

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВООПАЗВАНЕТО	
Приложение към	
Лиценз за употреба № И-5830/01.08.02г	
624/16.07.2002	<i>Милер</i>

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

EROLIN[®] syrup
ЕРОЛИН[®] сироп

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

В 5 ml сироп се съдържат 5 mg Loratadine

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Сироп за перорално приложение

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Терапевтични приложения

Възрастни:

Erolin сироп се използва за облекчаване симптомите на:

- сезонен и целогодишен алергичен ринит
- алергични конюнктивити
- идиопатична хронична уртикария

Деца:

Деца над 2 годишна възраст могат да бъдат лекувани с Erolin при следните състояния:

- сезонни алергични ринити и конюнктивити
- алергични кожни реакции (напр. идиопатична уртикария)

4.2. Дозировка и начин на приложение

Възрастни:

Обикновено началната доза за възрастни и юноши над 12 години е 10 mg Loratadine (т.е. 10 ml сироп) дневно.

Пациенти с чернодробна недостатъчност, както и пациенти с нарушена бъбречна функция (гломерулна филтрация под 30 ml/min) : При тези пациенти е необходимо намаляване на дозата. Началната доза може да се



намали до 5 mg (5 ml сироп) дневно или пациентите могат да приемат 10 mg (10 ml сироп) през ден.

Пациенти в напреднала възраст: Безопасността и ефикасността на медикамента не е подробно проучена при пациенти над 60 годишна възраст. Тази група пациенти са изложени на повишен риск от появата на нежелани реакции. Следователно, се препоръчва повишено внимание при употреба на Erolin при тези пациенти, когато се лекуват със същите дози като тези за възрастни с нормална бъбречна функция.

Деца:

6-12 годишни деца се лекуват съгласно тяхната телесна маса:

- деца тежащи по-малко от 30 kg: 5 mg (5 ml сироп) дневно
- деца тежащи повече от 30 kg: 10 mg (10 ml сироп) дневно.

Деца от 2-6 години могат да се бъдат лекувани с Erolin сироп:

- деца тежащи по-малко от 30 kg: 5 mg (5 ml сироп) дневно
- деца тежащи повече от 30 kg: 10 mg (10 ml) дневно.

4.3. Противопоказания

Erolin сироп не трябва да се дава на:

- индивиди с данни за свръхчувствителност към лекарственото вещество и/или към някое от помощните вещества
- бременни жени или кърмачки
- деца под 2 годишна възраст

4.4. Специални предупреждения и препоръки при употреба

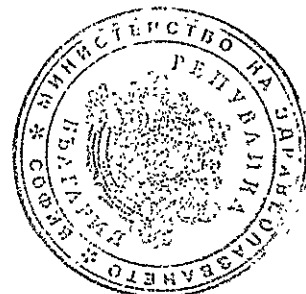
Продължителността на лечението с Erolin трябва да бъде индивидуално определена.

Ако с Erolin са лекувани пациенти с диабет, те трябва да бъдат предупреждени, че в 5 ml сироп се съдържат 3.0 g захароза.

Когато се приема съгласно препоръките за дозиране, всяка доза набавя до 6.0 g захароза. Неподходящ при хора с вродена непоносимост към фруктозата, глюкозен/галактозен синдром на малабсорбция или захаразно/изомалатазен дефицит.

Сиропът съдържа също и глицерол, който във високи дози се явява вреден. Може да причини главоболие, стомашно дразнене и диария.

Пациентите трябва да се съветват да спрат лечението с Erolin поне 4 дни преди извършване на тест на Prick, за да се избегне фалшиво отрицателен резултат от теста.



4.5. Лекарствени или други взаимодействия

Необходимо е внимание при комбинация на Erolin с всеки от следните лекарствени продукти:

- erythromycin, cimetidine, ketoconazole. Едновременното приложение на Erolin заедно с някои от тези лекарствени продукти може да доведе до повишаване плазмените нива на Loratadine и неговите метаболити. Плазмените концентрации на cimetidine и ketoconazole остават непроменени, докато плазмените нива на erythromycin се намаляват с 15%.
- Инхибиторите на чернодробните ензими (напр. quinidine, fluconazole и fluoxetine). Поради липса на контролирани клинични проучвания тези инхибитори се комбинират внимателно с Loratadine.

4.6. Бременност и кърмене

Лечението с Erolin е противопоказано по време на бременност и/или кърмене. Проучванията при животни показват липса на тератогенни ефекти. Третирането с високи дози е ембриотоксично. Няма клиничен опит по отношение използването на медикамента при бременни жени. Тъй като Loratadin се екскретира с майчиното мляко, Erolin не трябва да се прилага при кърмачки.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

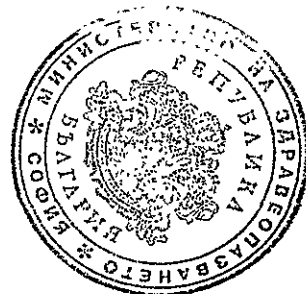
Ако Erolin се прилага за пръв път, пациентите трябва да се посъветват да следят за появата на нежелани лекарствени реакции (напр. сънливост), които могат да нарушат техните способности за управление на превозни средства или за работа с машини. Пациентите трябва да бъдат инструктирани да продължат с такива активности само след като нежеланите ефекти отзвучат.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Обикновено Erolin се понася много добре. По време на лечението могат да се появят малко нежелани ефекти като: главоболие, сънливост, уморяемост, сухота в устата, гадене, повишен апетит, стомашно-чревен дискомфорт и реакции на свръхчувствителност.

При деца прилагането на Erolin сироп може да доведе до следните рядко срещани нежелани лекарствени реакции: нервност, свиркащо дишане, уморяемост, хиперкинезия, абдоминални болки, конюнктивит, дисфония, общо неразположение.

4.9. Предозиране



Симптоми: Сомнолентност, тахикардия и главоболие са били намерени след приемане на 40-180 mg Loratadine.

Лечение: Няма специфичен антидот, веднага трябва да бъде приложено симптоматично и поддържащо лечение. Препоръчва се провокирано повръщане, освен за пациенти в кома. Употребата на Iресасуанѝа се препоръчва дори и след спонтанно повръщане. След изпразване на стомашното съдържимо може да се опита прилагане на активен въглен. Ако повръщането не е успешно предизвикано или е противопоказано, показана е стомашна промивка. След предприемане на тези спешни мерки пациентите трябва да бъдат под строг медицински контрол.

Loratadine не подлежи на диализиране.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1. Фармакодинамични свойства

Loratadine, лекарственото вещество на Erolin таблетки, е дългодействащ трицикличесен селективен периферен H_1 -антагонист. В клинично отношение няма значим седативен ефект или антихолинергична активност. Loratadine има слаб афинитет към церебралните рецептори, и не минава лесно кръвно-мозъчната бариера. Дори продължително лечение не води до значителни клинични промени в жизнените функции, лабораторните показатели, психичното състояние или до промени в ЕКГ.

5.2. Фармакокинетични свойства

НАЧАЛО и ПРОДЪЛЖИТЕЛНОСТ на действие

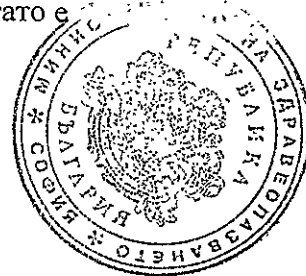
Началото на ефекта на медикамента се появява 1-3 часа след перорален прием, с достигане на пик през 8-12 час след перорално приемане. Продължителността на ефекта се определя на 24-28 часа след единична перорална доза.

РЕЗОРБЦИЯ и МЕТАБОЛИЗЪМ

Loratadine се резорбира бързо от чревния тракт след перорално приложение. Лекарството се метаболизира почти напълно в черния дроб главно чрез CYP 3A4 изоензим. В присъствие на инхибитори на тази система, Loratadine може също така да бъде метаболизиран от CYP 2D6.

След екстензивен "first pass" метаболизъм в черния дроб, се получава активния метаболит descarboethoxy-loratadine. Този активен метаболит се конюгира до неактивни такива и е по-мощен от изходното съединение.

Ефект на храната: Областта под кривата (AUC) на Loratadine и активния му метаболит е увеличена и T_{max} на двете молекули е забавено, когато е консумирана храна преди приемането на медикамента.



РАЗПРЕДЕЛЕНИЕ

Тоталното свързване с протеините на Loratadine се оценява на 97 %, докато за активния метаболит е 73-77 %. Loratadine се свързва предимно с периферните, не толкова с централните H_1 рецептори.

Когато се приема веднъж дневно, Loratadine достига състояние на плато при петата дневна доза. При дневни дози между 10 и 40 mg, фармакокинетиката на изходното съединение и активния метаболит не зависят от дозата.

ЕКСКРЕТИРАНЕ

Време за полуелиминиране: 12 до 15 часа при здрави индивиди. По-дълго време за полуелиминиране е съобщено при пациенти в напреднала възраст и при пациенти с хронични чернодробни заболявания. 24 часа след приемането на единична перорална доза, 27% от дозата се екскретира чрез бъбреците в конюгирана форма. След 10 дневно лечение с Loratadine, 40 % и 42 % от цялата приета доза се екскретира в урината и изпражненията респективно.

Loratadine и активният му метаболит преминават през плацентарната бариера и се екскретират в майчиното мляко.

5.3. Предклинични данни за безопасност

ТОКСИЧНОСТ ПРИ ЕДИНИЧНА ДОЗА

Установено е, че стойностите на LD_{50} след перорален прием на Loratadine при мишки и плъхове са по-големи от 5000 mg/kg. Единични перорални дози, 10 пъти по-високи от препоръчваните лечебни дози при хора не показват токсични ефекти, когато се оценяват при плъхове, мишки и маймуни.

ТОКСИЧНОСТ ПРИ ПОСЛЕДОВАТЕЛНИ ДОЗИ

Не се съобщава за директни или специфични свързани с лекарството ефекти.

ТОКСИЧНОСТ ПО ОТНОШЕНИЕ НА РЕПРОДУКТИВНАТА ФУНКЦИЯ

Съобщава се за обратимо намаление на фертилността при мъжки плъхове, третирани с 64 mg/kg Loratadine. По ниски дози нямат подобни ефекти.

ТЕРАТОГЕННОСТ

Не се съобщава за тератогенен ефект в потомството на женски плъхове и зайци, приемали перорални дози Loratadine до 96 mg/kg.

МУТАГЕННОСТ

Не е наблюдавано доказателство за мутагенен потенциал при нито едно от следните: Ames проби за мутации и forward point проби за мутации, проби за увреждане на ДНК, и тестове за хромозомни аберации.



КАНЦЕРОГЕННОСТ

В 18-месечно проучване, мъжки мишки, приемащи Loratadine в доза 40 mg/kg, показват по-висока честота на развитие на хепатоцелуларни тумори (аденоми и карциноми), сравнено с контролите. Съобщава се за подобни наблюдения при мъжки и женски плъхове, третирани респективно с 10 mg/kg и 25 mg/kg. Съгласно различни проучвания, клиничната значимост на тумор-промотиращия ефект на Loratadine по време на продължително лечение не е известна.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества

Освен лекарственото вещество, сиропът съдържа също: Sodium benzoate, Ph. Eur., Saccharose, Ph. Eur., Propylenglycolate, Ph. Eur., Glycerine, Ph. Eur., Citric acid anhydrate, Ph. Eur., Vanilla flavour AB – 710, Strawberry flavour 22754-00 и distilled water, Ph. Eur.

6.2. Несъвместимости

Не са известни.

6.3. Срок на годност

Неотворен: 2 години

Отворен: 6 месеца при условия за съхранение, посочени в т. 6.4.

6.4. Специално предупреждение за съхранение

Отворени и неотворени бутилки:

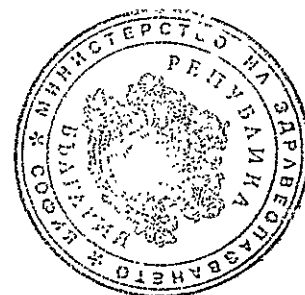
Съхранявайте при температура под 25°C.

6.5. Вид и съдържание на опаковката

Бутилка от кафяво стъкло с алуминиева капачка, осигурена срещу изтичане. Всяка бутилка съдържа 120 ml сироп. Една бутилка и мерителна лъжичка са поставени в картонена опаковка заедно с листовка за пациента.

6.6. Препоръки за употреба

Съгласно т. 4.2.



7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РЕГИСТРАЦИЯТА

EGIS PHARMACEUTICALS LTD.

Kereszturi ut 30-38, 1106 Budapest

HUNGARY

Фармацевтичен завод ЕГИС АД

Керестури ут 30-38, 1106 Будапеща

УНГАРИЯ

8. СТРАНИ, В КОИТО Е РЕГИСТРИРАН ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Страни в които е подаден за регистрация:

Чехия, Хонг Конг, Литва, Румъния, Русия, Словакия, Виетнам, Полша.

9. ПЪРВА РЕГИСТРАЦИЯ НА ЛЕКАРСТВЕНОТО СРЕДСТВО

10. ДАТА НА (ЧАСТИЧНА) ПРОВЕРКА НА ТЕКСТА

Юни, 2000 год.

