

## CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

### 1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Desalergo, 5 mg, tabletki ulegające rozpadowi w jamie ustnej

### 2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Każda tabletkę ulegającą rozpadowi w jamie ustnej zawiera 5 mg desloratadyny.

Substancje pomocnicze o znanym działaniu:

1 tabletkę ulegającą rozpadowi w jamie ustnej zawiera 3 mg aspartamu oraz 133,5 mg mannitolu. Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

### 3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletkę ulegającą rozpadowi w jamie ustnej.

Ceglastoczerwone, płaskie, okrągłe tabletki, ze ściętymi krawędziami, z wytłoczeniem „5” na jednej stronie.

### 4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

#### 4.1 Wskazania do stosowania

Produkt Desalergo jest wskazany w celu łagodzenia objawów związanych z:

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

#### 4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dorośli i młodzież (w wieku 12 lat i więcej):

jedną 5 mg tabletkę ulegającą rozpadowi w jamie ustnej produktu Desalergo umieścić w jamie ustnej raz na dobę.

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 przerwać po ustąpieniu objawów i wznowić w momencie ich ponownego wystąpienia. W przewlekłym alergicznym zapaleniu błony śluzowej nosa (objawy występują przez 4 lub więcej dni w tygodniu i dłużej niż 4 tygodnie) można zalecić pacjentowi kontynuowanie leczenia w okresie narażenia na alergen.

Nie ma wystarczających danych dotyczących skuteczności desloratadyny u młodzieży w wieku od 12 do 17 lat (patrz punkty 4.8 i 5.1).

Nie określono bezpieczeństwa stosowania ani skuteczności desloratadyny w postaci tabletek ulegających rozpadowi w jamie ustnej 5 mg u dzieci w wieku poniżej 12 lat. Nie dostępnych danych.

#### Sposób podawania:

Podanie doustne.

Produkt można przyjmować z posiłkiem lub bez posiłku.

Blister należy ostrożnie rozzerwać bezpośrednio przed użyciem i wyjąć bez kruszenia tabletkę ulegającą rozpadowi w jamie ustnej.

Tabletkę ulegającą rozpadowi w jamie ustnej umieszcza się w jamie ustnej, gdzie ulega ona natychmiastowemu rozpadowi.

#### **4.3 Przeciwwskazania**

Nadwrażliwość na substancję czynną lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1, lub na loratadynę.

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

Nie określono skuteczności i bezpieczeństwa stosowania produktu Desalergo 5 mg tabletki ulegające rozpadowi w jamie ustnej u dzieci w wieku poniżej 12 lat.

Produkt Desalergo należy stosować ostrożnie w ciężkiej niewydolności nerek.

Produkt Desalergo zawiera aspartam, źródło fenyloalaniny. Może być szkodliwy dla pacjentów z fenyloketonurią. Jedna tabletka ulegająca rozpadowi w jamie ustnej Desalergo 5 mg zawiera 3 mg aspartamu (co odpowiada 1,68 mg fenyloalaniny).

#### **4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji**

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

W farmakologicznym badaniu klinicznym wykazano, że desloratadyna w postaci tabletek przyjmowana jednocześnie z alkoholem nie nasilała działania alkoholu zaburzającego sprawność psychofizyczną (patrz punkt 5.1).

Dotychczas nie zidentyfikowano enzymu odpowiedzialnego za metabolizm desloratadyny, dlatego nie można wykluczyć interakcji z innymi lekami. Desloratadyna nie hamuje CYP 3A4 *in vivo*, a przeprowadzone badania *in vitro* wykazały, że lek nie hamuje CYP 2D6 i nie jest ani substratem, ani inhibitorem glikoproteiny P.

#### **4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację**

##### Ciąża

Brak danych lub istnieją tylko ograniczone dane (mniej niż 300 kobiet w ciąży) dotyczące stosowania desloratadyny u kobiet w ciąży. Badania na zwierzętach nie wykazały bezpośredniego lub pośredniego szkodliwego wpływu na reprodukcję (patrz punkt 5.3).

W celu zachowania ostrożności zaleca się unikanie stosowania produktu leczniczego Desalergo w okresie ciąży.

##### Karmienie piersią

Desloratadyna została wykryta w organizmie noworodków/dzieci karmionych piersią przez kobiety, które przyjmowały lek. Wpływ desloratadyny na organizm noworodków/dzieci jest nieznany. Należy podjąć decyzję, czy przerwać karmienie piersią, czy przerwać podawanie produktu Desalergo biorąc pod uwagę korzyści z karmienia piersią dla dziecka i korzyści z leczenia dla matki.

##### Płodność

Brak dostępnych danych dotyczących wpływu na płodność u kobiet i mężczyzn.

#### **4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn**

Na podstawie wyników badań klinicznych wykazano, że desloratadyna nie ma wpływu lub wywiera nieistotny wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn. Pacjentów należy poinformować, że u większości osób nie występuje senność. Jednak ze względu na indywidualne różnice

w reakcji poszczególnych osób na wszystkie produkty lecznicze, zaleca się poinformowanie pacjentów, aby powstrzymali się od wykonywania czynności wymagających koncentracji uwagi, takich jak prowadzenie pojazdów lub obsługiwane maszyn do czasu ustalenia, w jaki sposób reagują na ten produkt leczniczy.

#### 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 produktu zawierającego desloratadynę w postaci tabletek 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 jamie ustnej (0,8%) i bóle głowy (0,6%). W badaniu klinicznym z udziałem młodzieży w wieku od 12 do 17 lat najczęściej występującym działaniem niepożądanym był ból głowy, który wystąpił u 5,9% pacjentów przyjmujących desloratadynę i u 6,9% pacjentów przyjmujących placebo.

##### Tabelaryczny wykaz działań niepożądanych

Inne działania niepożądane obserwowane bardzo rzadko po wprowadzeniu desloratadyny do obrotu, wymieniono w poniższej tabeli. Częstości występowania określono jako: bardzo często ( $\geq 1/10$ ); często ( $\geq 1/100$  do  $< 1/10$ ); niezbyt często ( $\geq 1/1000$  do  $< 1/100$ ); rzadko ( $\geq 1/10\ 000$  do  $< 1/1000$ ) oraz bardzo rzadko ( $< 1/10\ 000$ ).

<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 żołądka i jelit</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 i tkanki łącznej</b>	ból mięśni
<b>Zaburzenia ogólne</b>	reakcje nadwrażliwości (takie jak: anafilaksja, obrzęk naczynioruchowy, duszność, świąd, wysypka i pokrzywka)

##### Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych

Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych, Aleje Jerozolimskie 181C, 02-222 Warszawa, tel.: + 48 22 49 21 301, faks: + 48 22 49 21 309, e-mail: [ndl@urpl.gov.pl](mailto:ndl@urpl.gov.pl).

#### 4.9 Przedawkowanie

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

W badaniu klinicznym z zastosowaniem zwielokrotnionej dawki, w którym podawano do 45 mg desloratadyny (dawka 9 razy większa od dawki leczniczej), nie stwierdzono klinicznie istotnych działań.

Desloratadyna nie jest wydalana podczas hemodializy. Nie wiadomo, czy jest ona wydalana podczas dializy otrzewnowej.

## 5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

### 5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: leki przeciwhistaminowe - antagoniści receptora H<sub>1</sub>,  
Kod ATC: R06AX27

#### Mechanizm działania

Desloratadyna jest pozbawionym działania uspokajającego, długo działającym antagonistą histaminy wykazującym selektywną antagonistyczną aktywność w stosunku do 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 i granulocytów zasadochłonnych cytokin indukujących reakcję zapalną, 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.

#### Skuteczność kliniczna i bezpieczeństwo stosowania

W przeprowadzonym badaniu klinicznym z zastosowaniem dawki wielokrotnej desloratadyna przyjmowana w postaci tabletek ulegających rozpadowi w jamie ustnej była dobrze tolerowana.

W badaniu klinicznym z zastosowaniem zwielokrotnionej dawki, w którym podawano do 20 mg desloratadyny na dobę przez 14 dni, nie zaobserwowano statystycznie lub klinicznie istotnego wpływu na układ krążenia. W farmakologicznym badaniu klinicznym, w którym 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 wielokrotnym podaniu ketokonazolu i erytromycyny nie obserwowano klinicznie istotnych zmian stężenia desloratadyny w osoczu.

Desloratadyna nie przenika łatwo do ośrodkowego układu nerwowego. W kontrolowanych badaniach klinicznych po podaniu zalecanej dawki 5 mg na dobę, senność występowała nie częściej niż po podaniu placebo. W badaniach klinicznych desloratadyna w postaci tabletek podawana w dawce 7,5 mg raz na dobę nie wpływała na sprawność psychoruchową. Przeprowadzone u dorosłych badanie z zastosowaniem pojedynczej dawki wskazuje, że desloratadyna w dawce 5 mg nie wpływa na podstawowe umiejętności pilotowania, w tym na nasilenie subiektywnie odczuwanej senności lub wykonywanie zadań związanych z pilotowaniem.

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

U pacjentów z alergicznym zapaleniem błony śluzowej nosa desloratadyna w postaci tabletek skutecznie łagodziła takie objawy, jak kichanie, świąd i wydzielina z nosa, a także świąd, łzawienie i zaczerwienienie oczu oraz świąd podniebienia. Desloratadyna w postaci tabletek skutecznie łagodziła objawy przez 24 godziny.

Skuteczność desloratadyny stosowanej w postaci tabletek w badaniach klinicznych u młodzieży w wieku od 12 do 17 lat nie została wyraźnie wykazana.

Oprócz ustalonego podziału na sezonowe i całoroczne, alergiczne zapalenie błony śluzowej nosa można również 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 lub więcej dni w tygodniu i dłużej niż 4 tygodnie.

Desloratadyna była skuteczna 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 ograniczanej przez objawy.

Przeprowadzono badanie dotyczące przewlekłej pokrzywki idiopatycznej, którą potraktowano jako kliniczny model zaburzeń o charakterze pokrzywki, ze względu na podobną patofizjologię oraz możliwość łatwiejszej kwalifikacji propektywnej przewlekłe chorych pacjentów. Uwalnianie histaminy jest czynnikiem, który powoduje wystąpienie wszystkich chorób pokrzywkowych, dlatego oczekuje się, że desloratadyna będzie skuteczna w łagodzeniu objawów innych rodzajów pokrzywek, nie tylko przewlekłej pokrzywki idiopatycznej, zgodnie z zaleceniami klinicznymi.

W dwóch, kontrolowanych placebo, trwających sześć tygodni badaniach, z udziałem pacjentów z przewlekłą pokrzywką idiopatyczną, desloratadyna skutecznie łagodziła świąd oraz zmniejszała 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 innych badaniach leków przeciwhistaminowych stosowanych w przewlekłej pokrzywce idiopatycznej, z badań wykluczono niewielką grupę pacjentów, którzy nie reagują na leczenie przeciwhistaminowe. Złagodzenie świądu o ponad 50% obserwowano u 55% pacjentów leczonych desloratadyną w porównaniu do 19% pacjentów, którym podawano placebo. Leczenie desloratadyną również znacznie zmniejszyło wpływ na sen i funkcjonowanie w ciągu dnia, mierzone w czteropunktowej skali stosowanej dla oceny tych zmiennych.

## 5.2 Właściwości farmakokinetyczne

### Wchłanianie

Stężenia desloratadyny w osoczu można oznaczyć w ciągu 30 minut po podaniu. Desloratadyna wchłania się dobrze, a maksymalne stężenie osiąga się 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 od 5 mg do 20 mg.

W serii badań farmakokinetycznych i klinicznych, u 6% badanych wykryto zwiększone stężenie desloratadyny. Częstość występowania fenotypu o spowolnionym metabolizmie była większa u dorosłych przedstawicieli rasy czarnej niż kaukaskiej (odpowiednio 18% i 2%), aczkolwiek profil bezpieczeństwa u tych pierwszych nie różnił się od ogólnej populacji.

W badaniu farmakokinetycznym z zastosowaniem dawek wielokrotnych przeprowadzonym z zastosowaniem leku w postaci tabletek u zdrowych, dorosłych osób, u 4 osób stwierdzono słaby metabolizm desloratadyny. U tych osób stężenie  $C_{max}$  było około 3 razy większe po około 7 godzinach, a okres półtrwania w fazie eliminacji wynosił około 89 godzin.

### Dystrybucja

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

### Metabolizm

Dotychczas nie zidentyfikowano enzymu odpowiedzialnego za metabolizm desloratadyny, dlatego nie można wykluczyć interakcji z innymi lekami. Desloratadyna nie hamuje CYP 3A4 *in vivo*, a przeprowadzone badania *in vitro* wykazały, że lek nie hamuje CYP 2D6 i nie jest ani substratem, ani inhibitorem glikoproteiny P.

### Eliminacja

Obecność pokarmu nie ma większego wpływu na wartości AUC i  $C_{max}$  desloratadyny w postaci liofilizatu doustnego, podczas gdy obecność pokarmu zwiększa wartość  $T_{max}$  desloratadyny z 2,5 do 4 godzin, a  $T_{max}$  3-OH-desloratadyny z 4 do 6 godzin. Nie stwierdzono wpływu soku grejpfrutowego na dystrybucję desloratadyny. Woda nie ma wpływu na biodostępność desloratadyny w postaci tabletek ulegających rozpadowi w jamie ustnej.

### **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, wynikające z konwencjonalnych badań farmakologicznych dotyczących bezpieczeństwa, badań toksyczności po podaniu wielokrotnym, rakotwórczości, genotoksyczności i toksycznego wpływu na rozród i rozwój potomstwa, nie ujawniają żadnego szczególnego zagrożenia dla człowieka. Zbiorcza analiza badań przedklinicznych i klinicznych dotyczących podrażnień wywołanych stosowaniem tabletki ulegającej rozpadowi w jamie ustnej wykazała mało prawdopodobne ryzyko miejscowego podrażnienia wywołanego tą postacią leku podczas stosowania klinicznego. W badaniach z desloratadyną i loratadyną nie wykazano działania rakotwórczego.

## **6. DANE FARMACEUTYCZNE**

### **6.1 Wykaz substancji pomocniczych**

Polakrylina potasowa  
Kwas cytrynowy jednowodny  
Żelaza tlenek czerwony (E 172)  
Magnezu stearynian  
Kroskarmeloza sodowa  
Aromat Tutti Frutti  
Aspartam (E 951)  
Celuloza mikrokrystaliczna  
Mannitol (suszony rozpyłowo)  
Potasu wodorotlenek (do ustalenia pH)

### **6.2 Niezgodności farmaceutyczne**

Nie dotyczy.

### **6.3 Okres ważności**

2 lata

### **6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania**

Brak specjalnych zaleceń dotyczących warunków przechowywania.

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

Blister Aluminium/OPA/PVC/Aluminium/Papier/PET w tekturowym pudełku.  
Wielkość opakowań: 10, 30, 60, 90 tabletek ulegających rozpadowi w jamie ustnej.  
Nie wszystkie wielkości opakowań muszą znajdować się w obrocie.

#### **6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania produktu leczniczego do stosowania**

Bez specjalnych wymagań.

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

Medicplast Polska Sp. z o.o.  
ul. Wólczyńska 232  
01-919 Warszawa  
Polska

#### **8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU**

Pozwolenie nr:

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

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