

## ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

### 1. Име на лекарствения продукт

**CLARINASE®**  
**Modified release tablets**

**КЛАРИНАЗЕ**  
**Таблетки с изменено освобождаване**

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-3266/01.04.04	
654/13.04.04	<i>[Signature]</i>

### 2. Качествен и количествен състав

Всяка таблетка CLARINASE съдържа 60 mg Pseudoephedrine sulfate и 5 mg Loratadine в таблетната обвивка и 60 mg Pseudoephedrine sulphate в ядрото на таблетката.

### 3. Лекарствена форма

Таблетки с изменено освобождаване.

### 4. Клинични данни

#### 4.1. Терапевтични показания

- CLARINASE таблетки са показани за облекчаване на симптоми свързани с алергични ринити и вирусни заболявания на ГДП, протичащи с назална конгестия, кихане, ринорея, сърбеж и сълзене.
- CLARINASE се препоръчват, когато е желано съчетанието на антихистаминното действие на Loratadine и деконгестантния ефект на Pseudoephedrine.

#### 4.2. Дозировка и начин на употреба

За възрастни и деца над 12 годишна възраст: една таблетка два пъти дневно, за предпочитане преди хранене. Таблетката се приема с вода и не се дъвче. Продължителността на лечението е възможно най-кратка – не повече от 10 дни, тъй като Pseudoephedrine постепенно губи своята ефикасност по време на хронична употреба.

Когато симптомите на запушване на горните дихателни пътища и на носа са облекчени, лечението трябва да продължи с антихистамини, ако се налага.

#### 4.3. Противопоказания

- CLARINASE таблетки са противопоказани при пациенти със свръхчувствителност към някои от компонентите им;
- Поради факта, че съдържат Pseudoephedrine, CLARINASE таблетки са противопоказани и при пациенти лекувани с MAO – инхибитори, 14 дни след прекратяване на лечението с тях;
- При пациенти с тесноъгълна глаукома;
- Ретенция на урината;
- Хипертиреоидизъм;
- Сърдечносъдови заболявания като исхемична болест на сърцето, тахиаритмия и тежка артериална хипертония;



- CLARINASE таблетки не се препоръчват при пациенти с тежко чернодробно увреждане;
- CLARINASE таблетки не се препоръчват за деца под 12 години.

#### 4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения при употреба

Предпазливост трябва да бъде проявена при пациенти лекувани с дигиталис, пациенти със сърдечни аритмии, хипертония, инфаркт на миокарда и диабетес мелитус, стенозираща пептична язва, пилородуоденална обструкция, хипертрофия на простатата, обструкция на шийката на пикочния мехур, бронхоспазми.

С особено внимание CLARINASE трябва да се прилага при пациенти над 60 годишна възраст, тъй като в тази възраст те са особено чувствителни към нежеланите лекарствени реакции предизвикани от симпатикомиметици. В този случай дозата трябва да бъде намалена.

Дозата се намалява също в случай на остра бъбречна недостатъчност. Предпазливост трябва да бъде проявена и при пациенти лекувани с други симпатикомиметици, включващи деконгестанти, подтискащи апетита психостимуланти, психостимуланти от амфетаминов тип, антихипертензивни агенти, трициклични антидепресанти и други антихистамини.

Както при други стимуланти на централната нервна система, с Pseudoephedrine sulfate може да се злоупотреби. Продължителната употреба може да доведе до пристрастеност и следователно нараства рискът от предозиране.

Приемът на pseudoephedrine от спортисти може да доведе до положителни допинг – тестове.

#### 4.5. Лекарствени и други взаимодействия

##### Loratadine

Едновременния прием на Loratadine с алкохол няма потенциращ ефект, което е било установено чрез психомоторни изследвания.

Било е отбелязано нарастване на плазмената концентрация на Loratadine след едновременна употреба с Ketoconazole, Erythromycin или Cimetidine в контролни клинични изследвания, но без съществени клинични изменения (включително електрокардиография). Едновременния прием на Loratadine с лекарствени продукти, които забавят метаболизма на черния дроб би трябвало да се провежда предпазливо, докато не се завършат окончателните проучвания за взаимодействие.

##### Pseudoephedrine

Симпатомиметиците могат да намалят антихипертензивния ефект на лекарствените продукти, влияещи на симпатиковата система – такива като Methyldopa, Reserpine и Guanethidine, така както и частично да отстранят хипотензивното действие на бета-блокери. Едновременната употреба на CLARINASE таблетки със симпатикомиметици като деконгестанти, апетитоподтискащи, амфетамини, трициклични анти-депресанти или MAO инхибитори, могат да причинят повишаване на кръвното налягане. Поради дълготрайното действие на MAO инхибиторите, това взаимодействие е все още възможно и 14 дни след прекратяване на приема им. Едновременната употреба с Furazolidone трябва да се избягва, защото по-късно може да причини зависимо от дозата инхибиране на MAO. При съвместната употреба на Pseudoephedrine с дигиталисови гликозиди може да се наблюдава увеличение на ектопична сърдечна



активност. Антиацидните продукти увеличават абсорбцията на Pseudoephedrine, каолинът я намалява.

#### Лекарствено/Лабораторни тест взаимодействия

Антихистамините трябва да се спрат за около 48 часа преди процедурите с кожно тестване, тъй като тези лекарствени продукти могат да предотвратят или да намалят иначе положителната реакция на индикаторите за кожна реактивност.

#### **4.6. Бременност и кърмене**

Безопасността от употребата на CLARINASE таблетки по време на бременност не е достатъчно добре установена. Ето защо лекарствения продукт не трябва да се използва при бременност.

Clarínase се екскретира в кърмата, поради което прилагането сред кърмещи жени се не препоръчва.

#### **4.7. Влияние върху способността за шофиране и работа с машини**

Дневната доза от 10 mg Loratadine няма седативен ефект.

По време на клинични проучвания, при които е изследван ефекта върху способността за шофиране при прием на loratadine не са били наблюдавани нарушения в концентрацията и активното внимание. Пациентите трябва да бъдат информирани, че в някои отделни случаи може да възникне сънливост, която влошава способността за шофиране и работа с машини.

Няма данни, че Pseudoephedrine sulfate повлиява неблагоприятно психомоториката.

#### **4.8. Нежелани лекарствени реакции**

Най-честите нежелани лекарствени реакции свързани с Pseudoephedrine са безсъние и пресъхване на устата.

Други странични реакции съпровождащи Pseudoephedrine са нервност, световъртеж, тахикардия, повишаване на кръвното налягане, сърцебиене, задържане на урина, анорексия и други типични за симпатикомиметиците нежелани лекарствени реакции.

Честотата на нежеланите реакции като сънливост и главоболие, дължащи се на Loratadine, съответно на Loratadine и Pseudoephedrine е сравнима с тази на плацебо.

Откакто Loratadine е разрешен за продажба, рядко са били наблюдавани алоpecia, анафилаксия и нарушена чернодробна функция.

Алергичен обрив и стомашно-чревни смущения, като гадене, гастрит са били рядко споменавани и са присъщи и за двата компонента на CLARINASE.

При деца Pseudoephedrine може да причини раздразнителност или агресивност.

Симпатикомиметиците могат да причинят симптоми на централна възбуда, халюцинации и конвулсии или сърдечносъдов колапс с хипотензия.

#### **4.9. Предозиране**

В случай на предозиране се прилага общо симптоматично и поддържащо лечение с необходимата продължителност.

Прояви: Освен лекото успокоение, което може да се дължи на Loratadine, приет в доза, няколко пъти по-голяма от препоръчаната, могат да се наблюдават и



симптоми, дължащи се на предозирането със симпатомиметика. Те могат да варират от депресивни прояви от страна на ЦНС (седация, апнея, понижена концентрация, цианоза, кома, кардиоваскуларен колапс) до възбуждане на ЦНС (безсъние, халюцинации, тремор или гърчове) и евентуална смърт. Други признаци и симптоми могат да бъдат: главоболие, тревожност, трудности в процеса на уриниране, мускулна слабост и напрегнатост, еуфория, възбуденост, тахикардия, сърцебиене, жажда, изпотяване, повдигане, повръщане, болка в областта на сърцето, световъртеж, шум в ушите, атаксия, замъглено виждане, хипертония или хипотония. Възбудата е възможна особено при деца, като се проявява с атропиноподобни симптоми (пресъхване на устата; неподвижни, разширени зеници; зачервяване, хипертермия и стомашно-чревни симптоми).

**Лечение:** Предизвиква се повръщане, дори и то вече да е настъпило спонтанно. Препоръчваният метод е чрез използването на сироп от ипека. Повръщане не се предизвиква при пациенти в безсъзнание. Трябва да се вземат необходимите мерки срещу аспирация, особено при деца. След повръщането може да се опита абсорбиране на останалия в стомаха лекарствен продукт с помощта на активен въглен, разтворен във вода.

Ако не се предизвика повръщане или ако то е противопоказно, се извършва промиване на стомаха. Физиологичният разтвор е средство на избор за промиване на стомаха, особено при децата. При възрастни може да се използва обикновена вода. Преди всяка следваща промивка трябва да се отстрани колкото е възможно повече от водата, използвана за предишното промиване на стомаха.

Салинните очистители, действащи на осмотичен принцип, извличат водата и могат да са от значение за бързото разреждане на чревното съдържимо.

Не е известно дали този лекарствен продукт е диализуем.

След спешното лечение пациентът продължава да бъде под лекарско наблюдение. Лечението на признаците и симптомите на предозирането е симптоматично и поддържащо. Стимуланти (аналептици) не се използват. Хипертонията може да се контролира с алфа-блокери, а тахикардията с бета-блокери. Барбитурати с кратко действие, diazepam 10 mg i.v. или i.m. (при възрастни) и 0.5 mg/kg интравектално (при деца), или paraldehyde могат да бъдат използвани за контролиране на пристъпите. Хипертермията, особено при деца, може да изисква овладяване чрез намокрена с вода гъба или чрез използване на хипотермна завивка (одеало). Апнеята се лекува чрез подлагане на изкуствено дишане.

## Фармакологични свойства

### 5.1. Фармакодинамични свойства

Фармакодинамичното действие на CLARINASE е директно свързано с това на неговите компоненти: Loratadine – дългодействащ антихистамин и pseudoephedrine sulfatate назален деконгестант. Loratadine е мощен, дългодействащ трицикличен антихистамин, селективен антагонист на периферните рецептори, без централно седативно действие или антихолинергичен ефект.

При изследвания с лабораторни животни, Loratadine е показал много слаб афинитет към мембранните рецептори на мозъчната кора и не прониква лесно в централната нервна система. Седативният профил на Loratadine 10 mg дневно е сравним с този на плацебо. По време на дългосрочно лечение няма отбелязани значими клинични изменения във виталните функции, лабораторно-тестовите стойности, физическите изпитания или електрокардиограмите.

### 5.2. Фармакокинетични свойства



## Loratadine

След орална употреба Loratadine се абсорбира бързо и добре и се метаболизира екстензивно в черния дроб. Въз основа на сравнение с AUC (площ под кривата на концентрация), съотношението на Loratadine към неговия активен метаболит е приблизително 0.05. Когато  $C_{max}$  се вземе предвид, това съотношение е приблизително 0.29. Дистрибуцията в плазмата за Loratadine е около 1 час и 2 часа за активния му метаболит.

Излъчване - първоначалните данни при нормални субекти са показали среден полуживот от 12.4 часа за Loratadine и 19.6 часа за активния му метаболит. Последвалите данни у нормални възрастни субекти са показали среден полуживот от 8.4 часа (в рамките на 8 до 20 часа) за Loratadine и 28 часа (в рамките на 8.8 до 92 часа) за главния активен метаболит. Приблизително 40% от дозата се излъчва в урината и 42% във фекалиите за период от 10 дни, под формата на свързани метаболити. Приблизително 27% от дозата се отделят в урината по време на първите 24 часа. Следи от непроменен Loratadine и от неговия активен метаболит са били установени в урината.

Било е направено сравнение на фармакокинетичния профил на Loratadine и неговия активен метаболит у здрави доброволци и у доброволци в старческа възраст. Параметрите на биоактивност на Loratadine и неговия активен метаболит са пропорционални на дозата. Loratadine и неговият активен метаболит се излъчват в млякото на кърмачките. Четиридесет и осем часа след приемане на дозата, само 0.029% от Loratadine са установени в млякото като непроменен Loratadine и негов активен метаболит. Loratadine е свързан в значителна степен (97-99%), а неговият активен метаболит в по-ниска степен (73-76%) с плазмените протеини.

## Pseudoephedrine sulfate

След орална употреба, Pseudoephedrine sulfate се абсорбира бързо и напълно. Действието му като деконгестант се изяснява в рамките на 30 минути при доза от 60 mg и продължава около 4-6 часа. Претърпява непълен чернодробен метаболизъм чрез N-деметилизация до неактивен метаболит.

Излъчване - полуживотът при хора, с измерено в урината pH до 6, е в рамките на 5 до 8 часа. Лекарствения продукт и неговият активен метаболит се отделят в урината, 55-75% от дозата се отделят непроменени. В кисела урина (pH 5) екскрецията се ускорява и продължителността на действието намалява. В случай на алкализация на урината се извършва частична резорбция.

Предполага се, че Pseudoephedrine преминава през плацентата и прониква в цереброспиналната течност.

Лекарствения продукт също така може да се отдели в млякото на кърмачките.

## **6. Фармацевтични свойства**

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

Lactose, maize starch, povidone, magnesium stearate, acacia, calcium sulphate, titanium dioxide, white wax

### **6.2. Несъвместимости**

Не са известни.

### **6.3. Срок на годност**

24 месеца.



#### **6.4. Специални условия за съхранение**

Да се съхранява при температура под 25°C.  
Да се пази от прекомерна влага.

#### **6.5. Опаковка**

Блистер съдържащ 10 таблетки с изменено освобождаване.

#### **7. Име и адрес на производителя**

Schering-Plough Labo N.V.,  
2220 Heist-op-den-Berg,  
Belgium

#### **8. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба**

Schering-Plough Central East AG,  
Topferstrasse 5,  
6004 Lucerne  
Switzerland

#### **9. Номер и дата на първо разрешение за употреба**

9800074 / 06.04.1998

#### **10. Дата на последна актуализация на текста**

16 януари 1997 г.

