

**ANEKS I**  
**CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO**

## **1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO**

Aerius 5 mg, tabletki powlekane

## **2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY**

Każda tabletkę zawiera 5 mg desloratadyny.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

## **3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA**

Tabletkę powlekane

## **4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE**

### **4.1 Wskazania do stosowania**

Preparat Aerius wskazany jest w celu łagodzenia objawów związanych z:

- alergicznym zapaleniem błony śluzowej nosa (patrz punkt 5.1),
- przewlekłą pokrzywką idiopatyczną.

### **4.2 Dawkowanie i sposób podawania**

Dorośli i młodzież (w wieku 12 lat i więcej): w celu łagodzenia objawów związanych z alergicznym zapaleniem błony śluzowej nosa (w tym okresowym i przewlekłym alergicznym zapaleniem błony śluzowej nosa) i przewlekłą pokrzywką idiopatyczną jedna tabletkę raz na dobę, niezależnie od posiłku (patrz punkt 5.1).

Okresowe alergiczne zapalenie błony śluzowej nosa (objawy występują krócej niż 4 dni w tygodniu lub krócej niż przez 4 tygodnie) należy leczyć biorąc pod uwagę ocenę historii choroby pacjenta. Leczenie należy zaprzestać po ustąpieniu objawów i wznowić w momencie ich ponownego wystąpienia.

W przewlekłym alergicznym zapaleniu błony śluzowej nosa (objawy występują przez 4 dni w tygodniu lub więcej i przez dłużej niż 4 tygodnie) można zalecić pacjentowi kontynuowanie leczenia w okresie narażenia na alergen.

### **4.3 Przeciwwskazania**

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

### **4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania**

Skuteczność i bezpieczeństwo preparatu Aerius tabletkę u dzieci poniżej 12 lat nie zostało ustalone.

Preparat Aerius należy stosować ostrożnie w przypadku ciężkiej niewydolności nerek (patrz punkt 5.2).

Pacjenci z rzadko występującą dziedziczną nietolerancją galaktozy, niedoborem laktazy typu Lapp lub zespołem złego wchłaniania glukozy-galaktozy nie powinni przyjmować tego preparatu.

#### 4.5 Interakcje z innymi lekami i inne rodzaje interakcji

W badaniach klinicznych, w których równocześnie z desloratadyną w postaci tabletek podawano erytromycynę lub ketokonazol, nie obserwowano klinicznie istotnych interakcji (patrz punkt 5.1).

W farmakologicznych badaniach klinicznych preparat Aeries przyjmowany jednocześnie z alkoholem nie nasilał szkodliwego działania alkoholu (patrz punkt 5.1).

#### 4.6 Cięża i laktacja

W badaniach na zwierzętach desloratadyna nie miała działania teratogennego. Nie ustalono bezpieczeństwa stosowania preparatu w czasie ciąży. Z tego względu nie zaleca się stosowania preparatu Aeries w czasie ciąży.

Desloratadyna jest wydzielana do mleka matki, dlatego nie zaleca się stosowania preparatu Aeries u kobiet karmiących piersią.

#### 4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu

W badaniach klinicznych, w których oceniano zdolność do prowadzenia pojazdów mechanicznych, u pacjentów otrzymujących desloratadynę nie występowało zaburzenie tej czynności. Jednakże pacjentów należy poinformować, że bardzo rzadko, u niektórych osób, występuje senność, która może wpływać na ich zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych lub obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu.

#### 4.8 Działania niepożądane

W badaniach klinicznych, w zakresie badanych wskazań, w tym w alergicznym zapaleniu błony śluzowej nosa i w przewlekłej pokrzywce idiopatycznej, po podaniu preparatu Aeries w zalecanej dawce 5 mg na dobę, działania niepożądane wystąpiły u 3 % pacjentów więcej niż u tych, którzy otrzymywali placebo. Najczęstszymi działaniami niepożądanymi, występującymi częściej niż w grupie placebo, były: uczucie zmęczenia (1,2 %), suchość w ustach (0,8 %) i bóle głowy (0,6 %). Inne działania niepożądane obserwowane bardzo rzadko po wprowadzeniu leku na rynek, wymieniono w poniższej tabeli.

<b>Zaburzenia psychiczne</b>	Omamy
<b>Zaburzenia układu nerwowego</b>	Zawroty głowy, senność, bezsenność, pobudzenie psychoruchowe, drgawki
<b>Zaburzenia serca</b>	Tachykardia, kołatanie serca
<b>Zaburzenia żołądkowo – jelitowe</b>	Bóle brzucha, nudności, wymioty, niestrawność, biegunka
<b>Zaburzenia wątroby i dróg żółciowych</b>	Zwiększenie aktywności enzymów wątrobowych, zwiększenie stężenia bilirubiny, zapalenie wątroby
<b>Zaburzenia mięśniowo-szkieletowe, tkanki łącznej i kości</b>	Ból mięśni
<b>Zaburzenia ogólne</b>	Reakcje nadwrażliwości (takie jak: anafilaksja, obrzęk naczynioruchowy, duszność, świąd, wysypka i pokrzywka)

## 4.9 Przedawkowanie

W przypadku przedawkowania należy rozważyć zastosowanie standardowego postępowania mającego na celu usunięcie nie wchłoniętej substancji czynnej. Zaleca się leczenie objawowe i podtrzymujące.

Na podstawie badań klinicznych, z zastosowaniem zwielokrotnionej dawki, w których podawano do 45 mg desloratadyny (dawka 9 razy większa od dawki leczniczej), nie stwierdzono klinicznie istotnych działań.

Desloratadyna nie jest wydalana na drodze hemodializy. Nie wiadomo, czy jest ona wydalana drogą dializy otrzewnowej.

## 5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

### 5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: leki przeciwhistaminowe – antagoniści receptora H<sub>1</sub>, kod ATC: R06A X27

Desloratadyna jest pozbawionym działania uspokajającego, długo działającym antagonistą histaminy, wykazującym selektywną antagonistyczną aktywność wobec obwodowych receptorów H<sub>1</sub>. Po podaniu doustnym desloratadyna selektywnie hamuje obwodowe receptory histaminowe H<sub>1</sub>, ponieważ nie przenika do ośrodkowego układu nerwowego.

Badania *in vitro* wykazały przeciwalergiczne właściwości desloratadyny. Obejmują one hamowanie uwalniania z ludzkich komórek tucznych/ leukocytów zasadochłonnych cytokin indukujących proces zapalny, takich jak IL-4, IL-6, IL-8 i IL-13, jak również hamowanie ekspresji adhezyjnej cząsteczki selektyny P na powierzchni komórek śródbłonna. Kliniczne znaczenie tych obserwacji nie zostało jeszcze potwierdzone.

W badaniach klinicznych z zastosowaniem zwielokrotnionej dawki, w których podawano do 20 mg desloratadyny na dobę przez 14 dni, nie zaobserwowano statystycznie lub klinicznie istotnego wpływu na układ krążenia. W farmakologicznych badaniach klinicznych, w których desloratadynę podawano w dawce 45 mg na dobę (dawka 9 razy większa od dawki leczniczej) przez 10 dni, nie odnotowano 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 po podaniu zalecanej dawki 5 mg na dobę, objawy senności występowały w stopniu nie większym niż w grupie placebo. W badaniach klinicznych preparat Aeries podawany w dawce 7,5 mg jeden raz na dobę nie wpływał na aktywność psychomotoryczną.

Przeprowadzone u dorosłych badania z zastosowaniem pojedynczej dawki wskazują, że desloratadyna w dawce 5 mg nie wpływa na podstawowe umiejętności pilotowania, w tym na nasilenie subiektywnie odczuwanej senności lub zadań związanych z pilotowaniem.

W farmakologicznych badaniach klinicznych jednoczesne podawanie desloratadyny z alkoholem nie nasilało zaburzeń czynności wywoływanych przez alkohol ani nie zwiększało senności. Nie odnotowano istotnych różnic w testach aktywności psychomotorycznej pomiędzy grupami otrzymującymi desloratadynę i placebo, niezależnie od tego, czy podawane były z alkoholem, czy bez alkoholu.

U chorych z alergicznym zapaleniem błony śluzowej nosa preparat Aeries skutecznie łagodził takie objawy, jak kichanie, świąd i wydzielina z nosa, a także świąd, łzawienie i zaczerwienienie oczu oraz

świąd podniebienia. Aerius skutecznie łagodził objawy przez 24 godziny. Skuteczność u pacjentów w wieku 12 – 17 lat nie została w pełni ustalona.

Oprócz ustalonego podziału na sezonowe i całoroczne, alergiczne zapalenie błony śluzowej nosa można podzielić, w zależności od czasu trwania objawów, na okresowe alergiczne zapalenie błony śluzowej nosa i przewlekłe alergiczne zapalenie błony śluzowej nosa. O okresowym alergicznym zapaleniu błony śluzowej nosa mówimy, gdy objawy występują krócej niż 4 dni w tygodniu lub krócej niż przez 4 tygodnie. O przewlekłym alergicznym zapaleniu błony śluzowej nosa mówimy, gdy objawy występują przez 4 dni w tygodniu lub więcej i przez dłużej niż 4 tygodnie.

Preparat Aerius był skuteczny w łagodzeniu objawów sezonowego alergicznego zapalenia błony śluzowej nosa, co wykazano na podstawie kwestionariusza oceniającego jakość życia w przypadku zapalenia błony śluzowej nosa i spojówek. Największą poprawę obserwowano w zakresie realnych problemów i codziennej aktywności ograniczanych przez objawy.

W dwóch, kontrolowanych placebo, trwających sześć tygodni badaniach, obejmujących pacjentów z przewlekłą pokrzywką idiopatyczną, preparat Aerius skutecznie łagodził świąd oraz zmniejszał rozmiar i liczbę zmian pokrzywkowych, zanim podano drugą dawkę. 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. Ponad 50 % poprawę w odniesieniu do występującego świądu, obserwowano u 55 % pacjentów leczonych desloratadyną w porównaniu do 19 % pacjentów, którym podawano placebo. Leczenie preparatem Aerius także znacznie zmniejszyło wpływ na sen i funkcjonowanie w ciągu dnia, mierzone w czteropunktowej skali stosowanej dla oceny tych zmiennych.

## **5.2 Właściwości farmakokinetyczne**

Stężenia desloratadyny w osoczu można oznaczyć w ciągu 30 minut po podaniu. Desloratadyna wchłania się dobrze, a maksymalne stężenie osiągnęte jest po około 3 godzinach. Okres półtrwania w fazie eliminacji wynosi około 27 godzin. Stopień kumulacji desloratadyny był odpowiedni do jej okresu półtrwania (około 27 godzin) i częstości podawania - raz na dobę. Biodostępność desloratadyny była proporcjonalna do dawki w zakresie 5 mg – 20 mg.

W badaniach farmakokinetycznych, w których dane demograficzne pacjentów były porównywalne do danych populacji ogólnej pacjentów z sezonowym alergicznym zapaleniem błony śluzowej nosa, u 4 % uczestników uzyskano większe stężenie desloratadyny. Odsetek ten może się zmieniać w zależności od pochodzenia etnicznego. Największe stężenie desloratadyny było około 3 razy większe po około 7 godzinach, a okres półtrwania w fazie eliminacji wynosił 89 godzin. Profil bezpieczeństwa u tych pacjentów nie różnił się od populacji ogólnej.

Desloratadyna umiarkowanie wiąże się z białkami osocza (83 % - 87 %). Brak dowodów na klinicznie istotną kumulację desloratadyny podawanej raz na dobę (dawki 5 mg do 20 mg) przez 14 dni.

Nie zidentyfikowano jeszcze enzymu odpowiedzialnego za metabolizm desloratadyny, w związku z czym nie można wykluczyć interakcji z innymi lekami. Desloratadyna nie hamuje CYP 3A4 *in vivo*, a przeprowadzone badania *in vitro* wskazują, że lek nie hamuje CYP2D6 i nie jest ani substratem, ani inhibitorem P-glikoprotein.

W badaniu po pojedynczym podaniu dawki 7,5 mg desloratadyny, nie stwierdzono wpływu pokarmu na dystrybucję leku (wysokotłuszczowe, wysokokaloryczne śniadanie). W innych badaniach nie stwierdzono wpływu soku grejpfrutowego na dystrybucję desloratadyny.

### **5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie**

Desloratadyna jest głównym czynnym metabolitem loratadyny. Badania niekliniczne z zastosowaniem desloratadyny i loratadyny wykazały brak ilościowych i jakościowych różnic w profilu toksyczności desloratadyny i loratadyny przy porównywalnych poziomach narażenia na desloratadynę.

Dane niekliniczne na temat desloratadyny, uzyskane na podstawie konwencjonalnych badań farmakologicznych dotyczących bezpieczeństwa stosowania, toksyczności po podaniu wielokrotnym, genotoksyczności i toksycznego wpływu na reprodukcję, nie ujawniają występowania szczególnego zagrożenia dla człowieka. Nie wykazano działania rakotwórczego w badaniach z loratadyną.

## **6. DANE FARMACEUTYCZNE**

### **6.1 Wykaz substancji pomocniczych**

Rdzeń tabletki: wodorofosforan wapnia dwuwodny, celuloza mikrokrystaliczna, skrobia kukurydziana, talk.

Otoczka: otoczka membranowa (zawierająca laktozę jednowodną, hypromelozę, dwutlenek tytanu, makrogol 400, indygotynę (E132)), otoczka bezbarwna (zawierająca hypromelozę, makrogol 400) wosk Karnauba, wosk biały.

### **6.2 Niezgodności farmaceutyczne**

Nie dotyczy.

### **6.3 Okres trwałości**

2 lata

### **6.4 Specjalne środki ostrożności przy przechowywaniu**

Przechowywać w temperaturze poniżej 30°C.

Przechowywać w oryginalnym opakowaniu.

### **6.5 Rodzaj i zawartość opakowania**

Preparat Aerijs dostępny jest w blistrach. Blistry składają się z warstwy laminowanej oraz folii pokrywającej. Tworzywo blistra składa się z folii polichlorotrifluoroetylen (PCTFE)/chlorek poliwinylowy (PVC, powierzchnia kontaktu z lekiem) i folii aluminiowej pokrywającej, powlekaną zgrzewaną warstwą winylową (powierzchnia kontaktu z lekiem), które są zgrzewane.

Opakowania zawierają: 1, 2, 3, 5, 7, 10, 14, 15, 20, 21, 30, 50, 90, 100 tabletek.

Nie wszystkie rodzaje opakowań muszą znajdować się w obrocie.

### **6.6 Szczególne środki ostrożności dotyczące usuwania**

Brak szczególnych wymagań.

## **7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU**

SP Europe  
Rue de Stalle 73  
B-1180 Bruxelles  
Belgia

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

EU/1/00/160/001-013

EU/1/00/160/036

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

Data wydania pierwszego pozwolenia: 15 styczeń 2001

Data przedłużenia pozwolenia: 15 styczeń 2006

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

Szczegółowa informacja o tym produkcie jest dostępna na stronie internetowej Europejskiej Agencji ds. Produktów Leczniczych (EMA) <http://www.emea.eu.int/>