

## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

### 1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Erolin<sup>®</sup> 1 mg/ml syrup  
Еролин 1 mg/ml сироп

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВОТА
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1
Към РУ 11-1300, 20.12.04
Одобрено: 6/25.09.07

### 2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Лекарствено вещество:  
5 mg loratadine в 5 ml сироп.

Помощни вещества:  
Списъкът на помощните вещества е представен в т.6.1.

### 3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Сироп за перорално приложение

#### Описание:

Бледо жълт, прозрачен, сладък, хомогенен сироп с характерен (плодов) аромат и вкус.

### 4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

#### 4.1. Терапевтични приложения

##### Възрастни:

Erolin сироп може да бъде използван за облекчаване симптомите на:

- сезонен и целогодишен алергичен ринит (кихане, сърбеж и ринорея);
- алергични конюнктивити (щимене и парене на конюнктивата);
- идиопатична хронична уртикария.

##### Деца над 2 годишна възраст:

- сезонни алергични ринити;
- кожни алергични реакции (напр. идиопатична уртикария).

#### 4.2. Дозировка и начин на приложение

Към сиропа има мерителна лъжичка с вместимост 5 ml.



**Възрастни, пациенти в напреднала възраст и деца над 12 годишна възраст:**

Две мерителни лъжички (10 ml) еднократно дневно.

**Деца на възраст между 6 и 12 години или с телесна маса над 30 kg:**

2 мерителни лъжички (10 ml) еднократно дневно;

**Деца на възраст между 2 и 6 години или с телесна маса под 30 kg:**

1 мерителна лъжичка (5 ml) еднократно дневно;

**Особени групи пациенти:**

Пациенти с чернодробна недостатъчност, както и пациенти с нарушена бъбречна функция (гломерулна филтрация < 30 ml/min) и деца над 6 годишна възраст: 5 ml еднократно дневно или 10 ml през ден.

Деца на възраст 2-6 години: 5 ml сироп през ден.

При добра поносимост дозата може да се увеличи постепенно до 5 ml сироп дневно.

#### 4.3. Противопоказания

Erolin сироп не трябва да се дава на:

- пациенти с данни за свръхчувствителност към лекарственото вещество или някое от помощните вещества;
- бременни жени и/или кърмачки;
- деца под 2 годишна възраст.

#### 4.4. Специални предупреждения и препоръки при употреба

Пациенти с тежка чернодробна или бъбречна недостатъчност (гломерулна филтрация < 30 ml/min) трябва да бъдат лекувани с повишено внимание като началните дози са по-ниски (виж т. 4.2.).

Приложението на loratadine е противопоказано при деца под 2 годишна възраст, поради липса на клиничен опит.

Пациентите трябва да се съветват да спрат лечението с Erolin поне 4 дни преди правенето на тест на Prick, за да се избегне фалшиво отрицателен резултат от теста.

5 ml Erolin сироп съдържат 3 g захароза. Обичайната дневна доза (10 ml) съдържа 6 g захароза, което трябва да се има предвид при лечение на пациенти със захарен диабет. Пациенти с редките наследствени заболявания фруктозна непоносимост, глюкозо-галактозен малабсорбционен синдром или захарозо-изомалтазна недостатъчност не трябва да приемат това лекарство.



#### 4.5. Лекарствени или други взаимодействия

Лечението с Erolin трябва внимателно да се комбинира с някои от изброените лекарствени продукти:

- erythromycin, cimetidine, ketoconazole. Едновременното приложение на Erolin заедно с някои от тези лекарствени продукти може да доведе до повишаване плазмените нива на loratadine и неговите метаболити. Плазмените концентрации на cimetidine и ketoconazole остават непроменени, докато плазмените нива на erythromycin се намаляват с 15 %.
- Инхибиторите на чернодробните ензими (напр. quinidine, fluconazole и fluoxetine). Поради липса на контролирани клинични проучвания тези инхибитори се комбинират внимателно с loratadine.

Loratadine не потенцира ефекта на алкохола върху психомоторните функции.

При приемането на loratadine по време и след хранене, резорбцията му се забавя, но терапевтичните ефекти остават непроменени.

#### 4.6. Бременност и кърмене

Проучванията при животни не показаха поява на тератогенни ефекти.

Третирането с високи дози е ембриотоксично.

Лечението с Erolin е противопоказано по време на бременност, тъй като липсва клиничен опит по отношение безопасността на лекарствения продукт при бременни жени.

Тъй като loratadine се екскретира с майчиното мляко, лекарствения продукт не трябва да се прилага при кърмачки.

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

Ако Erolin се прилага за пръв път, пациентите трябва да се посъветват да следят за появата на нежелани лекарствени реакции (напр. сънливост), които могат да нарушат техните способности за управляване на превозни средства или за работа с машини. Пациентите трябва да бъдат инструктирани да продължат с такива активности само в случай, че не са възникнали нежелани реакции.

#### 4.8. Нежелани лекарствени реакции

Приемането на Erolin в препоръчаната дозировка не причинява клинично значим седативен и антихолинергичен ефект.

Рядко (но понякога при повече от 2 % от пациентите) могат да се появят такива нежелани реакции като сънливост, главоболие, уморяемост, сухота в устата, гастро-интестинални нарушения (например гадене и стомашно-чревен дискомфорт), повишен апетит, кожни реакции на свръхчувствителност.

Рядко могат да се наблюдават тахикардия и синкоп, но тяхната корелация с лечението с loratadine не е доказана.



Много рядко са били наблюдавани оплешивяване, анафилактоидни реакции и нарушения в бъбречната функция.

#### 4.9. Предозиране

**Симптоми:** Седативният ефект е по-изразен след примане на 40 mg или повече loratadine, като също са наблюдавани сомнолентност, тахикардия и главоболие.

Единична доза от 160 mg loratadine обаче, не е причинила значителни нежелани реакции, а удължаването на QT- интервала при тази доза не е било клинически значимо.

**Лечение:** Препоръчва се незабвно започване на поддържащо и симптоматично лечение. Показано е провокирано повръщане, освен за пациенти в кома. Употребата на Iресасуапна (еметик) е препоръчана дори ако се наблюдава спонтанно повръщане. След евакуиране на стомаха може да се опита прилагане на активен въглен и вода. Ако повръщането не е предизвикано или е противопоказано се препоръчва стомашна промивка с физиологичен разтвор. Осмотичните лаксативни лекарства също могат да бъдат от полза. Loratadine не подлежи на диализа.

След предприемане на тези спешни мерки пациентите трябва да бъдат под строг медицински контрол.

### 5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

#### 5.1. Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Други антихистамини за системно приложение.  
АТС код: R06A X13

Loratadine, лекарственото вещество на Erolin сироп, е дългодействащ трицикличесен селективен периферен  $H_1$  антагонист. В клинично отношение няма значим седативен ефект или антихолинергична активност. Loratadine има слаб афинитет към церебралните рецептори, и не минава лесно кръвно-мозъчната бариера. Седативния ефект на дозата от 10 mg е подобен на този на плацебо. Дори продължително лечение не води до значителни клинични промени в жизнените функции, лабораторните показатели, психичното състояние или до промени в ЕКГ. При използването на доза, 2-4 пъти по-голяма от терапевтичната (10 mg дневно) беше отчетена сънливост, проявяваща се по дозозависим начин.

Loratadine няма ефект върху  $H_2$  рецепторите, не подтиска обратното захващане на норадреналин и няма ефект върху сърдечно-съдовата система и особено върху вътрешната ритмогенна активност на миокарда. Едно клинично проучване доказва, че дори прилагането на четирикратно по-голяма от терапевтичната доза за 90 дни не причини клинически значимо удължение на QT-интервала.



Ефектът на loratadine настъпва 1 - 3 часа след перорален прием, максимален клиничен ефект се постига 4 - 12 часа след приема, а продължителността на ефекта е поне 24 часа. Ефектът на потискане на уртикарията беше наблюдаван 1 час след приемане на 10 - 160 mg loratadine еднократно. При деца еднократна доза от 10 mg е значително по-ефективна при уртикария, отколкото плацебо.

## 5.2. Фармакокинетични свойства

### РЕЗОРБЦИЯ и МЕТАБОЛИЗЪМ

Loratadine се резорбира бързо от чревния тракт след перорално приемане. При дневни дози между 10 mg и 40 mg фармакокинетиката на лекарственото вещество и активния метаболит е дозозависима. Приемът на храна може да повлияе резорбцията на loratadine дори до 40 %. Лекарството се метаболизира почти напълно в черния дроб главно чрез CYP 3A4 изоензим. В присъствие на инхибитори на тази система, loratadine може също така да бъде метаболизиран от CYP 2D6.

След екстензивен "first pass" метаболизъм в черния дроб, се получава активния метаболит descarboethoxyloratadine.

### РАЗПРЕДЕЛЕНИЕ

Общото свързване с плазмените протеини на loratadine се оценява на 97 - 99 %, докато за активния метаболит е 73 - 76% .

### ЕКСКРЕЦИЯ

Елиминационен полуживот: средно 8.4 часа (между 3 - 20 часа), а този на активния метаболит е 28 (8.8 - 92) часа.

24 часа след приемането на единична перорална доза, 27 % от дозата е екскретирана през бъбреците в конюгирана форма.

След 10 дневно лечение с loratadine, 40 % и 42 % от цялата приета доза се екскретират в урината и изпражненията респективно.

Loratadine и активният му метаболит преминават през плацентарната бариера и се екскретират в майчиното мляко.

**Пациенти в напреднала възраст:** Фармакокинетичните показатели при тях са подобни на тези при здрави възрастни.

**Хронична бъбречна недостатъчност:** Областта под кривата (AUC) и  $C_{max}$  стойностите са по-високи от тези при нормална бъбречна функция.

Елиминационният полуживот обаче не се различава значимо между двете групи пациенти. При хронична бъбречна недостатъчност хемодиализата не променя фармакокинетиката на loratadine и активния му метаболит.

**Хронична чернодробна недостатъчност:** При хронично алкохолно чернодробно увреждане AUC и плазменото ниво на loratadine се увеличават до два пъти. Фармакокинетиката на активния метаболит не се различава от тази при нормална чернодробна функция.

Степента на удължаване на елиминационният полуживот на loratadine и активния му метаболит може да бъде удължена в зависимост от степента на увреждането (24 и 37 часа респективно).



**Деца на възраст под 2 години:** Безопасността и ефективността на loratadine при тази възрастова група не са доказани (виж т. 4.3.).

### 5.3. Предклинични данни за безопасност

Токсичност при единична доза

Беше установено, че стойностите на LD<sub>50</sub> след перорален прием на loratadine при мишки и плъхове са по-големи от 5000 mg/kg. Единични перорални дози от 1280 mg/kg при маймуни бяха понесени добре.

Токсичност при последователни дози

При приложението на 2 – 240 mg/kg на ден в продължение на 12 месеца при плъхове и 0.4 - 90 mg/kg на ден за 17 месеца при маймуни се проявиха антихолинергични ефекти. И при двете групи животни беше наблюдавана фосфолипидоза, по-тежка при плъховете.

Не са наблюдавани карциногенни, мутагенни или тератогенни ефекти.

## 6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

### 6.1. Списък на помощните вещества

sodium benzoate  
sucrose (3 g/5 ml)  
propylene glycol  
glycerol  
citric acid, anhydrous  
aroma vanillin AB-710  
aroma strawberry 22754-00  
water, purified

### 6.2. Несъвместимости

Не са известни.

### 6.3. Срок на годност

2 години

Сиропът може да бъде използван 6 месеца след първоначалното отваряне на бутилката.

### 6.4. Специално предупреждение за съхранение

Да се съхранява под 25 °С. Да не се замразява.



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

Бутилка от кафяво стъкло с алуминиева капачка, осигурена срещу изтичане. Всяка бутилка съдържа 120 ml сироп. Една бутилка и мерителна лъжичка с вместимост 5 ml са поставени в картонена опаковка заедно с листовка за пациента.

#### **6.6. Препоръки при употреба (отпускане)**

Няма специални изисквания.

Режим на отпускане: Лекарствен продукт само по лекарско предписание.

#### **7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РЕГИСТРАЦИЯТА**

**EGIS PHARMACEUTICALS PLC**  
**1106 Budapest, Kereszturi ut 30-38.**  
**УНГАРИЯ**

#### **8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР**

2002 0676 / 01.08.2002

П-5830 / 01.08.2002

#### **9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТРЕБА**

Дата на първо разрешение за употреба: 01.08.2002 г.

#### **10. ДАТА НА ПРОВЕРКА НА ТЕКСТА**

Ноември, 2007 год.

