоедем, задух, сърбеж, обриви 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 което са достигани дозировки от 45 mg (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-антагонисти, АТС код: R06A X27

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.

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 кетоназол 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 Ефестад 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 Ефестад 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. Ефикасността на Ефестад 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.

Ефестад ефикасно облекчава симптомите на сезонния алергичен ринит, както се вижда от общия скор от въпросника за качество на живот при рино-конюнктивит. Най-голямо подобрение 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 Ефестад 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 Ефестад 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

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 дневен 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.

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.

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

При изпитване на единична доза 7,5 mg деслоратадин не е установена зависимост на разпределението на деслоратадин от вида на храната (богата на мазнини висококалорична закуска). При друго изпитване, приемът на сок от грейпфрут не е оказал влияние върху разпределението на деслоратадин.

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

30 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 Ефстад се доставят в блистери от полихлоротрифлуороетилен (PCTFE)/поливинилхлорид (PVC)/Алуминий.

Опаковки от 7, 10, 15, 20, 30, 50, 60, 90, 100, 120, 150, 180 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

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

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Декември 2011

