

KISA ÜRÜN BİLGİSİ

1. BEŞERİ TIBBİ ÜRÜNÜN ADI

DESNORM 2,5 mg efervesan tablet

2. KALİTATİF VE KANTİTATİF BİLEŞİMİ

Etkin madde:

Desloratadin 2,5 mg

Yardımcı maddeler:

Sodyum Bikarbonat (235,0 mg)

Sorbitol (E 420) (22,5 mg)

Aspartam (E 951) (15,0 mg)

Asesülfam Potasyum (10,0 mg)

Sodyum, sorbitol, aspartam ve potasyum hakkında uyarı için ayrıca bölüm 4.4'e bakınız.

Yardımcı maddeler için 6.1'e bakınız.

3. FARMASÖTİK FORMU

Efervesan tablet.

Sarı benekli, beyaz renkte, düz yüzeyli, yuvarlak efervesan tabletler.

4. KLİNİK ÖZELLİKLER

4.1. Terapötik endikasyonlar

DESNORM, 12 yaş ve üzeri erişkinlerde alerjik rinit (bkz. Farmakodinamik özellikler) ve kronik idiyopatik ürtiker ile ilişkili semptomların giderilmesinde endikedir.

4.2. Pozoloji ve uygulama şekli

Pozoloji/uygulama sıklığı ve süresi:

Tabletler yemeklerden bağımsız olarak alınabilir.

İntermittan alerjik rinit (semptomların haftada 4 günden daha az ya da 4 haftadan daha kısa süreyle var olması) hastanın öyküsü değerlendirilerek, bu öykü doğrultusunda tedavi edilmelidir.

Semptomlar getikten sonra tedaviye son verilebilir ve semptomlar yeniden ortaya ıktığında tedavi tekrar başlatılabilir.

Persistan alerjik rinitte (semptomların haftada 4 gn ya da daha fazla ve 4 haftadan daha uzun sreyle var olması), hastalara, alerjen temas dnemleri boyunca srekli tedavi nerilebilir.

Eriřkinler ve ergenler (12 yař ve zeri): Alerjik rinit (intermittan ve persistan alerjik rinit dahil olmak zere) ve kronik idiyopatik rtiker (bkz. Farmakodinamik zellikler) ile bađıntılı semptomların giderilmesi iin, gnde bir kez 2,5 mg'lık bir DESNORM kullanılır.

Uygulama řekli:

DESNORM'u bir bardak suda eritiniz. Sonra bardađı tamamıyla iiniz.

zel poplasyonlara iliřkin ek bilgiler:

Bbrek / Karaciđer yetmezliđi:

Bbrek ve karaciđer yetmezliđi olan hastalarda farmakokinetik verilere dayanarak bařlangı dozu olarak 5mg tablet gnařırı tavsiye edilir.

Pediyatrik poplasyon:

Pediyatrik poplasyonda etkinlik ve gvenilirliđi henz belirlenmemiřtir. Bu nedenle DESNORM'un pediyatrik poplasyonda kullanımı nerilmemektedir.

Geriyatrik poplasyon:

Geriyatrik poplasyonda etkinlik ve gvenilirliđi henz belirlenmemiřtir. Bu nedenle DESNORM'un geriyatrik poplasyonda kullanımı nerilmemektedir.

4.3. Kontrendikasyonlar

DESNORM ieriđindeki etkin maddeye ya da yardımcı maddelere karřı ařırı duyarlılık durumlarında kontrendikedir.

4.4. zel kullanım uyarıları ve nlemleri

DESNORM 2,5 mg'ın, 6 yařın altındaki ocuklardaki etkinlik ve gvenilirliđi belirlenmemiřtir. Bu nedenle kullanılmamalıdır.

DESNORM şiddetli böbrek yetmezliği olgularında doz ayarlanarak dikkatle kullanılmalıdır.

Aspartam için uyarı

DESNORM'da aspartam bulunmaktadır. Aspartam bir fenilalanin kaynağıdır ve fenilketonürisi (ender rastlanan kalıtsal bir hastalık) olan hastalar için zararlı olabilir.

Sodyum için uyarı

DESNORM her dozunda 2,8 mmol sodyum ihtiva eder. Bu durum, kontrollü sodyum diyetinde olan hastalar için göz önünde bulundurulmalıdır.

Sorbitol için uyarı

DESNORM sorbitol içermektedir. Nadir kalıtsal früktoz intolerans problemi olan hastaların bu ilacı kullanmamaları gerekir.

Potasyum için uyarı

DESNORM 0,05 mmol potasyum ihtiva eder. Bu durum, böbrek fonksiyonlarında azalma olan hastalar ya da kontrollü potasyum diyetinde olan hastalar için göz önünde bulundurulmalıdır.

4.5. Diğer tıbbi ürünlerle etkileşimler ve diğer etkileşim şekilleri

DESNORM ile yürütülen ve birlikte eritromisin ya da ketokonazolün uygulandığı klinik araştırmalarda, klinik açıdan önemli etkileşimler gözlenmemiştir (bkz. Farmakodinamik özellikler).

Bir klinik farmakoloji çalışmasında alkol ile birlikte alınan DESNORM tablet alkolün performans bozucu etkilerini potansiyalize etmemiştir (bkz. Farmakodinamik özellikler).

DESNORM oral yolla alınan doğum kontrol ilaçları ile etkileşime geçmektedir. Bu nedenle başka bir doğum kontrol yöntemi (örneğin; kondom) kullanılmalıdır.

4.6. Gebelik ve laktasyon

Genel tavsiye

Gebelik kategorisi C'dir.

Çocuk doğurma potansiyeli bulunan kadınlar/Doğum kontrolü (Kontrasepsiyon)

DESNORM oral yolla alınan doğum kontrol ilaçları ile etkileşime geçmektedir. Bu nedenle, tedavi süresince alternatif, etkili ve güvenilir bir doğum kontrol yöntemi (örneğin; kondom) uygulanmalıdır.

Gebelik dönemi

DESNORM'un gebe kadınlarda kullanımına ilişkin yeterli veri mevcut değildir.

Hayvanlar üzerinde yapılan araştırmalar üreme toksisitesinin bulunduğunu göstermiştir. İnsanlara yönelik potansiyel risk bilinmemektedir. DESNORM gerekli olmadıkça gebelik döneminde kullanılmamalıdır.

Laktasyon dönemi

Desloratadin anne sütüne geçer, bu nedenle emziren kadınlarda kullanımı önerilmemektedir.

Üreme yeteneği/Fertilite

Hayvanlar üzerinde yapılan araştırmalar üreme toksisitesinin bulunduğunu göstermiştir. İnsanlara yönelik potansiyel risk bilinmemektedir. Gebelik düşünen kadınlar gerekli olmadıkça DESNORM kullanmamalıdır.

4.7. Araç ve makine kullanımı üzerindeki etkiler

Araç kullanma becerisinin değerlendirildiği klinik araştırmalarda, desloratadin almakta olan hastalarda herhangi bir bozukluk ortaya çıkmamıştır. Yine de, hastalara çok ender de olsa bazı insanlarda uykululuk hali oluşabileceği ve bu durumun onların araç ve makine kullanma becerilerini bozabileceği belirtilmelidir.

4.8. İstenmeyen etkiler

Klinik araştırmalardaki bir pediatrik popülasyona şurup formülasyonunda desloratadin uygulanmıştır. Bütünsel advers olay sıklığı, desloratadin şurup ve plasebo grupları arasında benzer bulunmuş ve erişkin hastalardaki güvenilirlik profilinden anlamlı bir farklılık göstermemiştir.

Alerjik rinit ve kronik idiyomatik ürtikerin de içinde bulunduđu bir dizi endikasyonu kapsayan klinik arařtırmalarda, önerilen günlük 5 mg dozlarda, DESNORM kullanan hastaların %3'ünde plasebodan daha fazla yan etki görölmüřtür.

Bu reaksiyonlar, sistem organ sınıfına ve görölme sıklığına (çok yaygın $[\geq 1/10]$, yaygın $[\geq 1/100]$ ila $< 1/100]$, yaygın olmayan $[\geq 1/1,000]$ ila $< 1/100]$, seyrek $[\geq 1/10,000]$ ila $< 1/1,000]$, çok seyrek $[\leq 1/10,000]$ veya sıklığı bilinmeyen) göre verilmektedir.

- Genel bozukluklar:

Çok yaygın: Bitkinlik, baş ağrısı

Çok seyrek: Aşırı duyarlılık reaksiyonları (anaflaksi, anjiyoödem, dispne, kaşıntı, döküntü ve ürtiker)

- Sinir sistemi bozuklukları;

Çok yaygın: Ağız kuruluđu

Çok seyrek: Baş dönmesi, somnolans, uykusuzluk, psikomotor hiperaktivite, nöbetler

- Psikiyatrik bozukluklar:

Çok seyrek: Halüsinasyonlar

- Kardiyak bozukluklar:

Çok seyrek: Taşikardi, palpasyonlar

- Gastrointestinal bozukluklar:

Çok seyrek: Abdominal ağrı, bulantı, kusma, dispepsi, ishal

- Hepatobilyer bozukluklar:

Çok seyrek: Karaciğer enzimlerinde yükselme, bilirubin artışı, hepatit

- Kas-iskelet ve bağ dokusu bozuklukları:

Çok seyrek: Miyalji

4.9. Doz aşımı ve tedavisi

Doz aşımı durumunda, absorbe edilmemiş etkin maddeyi uzaklařtıracak standart önlemler alınmalıdır. Semptomatik ve destekleyici tedavi önerilir.

45 mg'a kadar (klinik dozun 9 katı) desloratadin uygulanan çok dozlu bir klinik arařtırmada, klinik yönden önemli herhangi bir etki gözlenmemiřtir.

Desloratadin hemodiyaliz ile elimine edilmemekte ve periton diyalizi ile elimine olup olmadığı bilinmemektedir.

5. FARMAKOLOJİK ÖZELLİKLER

5.1. Farmakodinamik Özellikler

Farmakoterapotik özellikler

Farmakoterapotik grup: Sistemik kullanılan diğer antihistaminikler

ATC kodu: R06AX

Etki mekanizması:

Desloratadin selektif periferik histamin H₁-reseptör antagonisti aktivite gösteren, sedasyon yapmayan, uzun etkili bir histamin reseptör antagonistidir. Desloratadin, oral uygulamadan sonra santral sinir sistemine geçişinin olmaması nedeniyle, periferik histamin H₁-reseptörlerini selektif olarak bloke eder.

Desloratadin, yapılan *in vitro* çalışmalarda antialerjik özellikler göstermiştir. İnsan mast hücreleri ve bazofillerden IL-4, IL-6, IL-8 ve IL-13 gibi proinflamatuvar sitokinlerin salımının inhibisyonu ve endotel hücreleri üzerinde adezyon molekülü P-selektin ekspresyonunun inhibisyonu bu etkiler arasındadır. Bu gözlemlerin taşıdığı klinik önem, henüz doğrulanmayı beklemektedir.

DESNORM oral liyofilizat, yürütülen iki ayrı tek dozlu araştırmada iyi tolere edilmiş ve bu durum klinik laboratuvar bulguları, fizik muayeneler, vital bulgular ve EKG interval verileriyle belgelendirilmiştir. Ayrıca, DESNORM çok dozlu bir araştırmada iyi tolere edilmiştir.

Klinik çalışmalar:

On dört gün süreyle, günde 20 mg'a kadar desloratadin uygulanan çok dozlu bir klinik araştırmada, istatistik ya da klinik açıdan önemli hiçbir kardiyovasküler etki gözlenmemiştir. On gün süreyle, günde 45 mg (klinik dozun dokuz katı) desloratadin verilen bir klinik farmakoloji araştırmasında, QTc intervalinde uzama görülmemiştir. Çok dozlu ketokonazol ve eritromisin etkileşim çalışmalarında, desloratadin plazma konsantrasyonlarında klinik olarak önemli bir değişiklik gözlenmemiştir.

Desloratadin santral sinir sistemine kolayca penetre olmaz. Önerilen günlük 5 mg dozda yürütülen klinik arařtırmalarda, somnolans insidansında plaseboya kıyasla bir artış olmamıřtır.

Klinik arařtırmalarda günde tek doz 7.5 mg verilen DESNORM psikomotor performansı etkilememiřtir. Eriřkinlerde yürütülen bir tek doz çalıřmasında 5 mg desloratadin, subjektif uykululuk halinin řiddetlenmesi veya uçuřla ilgili faaliyetleri de kapsayan, standart uçuř performansı ölçümlerini etkilememiřtir.

Klinik farmakoloji çalıřmalarında alkol ile birlikte uygulama, alkolün indükledięi performans bozukluęunu ya da uyku halini arttırmamıřtır. Tek başına ya da alkol ile birlikte verildięinde, desloratadin ve plasebo grupları arasında psikomotor test sonuçlarında anlamlı farklılıklar bulunmamıřtır.

Alerjik rinitli hastalarda DESNORM tablet hapřırık, burunda akıntı ve kařınma, aynı zamanda gözlerde kařınma, yařarma ve kızarıklık ve damakta kařınma gibi semptomların giderilmesinde etkili olmuřtur. DESNORM tablet semptomları 24 saat süresince etkili bir řekilde kontrol altına almıřtır. Etkinlik, 12-17 yař arasındaki hastalarda net bir řekilde ortaya konulmamıřtır. Yerleřmiř olan mevsimsel ve pereniyal řeklindeki sınıflamaların yanı sıra, alerjik rinit, alternatif olarak semptomların süresi doęrultusunda intermittan alerjik rinit ve persistan alerjik rinit řeklinde de sınıflandırılabilir. İntermittan alerjik rinit semptomların haftada 4 günden daha az ya da 4 haftadan daha kısa süreyle var olması řeklinde tanımlanmaktadır. Persistan alerjik rinit ise semptomların haftada 4 gün ya da daha fazla ve 4 haftadan daha uzun süreyle var olması řeklinde tanımlanmaktadır.

DESNORM'un mevsimsel alerjik rinite baęlı řikayetlerin hafifletilmesindeki etkinlięi, rinokonjonktivit yařam kalitesi anketindeki toplam skorlar ile gösterilmiřtir. En büyük iyileřme, pratikteki problemler ve semptomlar tarafından kısıtlanan günlük aktivitelerde görölmüřtür.

Kronik idiopatik ürtikeri olan hastalarda yürütölen altı hafta süreli, plasebo kontrollü iki arařtırmada DESNORM, tedavinin birinci gününden itibaren, kařıntının hafiflemesinde ve derideki kabartı ve kızarıklıkların büyüklük ve sayısının azalmasında etkili olmuřtur. Her çalıřmada, etkiler, 24 saatlik dozlama aralıęı süresince deęiřmeden devam etmiřtir. Kronik

idiopatik ürtikerde yürütülen diğer antihistaminik arařtırmalarında olduđu gibi, antihistaminiklere yanıtız olarak tanımlanan ve azınlıkta olan hastalar alıřma dıřında tutulmuřtur. Kařıntıda %50'nin üzerinde iyileřme desloratadin ile tedavi edilen hastaların %55'inde ortaya ıkarken, plasebo ile tedavi edilenlerde bu oran %19 olmuřtur. DESNORM ile tedavi aynı zamanda, bu deđiřkenlerin deđerlendirilmesinde kullanılan drt puanlık bir skala ile lldđđđ řekilde, uyku ve gnlk rutin aktiviteler ile etkileřimde anlamlı lde azalma sađlamıřtır.

5.2. Farmakokinetik zellikler

Genel zellikler

Emilim:

Desloratadin uygulamasından sonra, plazmadaki ila konsantrasyonu 30 dakika iinde saptanabilir dzeye gelir. Desloratadinin emilimi iyidir ve maksimum plazma konsantrasyona yaklařık 3 saat sonra ulařılır. Desloratadinin terminal faz yarılanma mr yaklařık 27 saattir. Desloratadinin birikim derecesi, yarılanma mr (yaklařık 27 saat) ve gnde tek doz uygulama sıklıđı ile uyumludur. Desloratadinin biyoyararlanımı 5 ile 20 mg aralıđında doz ile orantılıdır. Yiyecekler DESNORM oral liyofilizatın EAA ve Cmaks deđerlerini etkilemez; ancak yiyecekler desloratadinin Tmaks deđerini 2.5'ten 4 saate, 3-OH-desloratadinin Tmaks deđerini ise 4'ten 6 saate uzatır. Ayrı bir alıřmada, greyfurt suyunun desloratadinin dispoziyonu üzerinde bir etkisi bulunmamıřtır. İme suyunun DESNORM 'un biyoyararlanımı üzerinde etkisi yoktur.

Dađılım:

Desloratadin plazma proteinlerine orta derecede (%83 - %87) bađlanır. 14 gn sureyle gnde tek doz (5 mg ile 20 mg) desloratadin uygulamasını takiben, klinik olarak nem tařıyan herhangi bir ila birikim belirtisi bulunmamıřtır.

Biyotransformasyon:

Desloratadin metabolizması karaciđerde gerekleřir. Desloratadin metabolizmasından sorumlu enzim henz tanımlanmamıř olduđundan diđer ilalarla olabilecek bazı etkileřimler tamamen gz ardı edilememektedir. Desloratadin CYP3A4'u *in-vivo* ortamda inhibe etmez ve *in-vitro* alıřmalar bu tıbbi rnn CYP2D6'yı inhibe etmediđini ayrıca P-glikoproteinin substratı veya inhibitr olmadıđını gstermiřtir.

Sađlıklı eriřkin olgularda tablet formlasyonuyla yürütlen bir ok-dozlu farmakokinetik alıřmada, drt olgunun desloratadini yavař metabolize ettiđi bulunmuřtur. Bu olgularda 7. Saat

civarındaki Cmaks konsantrasyonu yaklaşık 3 kat daha yüksektir ve terminal fazdaki yarılanma ömrü 89 saat civarındadır.

Bir farmakolojik ve klinik arařtırmalar serisinde, olguların %6'sında desloratadin'in plazma konsantrasyonları daha yüksek bulunmuřtur. Bu yavaş metabolize edici fenotipin prevalansı eriřkin (%6) ve 2-11 yas arası pediyatrik (%6) olgularda karşılaştırılabilir nitelikte, ve siyahlarda (eriřkinler %18, pediyatrik olgular %16) beyazlara (eriřkinler %2, pediyatrik olgular %3) kıyasla daha yüksektir; ancak bu olgulardaki güvenilirlik profili, genel popülasyondakinden farklı deęildir.

Eliminasyon:

Desloratadinin ortalama eliminasyon yarı-ömrü 27 saat olarak hesaplanmıřtır. 5-20 mg arasında deęiřen tek oral dozları izleyen Cmax ve EAA deęerleri, dozla orantılı olarak artmıřtır. 14 günlük kullanım sonrası birikim derecesi, eliminasyon yarı-ömrüyle ve pozolojiyle baędařmıřtır.

İnsanlardaki bir kütle denge çalıřması, 14C-desloratadin dozunun yaklaşık %87'sinin metabolitler halinde ve eřit miktarlarda olmak dıřıyla ve idrarla vücuttan uzaklařtırıldıęını göstermiřtir. Plazmadaki 3-hidroksidesloratadin analizi, bu metabolitin Tmax ve eliminasyon yarı-ömrü deęerlerinin, desloratadine ait deęerlere benzedięini göstermiřtir.

Doęrusallık/Doęrusal Olmayan Durum:

Desloratadin önerilen doz aralıęında doęrusal farmakokinetik gösterir. Herhangi bir birikim olmaz.

5.3. Klinik öncesi güvenlik verileri

Desloratadin loratadinin primer aktif metabolitidir. Desloratadin ve loratadin ile yürütölen klinik-öncesi çalıřmalarda, desloratadin temasıyla kıyaslanabilir düzeylerdeki desloratadin ve loratadinin toksisite profilleri arasında kalitatif ya da kantitatif farklılıklar bulunmadıęı ortaya konulmuřtur.

Desloratadin ile elde edilen klinik-dıřı veriler, güvenilirlik farmakolojisi, tekrarlı doz toksisitesi, genotoksisite ve üreme toksisitesine yönelik konvansiyonel çalıřmalar temelinde, insanlar için özel bir tehlikeye iřaret etmemektedir. Ağızda daęılan tablet ile yürütölen klinik öncesi ve klinik irritasyon çalıřmalarının toplu analizinde, bu formölasyonun klinik kullanımda lokal irritasyon riski tařımadıęı saptanmıřtır. Desloratadin ve loratadin ile yürütölen çalıřmalarda karsinojenik potansiyelin bulunmadıęı gösterilmiřtir.

6. FARMASÖTİK ÖZELLİKLER

6.1. Yardımcı maddelerin listesi

Sitrik Asit

Sodyum Bikarbonat

Maltodekstrin

Sorbitol (E 420)

Aspartam (E 951)

Asesülfam Potasyum

Böğürtlen aroması

6.2. Geçimsizlikler

Geçerli değil.

6.3. Raf ömrü

24 ay

6.4. Saklamaya yönelik özel tedbirler

25°C'nin altındaki oda sıcaklığında ve kuru yerde saklayınız.

Kullandıktan sonra tüpün ağzını kapatmayı unutmayınız.

6.5. Ambalajın niteliği ve içeriği

20 ve 30 efervesan tablet plastik tüp / silikajelli plastik kapak ve karton kutuda kullanma talimatı ile beraber ambalajlanır.

6.6. Beşeri tıbbi üründen arta kalan maddelerin imhası ve diğer özel önlemler

Kullanılmamış olan ürünler ya da materyaller “Tıbbi Atıkların Kontrolü Yönetmeliği” ve “Ambalaj ve Ambalaj Atıklarının Kontrolü Yönetmeliği”ne uygun olarak imha edilmelidir.

7. RUHSAT SAHİBİ

Mentis İlaç San. Tic Ltd Şti.
Florya Asfaltı Florya İş merkezi
No: 88 Blok: No:6
Bakırköy / İstanbul
Telefon: 0 212 481 79 52
Faks: 0 212 481 79 52
e-mail: info@mentisilac.com.tr

8. RUHSAT NUMARASI

224/57

9. İLK RUHSAT TARİHİ/RUHSAT YENİLEME TARİHİ

İlk ruhsat tarihi: 30.04.2010
Ruhsat yenileme tarihi:

10. KÜB'ÜN YENİLENME TARİHİ