

Signature

ЗБИРЕН ИЗВЕШТАЈ ЗА ОСОБИНИТЕ НА ЛЕКОТ

AEROGAL[®] / АЕРОГАЛ[®]

0,5 mg/1 ml

сируп

Назив,седиштие и адреса на производителот на лекоот:

Галеника а.д.Белград

„Бањајнички друм,,бб 11 080 Белград,Р.Србија

*Назив,седиштие и адреса на носителот на одобрението за ставање во
употреба:*

Галеника а.д. Претставништво, Скопје

Лермонтова бр.3/4-10, 1000 Скопје, Р.Македонија



Signature
мр. фарм. спец. Марија
Дарковска-Серафимовска

1.ИМЕ НА ЛЕКОТ , ИНТЕРНАЦИОНАЛНО НЕЗАШТИТЕНО ИМЕ НА ЛЕКОТ (INN)

AEROGAL®/АЕРОГАЛ®

0,5 mg/1 ml сируп

INN: desloratadinum

2.КВАЛИТАТИВЕН И КВАНТИТАТИВЕН СОСТАВ

1 ml сируп содржи 0,5 mg деслоратадин.

Помошни супстанции: 1ml сируп содржи сахароза 500mg; полиоксил 40 хидрогенизирано рицинуово масло 15,5 mg; натриум 1,92 mmol.

(Листата на помошни супстанции видете ја во точка 6.1)

3. ФАРМАЦЕВТСКИ ОБЛИК

Сируп.

Бистар, безбоен до светложолт раствор, со мирис на вишна.

4. КЛИНИЧКИ ПОДАТОЦИ

4.1.Терапевтски индикации

Деслоратадин се користи за ослободување од симптомите присутни кај следните заболувања:

- алергиски ринитис (види дел 5.1);
- уртикарија (види дел 5.1).

4.2.Дозирање и начин на примена

Деслоратадин сирупот се користи за ослободување од симптомите присутни кај алергиски ринитис (вклучувајќи интермитентен и перзистентен ринитис) и уртикарија (види дел 5.1). Сирупот може да се земе со оброк или независно од оброкот.

Мора да се земе во предвид дека кај деца помали од 2 години ринитисот е главно од инфективна природа (види дел 4.4) и дека нема податоци за ефикасноста на деслоратадин во терапијата на инфективен ринитис.

Деца на возраст од 1 до 5 години: 2,5 ml (1,25 mg) сируп еднаш дневно.

Деца на возраст од 6 до 11 години: 5 ml (2,5 mg) сируп еднаш дневно.

Возрасни и адолесценти (на возраст од 12 година и постари): 10 ml (5 mg) сируп еднаш дневно.

Постојат ограничени податоци од клиничките студии за ефикасноста на деслоратадин кај адолесценти на возраст од 12 до 17 година (види дел 4.8 и дел 5.1).

Интермитентен алергиски ринитис (присуство на симптоми пократки од 4 дена неделно или пократки од 4 недели) се лекува во согласност со историјата на болеста на пациентот.Терапијата треба да се прекине по престанокот на симптомите и да се започне повторно со лекувањето доколку симптомите повторно се појават. Перзистентниот алергиски ринитис (присуство на симптоми 4 или повеќе дена неделно и подолго од 4 недели) се лекува континуирано во период додека пациентот е изложен на алергенот.



4.3.Контраиндикации

Преосетливост на активната супстанција, било која од состојките на лекот или лоратадин.

4.4. Посебни предупредувања и мерки на претпазливост при употребата на лекот

Ефикасноста и безбедноста на деслоратадин сирупот кај деца на возраст под 1 година не е утврдена.

Кај деца помали од 2 години потешко се разликува алергискиот ринитис од другите форми на ринитис. За поставување на дијагноза значајно е одсуството на инфекции на горните респираторни патишта и структурна абнормалност, како и историјата на болеста на пациентот, физикални прегледи и лабораториски и кожни тестови.

Приближно 6% возрасни и деца од 2 до 11 години се фенотипски бавни метаболизатори на деслоратадин и пројавуваат поголема изложеност на лекот(види дел 5.2). Безбедноста на деслоратадин кај деца од 2 до 11 години кои се бавни метаболизатори е иста како и кај деца кои се нормални метаболизатори. Ефикасноста на деслоратадин кај деца помали од 2 години кои се бавни метаболизатори не е утврдена.

Деслоратадин треба да се применува со предпазливост кај болни со тешка ренална инсуфицијенција (види дел 5.2).

Деслоратадин сирупот во својот состав содржи сахароза (500 mg/1 ml). Пациенти кои боледуваат од ретко наследно заболување нетолеранција на фруктоза, лоша глукозно-галактозна апсорпција или сахарозно-изомалтазна инсуфицијенција, не смеат да го користат овој лек.

Може да се јават грчеви во стомакот и дијареа затоа што лекот содржи полиоксил 40 хидрогенизирано рицинуово масло.

Овој лек содржи 1,92 mmolа натриум на 1 ml сируп. Се советува особена претпазливост при употреба кај пациенти на контролирана натриумска диета.

4.5.Интеракција со други лекови и други врсти на интеракции

Во клиничките студии во кои деслоратадинот е применет истовремено со еритромицин или кетоконазол не се забележани клинички значајни интеракции(види дел 5.1).

Во клиничката студија во која деслоратадинот е применети истовремено со алкохол не е забележано потенцирање на негативни дејства на алкохолот (види дел 5.1).

4.6.Примена во периодо на бременост и доењето

Во студиите кај животни не е покажан тератоген потенцијал на деслоратадин. Безбедната употреба на овој лек кај трудници не е утврдена, па заради тоа неговата примена во текот на бременоста не се препорачува.

Деслоратадинот се излачува во мајчиното млеко, па заради тоа не се препорачува примена на лекот во текот на доењето.

4.7. Влијание на психофизичките способности при управување со моторно возило и машини

Во клиничките студии не е докажано влијанието на деслоратадин врз способноста на управување со моторно возило. Меѓутоа, пациентите мора да бидат информирани дека кај некои лица, многу ретко може да се појави зашеметеност која може да влијае врз способноста за управување со моторно возило.

4.8.Несакани дејства на лекот

Во клиничките студии кај педијатриската популација деслоратадин сирупот е применет кај вкупно 246 деца на возраст од 6 месеци до 11 години. Вкупната инциденца на

несакани реакции кај деца од 2 до 11 година била слична во групата која примала деслоратадин и во групата која примала плацебо. Кај доенчињата и децата од 6 до 23 месеци, најчесто забележани несакани реакции биле дијареа (3,7%), грозница (2,3%) и несоница (2,3%). Во една дополнителна студија, не се забележани несакани реакции кај деца на возраст од 6 до 11 години после примената на поединечни дози од 2,5 mg деслоратадин во облик на сируп.

Во клиничките студии спрема индикациите кои вклучуваат алергиски ринитис и хронична идиопатска уртикарија, во препорачаните дози кај возрасни и адолесценти, несаканите ефекти на деслоратадин се забележани кај 3% од пациентите во однос на оние кои добивале плацебо. Најчесто пријавувани несакани ефекти биле : замор (1,2 %), сува уста (0,8 %) и главоболка (0,6 %).

Останатите несакани реакции кои многу ретко се забележани во тек на постмаркетиншкото следење наброени се во табелата.

Психијатриски нарушувања	халуцинации
Нарушување кај нервниот систем	зашеметеност, поспаност, несоница, психомоторна хиперактивност, конвулзивни напади
Кардиоваскуларни нарушувања	тахикардија, палпитации
Гастроинтестинални нарушувања	болка во стомакот, мачнина, повраќање, нарушување при варење, дијареа
Хепатобилијарни нарушувања	зголемени вредности на ензимите од црниот дроб, зголемен билирубин, хепатитис
Нарушување на мускулно-скелетното, врзивно и коскено ткиво	болка во мускулите
Општи нарушувања и реакции на местото на примена	реакции на преосетливост (анафилактички шок, ангиоедем, диспнеа, чешање, исип и уртикарија)

4.9. Предозирање

Во случај на предозирање да се применат стандардните процедури за отстранување на нересорбираните активни супстанции.

Се препорачува примена на симптоматска и супортивна терапија.

Во клиничката студија на повторени дози кај возрасни и адолесценти немало клинички релевантни ефекти по примена на деслоратадин во дози од 45 mg, која е 9 пати повисока од препорачаната (девет клинички дози).

Деслоратадин не се елиминира со хемодијализа, ниту е познато дали се елиминира со перитонеална дијализа.

5. ФАРМАКОЛОШКИ ПОДАТОЦИ

5.1. Фармакодинамски податоци

Фармакотераписка група: Антихистаминици

H₁ антагонисти

АТЦ Код: R06AX27

Деслоратадин е неседирачки, долгоделувачки антагонист на хистаминските рецептори со селективно дејство на периферните H₁ рецептори. По оралната примена, деслоратадинот селективно ги блокира периферните H₁ рецептори и не делува на рецепторите кај централниот нервен систем.



Во ин витро студиите е докажана антиалергиската активност на деслоратадин која подразбира инхибиција на ослободувањето на проинфламаторните цитокини и IL-4, IL-6, IL-8, и IL-13 од хумани мастоцити/базофил, како и инхибиција на експресијата на адхезивната молекула Р-селектин на ендотелните клетки. Клиничкото значење на овие забелешки во иднина мора да се утврди.

Ефикасноста на деслоратадин сирупот не е испитувана во одвоени студии кај педијатриската популација. Безбедноста на деслоратадин сирупот, кој содржи иста концентрација на активна супстанца, е докажана во три студии во педијатриската популација. Деца од 1 до 11 година примиле деслоратадин од 1,25 mg (возраст од 1 до 5 година) или 2,5 mg (возраст од 6 до 11 година) дневно. Терапијата добро се поднесувала, што е и документирано со лабораториски тестови, со витални знаци и со ЕКГ, вклучувајќи и QTc интервал. Во препорачаните дози, концентрацијата на деслоратадин во плазмата е слична кај педијатријската и возрасната популација (види дел 5.2). Со оглед на тоа дека профилот на деслоратадин и терапијата на алергискиот ринитис / хронична идиопатска уртикарија се слични кај возрасни и деца, податоците за ефикасноста на деслоратадин кај возрасни може да се однесува и на педијатриската популација.

Во клиничката студија со повеќекратно дозирање кај возрасни и адолесценти, во која до 20 mg деслоратадин дневно е применувано во период од 14 дена, не се забележани статистички или клинички значајни кардиоваскуларни ефекти.

Во клиничката фармаколошка студија, во која деслоратадинот е применуван во дози од 45 mg дневно (9 клинички дози) во тек на 10 дена, не е забележано продолжување на QT интервалот.

Деслоратадин лесно не преминува во централниот нервен систем. Во контролираните клинички студии, по примената на препорачаната доза на лекот од 5 mg дневно кај возрасни и адолесценти, немало зголемена инциденца на појава на поспаност во споредба со плацебо. Во клиничките студии кај возрасни и адолесценти, деслоратадинот применет во поединечна доза од 7,5 mg не влијаел на психомоторните функции. Во студија на поединечни дози кај возрасни, покажано е дека 5 mg деслоратадин кај возрасни лица немало влијание на субјективните чувства на поспаност или доведувало до отежнато извршување на задачите во врска со летот.

Во клиничките фармаколошки студии кај возрасни, деслоратадинот применуван истовремено со алкохол не влијаел на намалување на психомоторните функции и појава на поспаност кои настануваат под влијание на алкохол. Резултатите на психомоторниот тест не покажуваат значајна разлика помеѓу деслоратадин и плацебо, ако лекот се применува сам или со алкохол.

Во студиите на интеракција не се докажани клинички значајни промени во концентрацијата на деслоратадин во плазмата по примена на повеќекратни дози на кетоназол и еритромицин.

Ефикасноста на деслоратадин сируп не е испитувана во клинички педијатријски студии кај деца помали од 12 година.

Кај возрасни пациенти и адолесценти со алергиски ринитис, деслоратадин таблетите се покажале ефикасни во ослободување од симптоми како што се кивање, секреција од носот, чешање, вклучувајќи и чешање на непцата и очите, солзење и црвенило на очите. Во текот на примената на деслоратадин овие симптоми се под контрола 24 часа. Ефикасноста на деслоратадин не е јасно покажана во студиите кај адолесценти на возраст од 12 до 17 година.

Заради воспоставување на класификација на сезонскиот и перинеалниот ринитис, алергискиот ринитис може алтернативно да се подели на интермитентен и перзистентен алергиски ринитис. Интермитентниот алергиски ринитис се карактеризира со присуство на симптоми пократки од 4 дена неделно или пократки од 4 недели. Перзистентниот алергиски ринитис се карактеризира со присуство на симптоми

4 или повеќе дена неделно и подолго од 4 недели.

Деслоратадин таблетите биле ефикасни во ублажувањето на тежината на сезонскиот алергиски ринитис, што покажуваат податоците од прашалникот за квалитетот на животот кај пациенти со рино-коњунктивални симптоми. Податоците од истиот прашалник укажуваат на најголемо подобрување во доменот на практични проблеми и дневни активности кои биле ограничени како последица на присуство на симптоми на алергиски ринитис.

Хроничната идиопатска уртикарија е проучувана како клинички модел на сите врсти уртикарија заради сличниот основен патогенетски механизам, без оглед на етиологијата, како и заради фактот дека хроничните пациенти полесно би се регрутирале за учество во студиите. Со оглед што ослободувањето на хистамини главниот причинител во сите облици на уртикарија, може да се очекува ефикасноста на деслоратадин во отстранување на симптомите кај хронични идиопатски уртикарии и во сите други врсти на уртикарија, што е и препорачано во клиничките водичи.

Во две плацебо контролирани студии кои траеле шест недели кај пациенти со хронична идиопатска уртикарија, деслоратадин бил ефикасен во ослободувањето од чешање, како и во намалувањето на големината и бројот на уртики до крајот на првиот дозен интервал. Во двете студии, ефектите на деслоратадин се одржувале во тек на дваесетчетворочасовен дозен интервал. Како и во други студии со антихистаминици во хронична идиопатска уртикарија, помал број на пациенти кои не реагирале на антихистаминиците бил исклучен од студиите. Намалување на чешањето за повеќе од 50% е забележано кај 55% од пациентите лекувани со деслоратадин во споредба со 19% од пациентите третирани со плацебо. Лекувањето со деслоратадин значајно ја намалила појавата на поспаност и попречување на дневните активности, што е покажано со четворостепенa скала за проценка на овие варијабли.

5.2. Фармакокинетички податоци

Деслоратадинот може да се детектира во плазмата 30 минути по примената. Добро се ресорбира и максималната концентрација на лекот во плазмата се достигнува приближно после 3 часа; завршната фаза на полувремена елиминација изнесува приближно 27 часа. Степенот на акумулација на деслоратадин е во согласност со полувремето на елиминација на лекот (приближно 27 часа) и со еднодневното дозирање. Биорасположивоста на деслоратадин е дозно зависна во распон од 5 до 20 mg.

Во низа фармакокинетички и клинички студии, кај 6% од испитаниците е достигната повисока концентрација на деслоратадин.

Преваленцата на овие бавни метаболизатори е слична кај возрасни (6%) и деца од 2 до 11 години (6%), и поголема е кај црната раса (18% возрасни, 16% деца) во однос на белата раса (2% возрасни, 3% деца) кај обете популации.

Во фармакокинетичката студија на повторени дози на деслоратадин во облик на таблети, кај здрави возрасни доброволци, 4 испитаници биле бавни метаболизатори на деслоратадин. Овие испитаници имале 3 пати поголем St_{max} кој се достигнува за приближно 7 часа; терминалната фаза на полувремето на елиминација на лекот изнесувала 89 часа.

Слични фармакокинетички резултати се добиени во фармакокинетичката студија на повторени дози на деслоратадин во облик на сируп кај деца на возраст од 2 до 11 години, кои се бавни метаболизатори на деслоратадин, со дијагноза алергиски ринитис. Кај овие испитаници, PK е поголем 6 пати, St_{max} е поголем и 3-4 пати и достигнува за 3-6 часа; завршната фаза на полувремето на елиминација на лекот изнесува приближно 120 часа. Изложеноста на лекот е иста кај возрасни и деца кои се бавни метаболизатори, кога се применуваат дози адекватни за возраста. Вкупниот безбедносен профил на лекот кај овие пациенти не се разликува во однос на општата

популација.Ефектите на деслоратадин кај бавните метаболизатори помали од 2 години, не се востановени.

Деслоратадин умерено се врзува за протеините на плазмата (83% - 87%). Нема податоци за клинички значајно таложење на лекот по еднодневната примена на деслоратадин (во дози од 5 mg до 20 mg) во тек на 14 дена.

Во вкрстена студија на поединечни дози, покажано е дека обете формулации на лекот, таблети и сируп деслоратадин, се биоеквивалентни.Бидејќи сирупот содржи иста концентрација на деслоратадин, не било неопходно да се спроведе студија за биоеквиваленција.

Во одвоени студии на поединечна доза, при употреба на препорачани дози, децата имаат слични вредности на PK и C_{max} како и возрасни кои примале 5 mg деслоратадин сируп.

Со оглед што ензимските системи одговорни за метаболизмот на деслоратадин не се сеуште идентификувани,клинички значајни интеракции со другите лекови не може потполно да се исклучат.Деслоратадин не инхибира CYP3A4 in vivo; in vitro студите покажале дека деслоратадин не инхибира CYP2D6 и дека не е супстрат ниту инхибитор на Р гликопротеинот.

Во студии на поединечни дози од 7,5 mg деслоратадин немало влијание на храната (висококалоричен доручек) на дистрибуција на лекот. Во друга студија покажано е дека сокот од грејпфрут не влијае на дистрибуцијата на деслоратадин.

5.3. Претклинички податоци за безбедноста на лекот

Деслоратадин е основен активен метаболит на лоратадин.Претклиничките студии спроведени со деслоратадин и лоратадин покажуваат дека нема квалитативни или квантитативни разлики во токсиколошкиот профил меѓу деслоратадин и лоратадин во еквивалентна доза во однос на деслоратадин.

Претклиничките податоци на основ на резултатите на конвенционалните студии на безбедност,токсичноста на повторуваните дози,генотоксичноста и студијата на репродуктивна токсичност, не укажуваат на постоење на зголемен ризик кај луѓето. Студите спроведени со деслоратадин и лоратадин покажале дека овие лекови немаат карциноген потенцијал.

6. ФАРМАЦЕВТСКИ ПОДАТОЦИ

6.1. Листа на ексципиенси

Содржина на помошните супстанции: полиоксил 40 хидрогенизирано рицинуово масло (Kremofor RH 40); пропиленгликол; натриум-цитрат; лимонска киселина безводна; сахароза; натриум бензоат (E211); арома на вишна (содржи пропиленгликол и 0,5-2,5%(V) етанол); пречистена вода.

6.2. Инкомпатибилност

Не е применливо.

6.3. Рок на употреба

3 години.

Лекот не смее да се користи по истекот на рокот на употреба означен на пакувањето!

6.4. Посебни мерки и предупредување при чувањето

Да се чува на температура до 30 °C, во оригинално пакување.

После првото отворање да се чува на темература до 25 °C во оригинално пакување, најдолго 24 дена.

6.5. Природа и содржина на контактната амбалажа

Аерогал®/Aerogal® е сируп, 5 mg/1 ml, вкупно 60 ml, спакуван во шише од 75 ml. Шишето е од кафеаво,неутрално стакло III хидролитичка група, со ребраст затворач и навој со бела боја,со сигурносен прстен од полиетилен со висока густина, и транспарентна влошка од полиетилен со ниска густина.

6.6. Посебни мерки за уништување на неупотребениот лек или остатоци од лекот
Неупотребениот лек се уништува во согласност со важечките прописи.

7. НОСИТЕЛ НА РЕШЕНИЕТО ЗА СТАВАЊЕ НА ЛЕК ВО ПРОМЕТ

Галеника а.д. Претставништво,Скопје,Лермонтова,, бр.3/4-10 1000
Скопје,Р.Македонија

8. БРОЈ НА ПРВАТА ДОЗВОЛА И ДАТУМ НА ПРВОТО РЕШЕНИЕ / ОБНОВА

9. ДАТУМ НА ПОСЛЕДНАТА РЕВИЗИЈА НА ТЕКСТОТ

