

**КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА**

20180012

BG/MH/MP-7028

05-01-2013

**1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ**

Еслотин 5 mg филмирани таблетки  
Eslotin 5 mg film-coated tablets

**2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ**

Всяка таблетка съдържа 5 mg деслоратадин (desloratadine).

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1

**3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА**

Филмирана таблетка

Сини, кръгли, двойноизпъкнали филмирани таблетки с делителна черта от едната страна, с дебелина  $3,40 \text{ mm} \pm 0,30 \text{ mm}$  и диаметър  $6,10 \text{ mm} \pm 0,10 \text{ mm}$ .

Делителната черта е само за улесняване на счупването с цел по-лесно поглъщане, а не за разделяне на равни дози.

**4. КЛИНИЧНИ ДАННИ****4.1 Терапевтични показания**

Еслотин е показан при възрастни и юноши на 12 и повече години за облекчаване на симптомите, свързани с:

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

**4.2 Дозировка и начин на приложение**Дозировка

*Възрастни и юноши (на 12 и повече години)*

Препоръчителната доза Еслотин е 1 таблетка веднъж дневно за облекчаване на симптоми, съпътстващи алергичния ринит, включително интермитентен и персистиращ алергичен ринит и уртикария.

Интермитентният алергичен ринит (наличие на симптоми за по-малко от 4 дни в седмицата или за по-кратко от 4 седмици) трябва да се лекува в съответствие с оценката на анамнезата на съответния пациент, като лечението трябва да бъде прекратено след изчезване на симптомите, а при рецидив да се възобнови.

При персистиращия алергичен ринит (наличие на симптоми за 4 или повече дни в седмицата или за повече от 4 седмици) в периода на експозиция на алергена, на пациентите трябва да бъде предложено продължително лечение.

Специални популации

*Пациенти с чернодробно увреждане*

Няма данни за приложението при пациенти с чернодробно увреждане.

*Пациенти с бъбречно увреждане*

Еслотин трябва да се прилага внимателно при пациенти с тежко бъбречно увреждане.



### Пациенти в старческа възраст

Ефикасността и безопасността при пациенти в старческа възраст все още не са установени.

### Педиатрична популация

Безопасността и ефикасността на Еслотин под формата на таблетки при деца под 12-годишна възраст все още не са установени.

### Начин на приложение

Перорално приложение.

Дозата може да се приема със или без храна.

## **4.3 Противопоказания**

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

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

Безопасността и ефикасността на Еслотин под формата на таблетки при деца под 12-годишна възраст все още не са установени.

Лекарственият продукт трябва да се прилага внимателно при пациенти с тежко бъбречно увреждане.

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.

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

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

В клинично фармакологично проучване на деслоратадин таблетки, приеман едновременно с алкохол, не е установено потенциране ефектите на алкохола, нарушаващи способността за работа (вж. точка 5.1).

Еслотин взаимодейства с перорално приемани контрацептивни средства. Поради това по време на лечението трябва да се прилага алтернативен ефикасен и безопасен метод за контрацепция.

### Педиатрична популация

Проучвания за взаимодействията са провеждани само при възрастни.

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

### Бременност

При изпитвания на деслоратадин върху животни не са установени данни за тератогенност. Няма данни за безопасността на лекарствения продукт по време на бременност. Потенциалният риск за хора е неизвестен (вж. точка 5.3). Поради това употребата на Еслотин по време на бременност не се препоръчва.

### Кърмене

Деслоратадин се екскретира в кърмата, поради което употребата на Еслотин не се препоръчва при кърмещи жени.



### Фертилитет

Липсват данни по отношение на мъжкия или женския фертилитет.

### Контрацепция

Еслотин взаимодейства с перорално приемани контрацептивни средства. Поради това по време на лечението трябва да се прилага алтернативен ефикасен и безопасен метод за контрацепция.

#### **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**

В клинични проучвания с различни показания, включително алергичен ринит и хронична идиопатична уртикария, при препоръчителната доза от 5 mg дневно, нежелани реакции с деслоратадин са съобщени при 3 % повече пациенти на лечение с деслоратадин, отколкото пациенти на лечение с плацебо. Най-честите нежелани реакции, които са били докладвани с по-голяма честота спрямо плацебо са били отпадналост (1,2 %), сухота в устата (0,8 %) и главоболие (0,6 %).

### Педиатрична популация

В клинично проучване с 578 пациенти на възраст между 12 и 17 години, най-честата нежелана реакция е била главоболие; това се е появило при 5,9 % от пациентите, лекувани с деслоратадин и 6,9 % от пациентите, лекувани с плацебо.

По-долу са описани нежеланите лекарствени реакции, съобщавани при приложение на деслоратадин, като са класифицирани съобразно честотата:

- 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 ( $< 1/10\ 000$ );
- С неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка).

### *Нарушения на нервната система*

**Чести:** Прострация

**Нечести:** Главоболие

### *Стомашно-чревни нарушения*

**Нечести:** Сухота в устата

### Постмаркетингов опит

Други нежелани ефекти, съобщавани много рядко по време на постмаркетинговия период, са изброени по-долу.

### *Психични нарушения*

**Много редки:** Халюцинации

**С неизвестна честота:** агресия

### *Нарушения на нервната система*

**Много редки:** Замаяност, сомнолентност, безсъние, психомоторна хиперактивност, гърчове



*Сърдечни нарушения*

**Много редки:** Тахикардия, палпитации

**С неизвестна честота:** удължаване на QT интервала

*Стомашно-чревни нарушения*

**Много редки:** Коремна болка, гадене, повръщане, диспепсия, диария

*Хепатобилиарни нарушения*

**Много редки:** Повишение на чернодробните ензими, повишен билирубин, хепатит

*Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан*

**Много редки:** Миалгия

*Общи нарушения:*

**Много редки:** Реакции на свръхчувствителност (като анафилаксия, ангиоедем, диспнея, пруритус, обрив и уртикария)

**С неизвестна честота:** фоточувствителност

*Нарушения на кожата и подкожната тъкан*

**С неизвестна честота:** отпадналост, астения

*Нарушения на метаболизма и храненето*

**С неизвестна честота:** увеличаване на апетита

*Изследвания*

**С неизвестна честота:** увеличаване на телото

Педиатрична популация

Други нежелани лекарствени реакции с неизвестна честота, съобщени по време на постмаркетинговия период при педиатрични пациенти, включват удължаване на QT интервала, аритмия и брадикардия, увеличаване на апетита, увеличаване на телото

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 **национална система за съобщаване**:

Изпълнителна агенция по лекарствата

ул. „Дамян Груев” № 8

1303 София

България

Тел.: +359 2 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.

*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.

*Лечение:*



При предозиране се препоръчват стандартните мерки за отстраняване на нерезорбираната активна съставка. Препоръчва се симптоматично и поддържащо лечение.

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

#### 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: Други антихистамини за системна употреба.  
АТС код: R06AX27

#### Механизъм на действие

Деслоратадин е продължително действащ хистаминов антагонист със селективна периферна H1-рецепторна антагонистична активност, без седативно действие. След перорално приложение, деслоратадин селективно блокира периферните хистаминови H1-рецептори, тъй като не прониква в централната нервна система.

Деслоратадин е показал антиалергични свойства в *in vitro* проучвания. Те включват инхибиране на освобождаването на проинфламаторни цитокини като IL-4, IL-6, IL-8 и IL-13 от човешките мастоцити/базофили, както и инхибиране на експресията на адхезионната молекула Р-селектин върху ендотелните клетки. Клиничното значение на тези наблюдения предстои да бъде потвърдено.

#### Клинична ефикасност и безопасност

В клинично проучване с многократно прилагане при възрастни и юноши, при което ежедневно, в продължение на 14 дни, е бил прилаган деслоратадин до 20 mg, не са наблюдавани статистически или клинично значими сърдечно-съдови ефекти. В едно клинично фармакологично проучване при възрастни и юноши, при което деслоратадин е бил прилаган на възрастни в доза 45 mg дневно (девет пъти по-висока от клиничната доза) в продължение на десет дни, не е наблюдавано удължаване на QTc-интервала.

В клинични проучвания за взаимодействия с многократно прилагане с кетоназол и еритромицин не са наблюдавани клинично значими промени в плазмените концентрации на деслоратадин.

Деслоратадин не преминава в централната нервна система. В контролирани клинични проучвания с препоръчителна доза от 5 mg дневно за възрастни и юноши не е бил установен по-висок брой случаи на сомнолентност в сравнение с плацебо. В клинични проучвания деслоратадин, прилаган като еднократна дневна доза от 7,5 mg при възрастни и юноши, не е повлиял на психомоторните характеристики. В едно проучване с еднократна доза, проведено при възрастни, деслоратадин 5 mg не е повлиял на стандартните показатели за поведение по време на полет, включително засилване на субективното усещане за сънливост или други дейности, свързани с полета.

В клинични фармакологични проучвания съвместното приложение с алкохол не е повишило честота на провокираните от алкохол нарушения в поведението, нито е засилило усещането за сънливост. Между групите пациенти на лечение с деслоратадин и плацебо, прилагани самостоятелно или с алкохол, не са били установени съществени различия в резултатите от психомоторните тестове.



При пациенти с алергичен ринит, деслоратадин е ефективен при облекчаване на симптоми като кихане, секреция от носа и сърбеж, както и сърбеж, сълзене и зачервяване на очите и сърбеж на небцето. Деслоратадин ефективно контролира симптомите в продължение на 24 часа.

#### Педиатрична популация

Ефикасността на деслоратадин не е категорично доказана в проучвания с юноши на 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 дни или повече седмично или в продължение на повече от 4 седмици.

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

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

В две плацебо-контролирани 6-седмични проучвания при пациенти с хронична идиопатична уртикария, ЕСЛОТИН е бил ефикасен в облекчаване на сърбежа и намаляване размера и броя на уртиките още в края на първия дозов интервал. Във всяко едно от проучванията, ефектът е бил поддържан през целия 24-часов дозов интервал. Както и в други проучвания 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 било наблюдавано при 55 % от пациентите на лечение с деслоратадин, в сравнение с 19 % от пациентите на лечение с плацебо. Лечението с деслоратадин е намалило значително нарушението на ритъма на сън и бодърстване, измерено по четиристепенна 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 се абсорбира добре с достигане на максимална концентрация след около 3 часа; терминалният полуживот е приблизително 27 часа. Степента на кумулиране на деслоратадин е в съответствие с неговия полуживот (приблизително 27 часа) и еднократния дневен прием. Бионаличността на деслоратадин е пропорционална на дозата в диапазона от 5 mg до 20 mg.

Във фармакокинетично проучване, при което демографският профил на пациентите е бил сравним с този на общата популация пациенти със сезонен алергичен ринит, при 4 % от пациентите е била 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-кратно по-висока приблизително на седмия час при терминален полуживот 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 mg до 20 mg) за 14 дни.

### Биотрансформация

Ензимът, отговорен за метаболизирането на деслоратадин, все още не е идентифициран и следователно някои взаимодействия с други лекарствени продукти не може да бъдат изключени напълно. Деслоратадин не инхибира CYP3A4 ин виво, а ин витро проучванията показват, че лекарственият продукт не инхибира CYP2D6 и не е субстрат, нито инхибитор на P-гликопротеин.

### 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 при пациенти с хронична бъбречна недостатъчност (ХБН) е сравнена с тази при здрави хора в едно проучване с еднократна доза и в едно проучване с многократно прилагане. При проучването с еднократно прилагане, експозицията на деслоратадин е била приблизително 2 и 2,5 пъти по-голяма при пациенти съответно с лека до умерена и тежка ХБН, в сравнение със здрави хора. При проучването с многократно прилагане експозицията е приблизително 1,5 пъти по-голяма при пациенти с лека до умерена ХБН и приблизително 2,5 пъти по-голяма при пациенти с тежка ХБН. И в двете проучвания промените в експозицията (AUC и  $C_{max}$ ) на деслоратадин и 3-хидроксидеслоратадин не са били клинично значими.

## **5.3 Предклинични данни за безопасност**

Деслоратадин е основният активен метаболит на лоратадин. Неклиничните проучвания 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 при деслоратадин не показват особен риск за хора на базата на конвенционалните фармакологични проучвания за безопасност, токсичност при многократно прилагане, генотоксичност, репродуктивна токсичност. Липсата на карциногенен потенциал е била демонстрирана в проучвания на деслоратадин и лоратадин.

## **6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ**

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

#### *Ядро на таблетката:*

Двуосновен калциев фосфат дихидрат  
Микрокристална целулоза  
Царевично нишесте  
Талк  
Магнезиев стеарат

#### *Обвивка на таблетката:*

Опадри синьо 85F20400  
Поливинилов алкохол  
Макрогол





Титанов диоксид (E171)  
Талк  
Индиго кармин алуминиев лак (E132)

## **6.2 Несъвместимости**

Неприложимо

## **6.3 Срок на годност**

3 години

## **6.4 Специални условия на съхранение**

Да се съхранява под 25 °С. Да се съхранява в оригиналната опаковка, за да се предпази влага.

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

Еслотин 5 mg филмирани таблетки са опаковани в Alu-PVC/Aclar блистери по 10 таблетки.

Видове опаковки:

Всяка картонена кутия съдържа 10, 20 или 30 таблетки и 1 листовка с информация за пациента.

Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати в продажба.

## **6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа**

Неизползваният лекарствен продукт или отпадъчните материали от него трябва да се изхвърлят в съответствие с местните изисквания.

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

ВОРЛД МЕДИСИНЕ ЕВРОПА ЕООД  
бул. Симеоновско шосе 130, ет. 3  
1700 София  
България

## **8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

Reg. №

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

Дата на първо разрешаване:

## **10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА**

11/2017

