

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Desloratadine Lupin, 5 mg, tabletki powlekane

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Jedna tabletka zawiera 5 mg desloratadyny.

Substancja pomocnicza o znanym działaniu: laktoza bezwodna w ilości 10 mg na tabletkę.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletki powlekane.

Jasnoniebieskie, okrągłe, obustronnie wypukłe tabletki powlekane, gładkie po obu stronach.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Produkt leczniczy Desloratadine Lupin 5 mg tabletki powlekane jest wskazany do stosowania w celu łagodzenia objawów związanych z:

- uczuleniowym zapaleniem błony śluzowej nosa (patrz punkt 5.1),
- pokrzywką (patrz punkt 5.1).

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

Dorośli i młodzież (w wieku 12 lat i więcej): jedna tabletka na dobę, niezależnie od posiłku, w celu złagodzenia objawów związanych z uczuleniowym zapaleniem błony śluzowej nosa (w tym okresowym i przewlekłym uczuleniowym zapaleniem błony śluzowej nosa) oraz z pokrzywką (patrz punkt 5.1).

Okresowe uczuleniowe zapalenie błony śluzowej nosa (charakteryzujące się występowaniem objawów przez mniej niż 4 dni w tygodniu lub przez mniej niż 4 tygodnie) należy leczyć biorąc pod uwagę ocenę historii choroby pacjenta, leczenie należy przerywać po ustąpieniu objawów i wznowić po ich nawrocie.

W przewlekłym uczuleniowym zapaleniu błony śluzowej nosa (charakteryzującym się występowaniem objawów przez co najmniej 4 dni w tygodniu i przez ponad 4 tygodnie) można zaproponować pacjentowi ciągłe stosowanie leku w okresach narażenia na alergen.

Pacjenci z zaburzeniem czynności nerek

W przypadku ciężkiej niewydolności nerek tabletki te należy stosować z zachowaniem ostrożności (patrz punkt 5.2).

Dzieci i młodzież

Nie ustalono bezpieczeństwa stosowania ani skuteczności produktu leczniczego u dzieci w wieku poniżej 12 lat. Brak dostępnych danych.

Doświadczenie dotyczące klinicznego badania skuteczności stosowania desloratadyny u młodzieży w wieku od 12 do 17 lat jest ograniczone (patrz punkty 4.8 i 5.1). Aktualne dane przedstawiono w punktach 4.8 i 5.1.

Sposób podawania

Podanie doustne.

Tabletki należy połykać, popijając wystarczającą ilością płynu (np. szklanką wody).

4.3 Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na substancję czynną, na którąkolwiek substancję pomocniczą lub na loratadynę.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Nie ustalono skuteczności ani bezpieczeństwa stosowania tego produktu leczniczego u dzieci w wieku poniżej 12 lat.

W przypadku ciężkiej niewydolności nerek produkt leczniczy należy stosować z zachowaniem ostrożności (patrz punkt 5.2).

Pacjenci z rzadko występującymi zaburzeniami dziedzicznymi w postaci nietolerancji galaktozy, niedoboru laktazy typu Lapp lub zespołu złego wchłaniania glukozy i galaktozy nie powinni stosować tego produktu leczniczego.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

W badaniach klinicznych, w których desloratadynę w postaci tabletek podawano równocześnie z erytromycyną lub ketokonazolem, nie obserwowano istotnych klinicznie interakcji (patrz punkt 5.1).

W farmakologicznym badaniu klinicznym desloratadyna przyjmowana łącznie z alkoholem nie nasilała szkodliwego działania alkoholu (patrz punkt 5.1).

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

W badaniach na zwierzętach desloratadyna nie wykazywała działania teratogennego. Nie ustalono bezpieczeństwa stosowania produktu leczniczego w czasie ciąży. Dlatego nie zaleca się stosowania desloratadyny w czasie ciąży.

Desloratadyna przenika do mleka kobiecego, dlatego nie zaleca się stosowania tych tabletek u kobiet karmiących piersią.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

W badaniach klinicznych, w których oceniano zdolność prowadzenia pojazdów, nie stwierdzono upośledzenia tej zdolności u pacjentów otrzymujących desloratadynę. Pacjentów powinno się jednak informować, że w bardzo rzadkich przypadkach u niektórych osób może występować senność, która może wpływać na ich zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn.

4.8 Działania niepożądane

W badaniach klinicznych prowadzonych w zakresie wskazań obejmujących uczuleniowe zapalenie błony śluzowej nosa i przewlekłą pokrzywkę idiopatyczną, przy stosowaniu dawki zalecanej wynoszącej 5 mg na dobę, odnotowano wystąpienie działań niepożądanych u 3% pacjentów więcej niż u tych, którzy otrzymywali placebo. Najczęstszymi zdarzeniami niepożądanymi występującymi częściej u pacjentów przyjmujących desloratadynę niż u pacjentów przyjmujących placebo były: zmęczenie (1,2%), suchość w jamie ustnej (0,8%) i ból głowy (0,6%). W badaniu klinicznym z udziałem 578 nastoletnich pacjentów, w wieku od 12 do 17 lat, najczęstszym zdarzeniem niepożądanym był ból głowy, który występował u 5,9% pacjentów otrzymujących desloratadynę i 6,9% pacjentów otrzymujących placebo.

W tabeli poniżej wymieniono inne działania niepożądane zgłaszane bardzo rzadko w okresie po wprowadzeniu leku do obrotu.

Zaburzenia psychiczne	Omamy
Zaburzenia układu nerwowego	Zawroty głowy, senność, bezsenność, pobudzenie psychoruchowe, napady drgawek
Zaburzenia serca	Częstoskurcz, kołatanie serca
Zaburzenia żołądka i jelit	Ból brzucha, nudności, wymioty, dyspepsja, biegunka
Zaburzenia wątroby i dróg żółciowych	Zwiększona aktywność enzymów wątrobowych, zwiększone stężenie bilirubiny, zapalenie wątroby
Zaburzenia mięśniowo-szkieletowe i tkanki łącznej	Bóle mięśniowe
Zaburzenia ogólne	Reakcje nadwrażliwości (np. anafilaksja, obrzęk naczynioruchowy, duszność, świąd, wysypka i pokrzywka)

4.9 Przedawkowanie

Objawy

W badaniu klinicznym z zastosowaniem dawek wielokrotnych, w którym podawano desloratadynę w dawce sięgającej 45 mg (czyli w dawce wynoszącej dziesięciokrotność dawki leczniczej), nie stwierdzono klinicznie istotnych działań.

Leczenie

W przypadku przedawkowania należy rozważyć zastosowanie standardowego postępowania w celu usunięcia niewchłoniętej części substancji czynnej. Zaleca się leczenie objawowe i podtrzymujące podstawowe czynności życiowe.

Desloratadyna nie jest usuwana przez hemodializę; nie wiadomo, czy może być usuwana przez dializę otrzewnową.

5 WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: inne leki przeciwhistaminowe do stosowania ogólnego, kod ATC: R06A X27

Desloratadyna jest pozbawionym działania sedacyjnego, długo działającym antagonistą receptorów histaminowych, wykazującym wybiórczą antagonistyczną aktywność w stosunku do obwodowych receptorów histaminowych H_1 . Po podaniu doustnym desloratadyna wybiórczo blokuje obwodowe receptory histaminowe H_1 , gdyż substancja ta nie przenika do ośrodkowego układu nerwowego.

W badaniach *in vitro* wykazano właściwości przeciwwuczuleniowe desloratadyny. Właściwości te obejmują hamowanie uwalniania cytokin prozapalnych, np. IL-4, IL-6, IL-8 i IL-13 z ludzkich komórek tucznych / bazofilów, a także hamowanie ekspresji zaliczanej do cząsteczek adhezyjnych selektyny P na powierzchni komórek śródbłonna. Wymaga potwierdzenia, czy wymienione obserwacje mają jakiegokolwiek znaczenie kliniczne.

W badaniu klinicznym z zastosowaniem dawek wielokrotnych, w którym przez 14 dni podawano desloratadynę w dawce sięgającej 20 mg, nie stwierdzono żadnego statystycznie ani klinicznie istotnego wpływu na układ krążenia. W farmakologicznym badaniu klinicznym, w którym przez 10 dni desloratadynę podawano w dawce 45 mg na dobę (czyli w dawce wynoszącej dziewięciokrotność dawki leczniczej), nie stwierdzono wydłużenia odstępu QTc.

W badaniach interakcji po podaniu wielokrotnym ketokonazolu i erytromycyny nie obserwowano klinicznie istotnych zmian w stężeniu desloratadyny.

Desloratadyna nie przenika łatwo do ośrodkowego układu nerwowego. W kontrolowanych badaniach klinicznych, przy stosowaniu dawki zalecanej wynoszącej 5 mg na dobę, nie odnotowano większej częstości występowania senności w grupie otrzymującej desloratadynę niż w grupie placebo. Desloratadyna przyjęta w pojedynczej dobowej dawce 7,5 mg nie wpływała na sprawność psychoruchową w badaniach klinicznych. W badaniu z zastosowaniem dawki pojedynczej przeprowadzonym z udziałem osób dorosłych podanie desloratadyny w dawce 5 mg nie wpływało na standardowe parametry oceny sprawności pilotowania, w tym na nasilenie subiektywnego uczucia senności ani zadania związane z pilotowaniem.

W farmakologicznym badaniu klinicznym jednoczesne stosowanie desloratadyny i alkoholu nie nasilało wywoływanych przez alkohol zaburzeń czynności ani też nie nasilało senności. Nie stwierdzono znamiennych różnic w wynikach testów oceniających sprawność psychoruchową pomiędzy osobami otrzymującymi desloratadynę a osobami otrzymującymi placebo, niezależnie od tego, czy podawane były z alkoholem, czy bez alkoholu.

U pacjentów z uczuleniowym zapaleniem błony śluzowej nosa desloratadyna skutecznie łagodziła takie objawy, jak kichanie, wydzielina z nosa i świąd nosa, a także świąd oczu, łzawienie i zaczerwienienie oczu, a także świąd podniebienia. Desloratadyna zapewniała skuteczną kontrolę objawów przez 24 godziny. Skuteczności tabletek zawierających desloratadynę nie wykazano w sposób wyraźny w badaniach z udziałem nastoletnich pacjentów w wieku od 12 do 17 lat.

Oprócz ustalonego podziału na sezonowe i całoroczne, uczuleniowe zapalenie błony śluzowej nosa można – w zależności od czasu utrzymywania się objawów – podzielić na okresowe uczuleniowe zapalenie błony śluzowej nosa i przewlekłe uczuleniowe zapalenie błony śluzowej nosa. W okresowym uczuleniowym zapaleniu błony śluzowej nosa objawy utrzymują się mniej niż 4 dni w tygodniu lub przez mniej niż 4 tygodnie. W przewlekłym uczuleniowym zapaleniu błony śluzowej nosa objawy utrzymują się co najmniej 4 dni w tygodniu lub ponad 4 tygodnie.

Desloratadyna skutecznie łagodziła objawy sezonowego uczuleniowego zapalenia błony śluzowej nosa, o czym świadczyła łączna liczba punktów w kwestionariuszu oceny jakości życia w przypadku zapalenia błony śluzowej nosa i zapalenia spojówek. Największą poprawę obserwowano w domenach dotyczących praktycznych problemów i codziennych czynności ograniczanych przez występujące objawy.

Przeprowadzono badania z udziałem pacjentów z przewlekłą pokrzywką idiopatyczną, traktując ją jako model dla chorób pokrzywkowych, bowiem patofizjologia tych schorzeń jest podobna bez względu na etiologię, a chorzy przewlekłe są łatwiejsi do prospektywnego zrekrutowania. Ponieważ

we wszystkich schorzeniach pokrzywkowych czynnikiem przyczynowym jest uwalnianie histaminy, należy się spodziewać, że desloratadyna będzie skutecznie łagodziła objawy nie tylko w przewlekłej pokrzywce idiopatycznej, ale też w innych schorzeniach pokrzywkowych, zgodnie z wytycznymi klinicznymi.

W dwóch sześciotygodniowych badaniach kontrolowanych placebo u pacjentów z przewlekłą pokrzywką idiopatyczną desloratadyna skutecznie łagodziła świąd i zmniejszała rozległość i liczbę zmian pokrzywkowych pod koniec pierwszego odstępu pomiędzy kolejnymi dawkami. W każdym badaniu działanie utrzymywało się dłużej niż 24 godzinny odstęp między dawkami. Tak jak w przypadku innych badań leków przeciwhistaminowych u pacjentów z przewlekłą pokrzywką idiopatyczną, wykluczono niewielką grupę pacjentów, którzy nie reagują na leczenie przeciwhistaminowe. Zmniejszenie nasilenia świądu o ponad 50% stwierdzono u 55% pacjentów otrzymujących desloratadynę i u 19% pacjentów otrzymujących placebo. Desloratadyna znamienne zmniejszała też negatywny wpływ na sen i funkcjonowanie w ciągu dnia, mierzone w czteropunktowej skali stosowanej dla oceny tych zmiennych.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Desloratadyna jest wykrywalna w osoczu w ciągu 30 minut po podaniu. Desloratadyna dobrze się wchłania, osiągając stężenie maksymalne po około 3 godzinach, a okres półtrwania w końcowej fazie eliminacji wynosi około 27 godzin. Stopień kumulacji desloratadyny był odpowiedni do jej okresu półtrwania (wynoszącego około 27 godzin) i częstotliwości dawkowania wynoszącej raz na dobę. Dostępność biologiczna desloratadyny była proporcjonalna do podanej dawki w zakresie dawek od 5 mg do 20 mg.

W badaniu farmakokinetyki, w którym dane demograficzne pacjentów były porównywalne z danymi demograficznymi ogólnej populacji pacjentów cierpiących na sezonowy uczuleniowy zapalenie błony śluzowej nosa, u 4% pacjentów stwierdzano większe stężenia desloratadyny. Odsetek ten może być różny w zależności od pochodzenia etnicznego pacjentów. Maksymalne stężenie desloratadyny było około 3 razy większe po około 7 godzinach, a okres półtrwania w końcowej fazie eliminacji wynosił około 89 godzin. Profil bezpieczeństwa stwierdzany u tych pacjentów nie różnił się od profilu bezpieczeństwa w populacji ogólnej.

Desloratadyna w stopniu umiarkowanym wiąże się z białkami osocza (83-87%). Brak dowodów na istotną klinicznie kumulację leku przy stosowaniu desloratadyny (w zakresie dawek od 5 mg do 20 mg) przez 14 dni z częstotliwością raz na dobę.

Nie zidentyfikowano dotychczas enzymu odpowiedzialnego za metabolizm desloratadyny, dlatego nie można całkowicie wykluczyć pewnych interakcji z innymi produktami leczniczymi. Desloratadyna nie hamuje CYP3A4 w warunkach *in vivo*, a badania *in vitro* wykazały, że produkt leczniczy nie hamuje też CYP2D6 oraz że nie jest on ani substratem, ani inhibitorem glikoproteiny P.

W badaniu po pojedynczym podaniu dawki 7,5 mg desloratadyny, nie stwierdzono wpływu pokarmu (wysokotłuszczowe, wysokokaloryczne śniadanie) na farmakokinetykę desloratadyny. W innym badaniu stwierdzono, że sok grejpfrutowy nie wpływa na farmakokinetykę desloratadyny.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Desloratadyna jest głównym czynnym metabolitem loratadyny. W badaniach nieklinicznych z zastosowaniem desloratadyny i loratadyny wykazano brak różnic jakościowych i ilościowych w profilu toksyczności obu leków przy porównywalnych poziomach ekspozycji na desloratadynę. Dane niekliniczne wynikające z konwencjonalnych badań farmakologicznych dotyczących bezpieczeństwa, badań toksyczności po podaniu wielokrotnym, genotoksyczności oraz toksycznego wpływu na rozród nie ujawniają szczególnego zagrożenia dla człowieka. W badaniach z desloratadyną i loratadyną wykazano brak działania rakotwórczego.

6 DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Rdzeń tabletki

Skrobia żelowana
Celuloza mikrokryształiczna
Laktoza bezwodna
Hypromeloza
Olej roślinny uwodorniony
Krzemionka koloidalna bezwodna

Otoczka tabletki

Hypromeloza 6 cP
Tytanu dwutlenek (E 171)
Makrogol 400
Indygotyna (E 132)

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy

6.3 Okres ważności

2 lata

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Tabletki pakowane są w blistry PVC/Aclar/PVDC/Aluminium. Blistry pakowane są w pudełka tekturowe.

Tabletki dostępne są w opakowaniach po: 1, 2, 3, 5, 6, 7, 10, 12, 14, 15, 18, 20, 21, 30, 50, 60, 90, 100 tabletek.

Nie wszystkie wielkości opakowań muszą znajdować się w obrocie.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania

Brak szczególnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Lupin (Europe) Limited
Suite 1
Victoria Court
Bexton Road
Knutsford
Cheshire WA16 0PF
Wielka Brytania

8. NUMER(-Y) POZWOLENIA(Ń) NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

20887

**9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU
/ DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA**

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu:

2013.01.15

**10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU
CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO**

2013.01.15.