

## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

### 1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

**EROLIN® 10 mg tablets**  
**ЕРОЛИН 10 mg таблетки**

### 2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа 10 mg Loratadine

### 3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетки за перорално приложение

### 4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

#### 4.1. Терапевтични приложения

##### **Възрастни:**

Erolin таблетки могат да бъдат използвани 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
- кожни алергични реакции (напр. идиопатична уртикария)

#### 4.2. Дозировка и начин на приложение

##### **Възрастни:**

Обичайната начална доза за възрастни и подрастващи над 12 години е 10 mg Loratadine (т.е. 1 таблетка) дневно.

Пациенти с чернодробна недостатъчност, както и пациенти с нарушена бъбречна функция (гломерулна филтрация < 30 ml/min): при тези пациенти е необходимо намаляване на дозата. Началната доза при тях може да бъде 5 mg (1/2 таблетка) дневно или пациентите могат да приемат 10 mg (1 таблетка) през ден.

Пациенти в напреднала възраст: Няма задълбочени проучвания по отношение на безопасността и ефективността на лекарствения продукт при пациенти над 60 годишна възраст. Тази пациенти са изложени на повишен риск от появата на нежелани ефекти. Следователно, повишеното внимание при употреба на Erolin при тези пациенти е препоръчително, когато се лекуват със същите дози като тези за възрастни с нормална бъбречна функция.

#### **Деца:**

Дозата при деца от 6 до 12 години зависи от телесна им маса:  
при деца с телесна маса под 30 kg: 5 mg (1/2 таблетка) дневно  
при деца с телесна маса над 30 kg: 10 mg (1 таблетка) дневно

При деца от 2-6 години е по-добре да се дава Erolin сироп, особено при трудности при поглъщане на таблетките.

Таблетките трябва да се поглъщат цели, преди хранене с малко количество течност. Таблетките не трябва да се дъвчат.

#### **4.3. Противопоказания**

Erolin таблетки не трябва да се дават на:

- пациенти с данни за свръхчувствителност към лекарственото вещество или някое от помощните вещества
- бременни жени или кърмачки
- деца под 2 годишна възраст (поради липса на достатъчни данни от контролирани проучвания).

#### **4.4. Специални предупреждения и препоръки при употреба**

Продължителността на лечението с Erolin трябва да бъде определена индивидуално.

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

#### 4.5. Лекарствени или други взаимодействия

Лечението с Erolin трябва внимателно да се комбинира с някои от изброените 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 кърмене. Проучванията при животни не показаха поява на тератогенни ефекти. Третирането с високи дози е ембриотоксично. Няма клиничен опит по отношение използването на лекарствения продукт при бременни жени. Тъй като Loratadine 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

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

При деца прилагането на Erolin може да доведе до следните рядко срещани нежелани ефекти: нервност, свиркащи хрипове, 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 започнато симптоматично и поддържащо лечение. Препоръчва се провокирано повръщане, освен за пациенти в кома. Употребата на Ipecacuanha се препоръчва дори и след спонтанно повръщане. След изпразване на

стомашното съдържимо може да се опита прилагане на активен въглен. Ако повръщането не е 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 диализа.

## 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

Началният отговор след перорален прием се появява 1-3 часа след приложението, с достигане на максимален ефект 8-12 часа след приложението. Продължителността на ефекта се определя на 24-48 часа след единична перорална доза.

#### РЕЗОРБЦИЯ и МЕТАБОЛИЗЪМ

Loratadine се резорбира бързо от чревния тракт след перорално приемане. 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 descarboethoxyloratadine. 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 лекарствения продукт.

#### 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 histamine-1 рецептори.

Когато се приема веднъж дневно, плазмената концентрация на Loratadine достига състояние на плато при петата дневна доза. При дневни дози между

10 и 40 mg, фармакокинетиката на лекарственото вещество 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 през 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

Беше установено, че стойностите на LD<sub>50</sub> след перорален прием на Loratadine при мишки и плъхове са по-големи от 5000 mg/kg. Единични перорални дози, по-високи 10 пъти от препоръчаните максимални терапевтични 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 обратима, намалена фертилност 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, всяка таблетка също съдържа: Silica, colloidal anhydrous Ph. Eur., Magnesium stearate Ph. Eur., Pregelatinized starch USP, Cellulose microcrystalline Ph. Eur. and Lactose monohydrate Ph. Eur.

### **6.2. Несъвместимости**

Не са известни.

### **6.3. Срок на годност**

4 години

### **6.4. Специално предупреждение за съхранение**

Да се съхранява под 25<sup>0</sup>С при нормални условия.

### **6.5. Вид и съдържание на опаковката**

Всеки PVC/PVdC блистер съдържа 10 таблетки. Един блистер (1x10 таблетки), или 3 блистера (3x10 таблетки) са поставени в картонена опаковка заедно с листовката 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. ПЪРВА РЕГИСТРАЦИЯ НА ЛЕКАРСТВЕНОТО СРЕДСТВО**

## **9. ДАТА НА (ЧАСТИЧНА) ПРОВЕРКА НА ТЕКСТА**

Юни, 2000 год.