

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО

Приложение към

разрешение за употреба № 11-14136/16-02-06

502 / 08.08.06

## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

### 1. ТЪРГОВСКО НАИМЕНОВАНИЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

**Telfast 180**

**Телфаст 180**

### 2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Активно вещество: fexofenadine hydrochloride

Една таблетка съдържа:

Fexofenadine hydrochloride 180 mg, еквивалентен на 168mg fexofenadine.

За пълния списък на помощните вещества виж т.6.1

### 3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Плоски филмирани таблетки.

### 4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

#### 4.1. Терапевтични показания

Облекчение на симптомите, свързани с хронична идиопатична уртикария

#### 4.2. Дозировка и метод на приложение

##### Възрастни и деца над 12-годишна възраст

Препоръчаната доза фексофенадин хидрохлорид за възрастни и деца над 12-годишна възраст е 180 mg веднъж дневно.

##### Деца под 12-годишна възраст

Ефективността и безопасността на фексофенадин хидрохлорид не е проучвана при деца под 12-годишна възраст.

##### Специални рискови групи

Проучванията при специални рискови групи (пациенти в напреднала възраст, болни с увредена бъбречна или чернодробна функция) показват, че не е необходимо да се корегира дозата на фексофенадин хидрохлорид при тези пациенти.

#### 4.3. ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Продуктът е противопоказан при пациенти с известна свръхчувствителност към фексофенадин или към някое от помощните вещества.

#### 4.4. Специални предупреждения и специални предпазни мерки



Както при повечето нови лекарства, съществуват ограничени данни за приложението на продукта при пациенти в напреднала възраст и болни с увредена бъбречна или чернодробна функция. Фексофенадин хидрохлорид трябва да се прилага внимателно при тези специални групи.

#### **4.5. Взаимодействия с други медицински продукти и други форми на взаимодействие**

Фексофенадин не се подлага на биотрансформация в черния дроб и поради това не взаимодейства с други лекарства посредством чернодробните механизми. Доказано е, че едновременното приложение на фексофенадин хидрохлорид с еритромицин или кетоконазол води до увеличение на нивата на фексофенадин в плазмата 2-3 пъти. Промените не са се съпровождали с ефекти върху QT-интервала и не са били свързани с увеличение на нежеланите ефекти в сравнение със самостоятелното приложение на лекарствата.

Проучванията при животни са показали, че увеличението на плазмените нива на фексофенадин, наблюдавани след едновременното приложение с еритромицин или кетоконазол, вероятно се дължат на увеличаване съответно на стомашно-чревната резорбция и/ или на намаление на жлъчната екскреция, или на гастро-интестинална секреция .

Не е наблюдавано взаимодействие между фексофенадин и омепразол. Прилагането обаче на антиациди, съдържащи алуминиев и магнезиев хидроксид, 15 минути преди фексофенадин хидрохлорид е причинило намаление на бионаличността, най-вероятно дължащо се на свързване в стомашно-чревния тракт. Препоръчва се интервалът между приложението на фексофенадин хидрохлорид и антиацидите, съдържащи алуминиев и магнезиев хидроксид, да бъде не по-малък от 2 часа.

#### **4.6. Бременност и кърмене**

Няма достатъчно данни за употребата на fexofenadine hydrochloride при бременни жени. Ограничени проучвания при животни не откриват директни или индиректни ефекти по отношение на бременността, ембрионалното/феталното развитие, раждането и постнаталното развитие ( виж сек. 5.3). Fexofenadine hydrochloride не трябва да се използва по време на бременност, освен ако това е наложително.

#### **Кърмене**

Приложен при кърмачки, фексофенадин преминава в кърмата. Поради това фексофенадин хидрохлорид не се препоръчва за жени, които кърмят децата си.

#### **4.7. Ефект върху способността за шофиране или работа с машини**



Въз основа на фармакодинамичния профил и съобщените нежелани лекарствени събития малко вероятно е фексофенадин хидрохлорид таблетки да предизвикат ефект върху способността за шофиране или работа с машини. С помощта на обективни тестове е доказано, че Телфаст не оказва значително действие върху функцията на централната нервна система. Това означава, че пациентите могат да шофират или да изпълняват задачи, които изискват концентрация. За да се идентифицират обаче чувствителните лица, които имат необичайна реакция към лекарството, се препоръчва да се провери индивидуалния отговор преди шофиране или изпълняване на сложни задачи.

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

При контролирани клинични проучвания повечето често съобщавани нежелани събития са били главоболие (7.3%), сънливост (2.3%), гадене(1.5%), замайване (1.5%). Честотата на тези събития, наблюдавани с фексофенадин, е била подобна на честотата на наблюдаваните в групата с плацебо.

В редки случаи са съобщавани инциденти (с честота под 1%) при контролираните проучвания, подобни на тези при плацебо и от постмаркетингови проучвания, като: умора, безсъние, нервност и трудно заспиване или паронирия, като кошмари. В редки случаи са докладвани: обрив, уртикария, сърбеж и реакции на свръхчувствителност, проявени с ангиоедем, стягане в гърдите, диспнея, зачервяване на кожата и системна анафилаксия.

#### **4.9. Предозиране**

При предозиране с fexofenadine hydrochloride се съобщава за замайване, сънливост, отпадналост и сухота в устата. При възрастни индивиди са прилагани еднократни дози до 800 mg и дози до 690 mg два пъти дневно в продължение на 1 месец или 240 mg веднъж дневно в продължение на 1 година без развитие на клинично значими нежелани лекарствени реакции в сравнение с плацебо. Максималната толерирана доза на fexofenadine hydrochloride не е установявана.

За отстраняване на неабсорбирания продукт трябва да се предприемат стандартни мерки. Препоръчва се симптоматично и поддържащо лечение. Хемодиализата не отстранява ефективно fexofenadine hydrochloride от кръвта.

### **5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ**

#### **5.1. Фармакодинамични свойства**

Фармакотерапевтична група: антихистамин за системна употреба,  
АТС код R06A X26

Фексофенадин хидрохлорид е H1 антихистамин без седативно действие.  
Фексофенадин е фармакологично активен метаболит на терфенадин.



Проучванията по метода “wheal and flare” с хистамин при човека след прилагане на фексофенадин хидрохлорид веднъж или два пъти дневно показват, че лекарството притежава антихистаминов ефект, който започва след един час, достига максимума си на 6-ия час и продължава 24 часа. Няма данни за развитие на толерантност към тези ефекти след 28 дни лечение. Намерено е положително отношение доза-отговор между дози от 10 mg до 130 mg, приети перорално. При този модел на антихистаминова активност е намерено, че са необходими дози от най-малко 130 mg за достигане на постоянен ефект, който се поддържа над 24 часа. Максималното инхибиране в кожните участъци с уртики и хиперемия е било над 80%. Клиничните изпитвания, проведени при пациенти със сезонен алергичен ринит, са показали, че доза от 120 mg е достатъчна за поддържане на 24-часова ефективност.

Не са наблюдавани значими разлики в QT<sub>c</sub> интервалите в сравнение с плацебо при пациенти със сезонен алергичен ринит, получавали фексофенадин хидрохлорид до 240 mg два пъти дневно в продължение на 2 седмици. Не са наблюдавани значими разлики в сравнение с плацебо в QT<sub>c</sub> интервалите и при здрави доброволци, получавали фексофенадин хидрохлорид до 60 mg два пъти дневно в продължение на 6 месеца, 400 mg два пъти дневно в продължение на 6.5 дни и 240 mg веднъж дневно в продължение на 1 година. Фексофенадин в концентрации 32 пъти по-големи от терапевтичните при човека не е имал ефект върху забавени K<sup>+</sup> канали, клонирани от човешко сърце.

Фексофенадин хидрохлорид (5-10 mg/kg перорално) е инхибирал бронхоспазъма, индуциран от антиген, при сенсibiliзирани морски свинчета, а в супратерапевтични концентрации (10-100 μM) е инхибирал освобождаването на хистамин от перитонеални мастни клетки.

## 5.2. Фармакокинетични свойства

Фексофенадин хидрохлорид се резорбира бързо в организма след перорално приложение, като T<sub>max</sub> се достига приблизително 1-3 часа след приложението. Средната стойност на C<sub>max</sub> е приблизително 427 ng/ml след прилагане на доза от 120 mg веднъж дневно.

Фексофенадин се свързва с плазмените протеини в 60-70%. Фексофенадин се подлага на незначителен метаболизъм -чернодробен и извън чернодробен. Той е единственото основно съединение, идентифицирано в урината и фекалиите при животни и хора. Профилът на плазмените концентрации на фексофенадин следва биекспоненциална крива с крайно време на полуелиминиране от 11 до 15 часа след многократно приложение. Фармакокинетиката на фексофенадин след еднократно и многократно приложение е линейна за перорални дози до 120 mg два пъти дневно. Доза от 240 mg два пъти дневно дава малко по-голямо от пропорционалното увеличение (8.8%) на площта под кривата в равновесно състояние, което показва че фармакокинетиката на фексофенадин е практически линейна при дози между 40



mg и 240 mg дневно. Счита се, че жлъчната екскреция е основният път на елиминиране, като до 10% от приетата доза се екскретира в непроменен вид с урината.

### **5.3. Предклинични данни за безопасност**

Кучета са понасяли 450 mg/kg два пъти дневно в продължение на 6 месеца и не са показали признаци на токсичност с изключение на повръщане понякога. И при изследвания върху кучета и гризачи с еднократни дози не са наблюдавани находки, свързани с третирането.

Проучванията на тъканното разпределение с белязан фексофенадин хидрохлорид върху плъхове показва, че фексофенадин не преминава кръвно-мозъчната бариера.

Фексофенадин хидрохлорид не е показал мутагенен ефект при различни тестове за мутагенност *in vitro* и *in vivo*.

Канцерогенният потенциал на фексофенадин хидрохлорид е бил оценяван с помощта на поддържащи фармакокинетични изследвания на терфенадин, показващи експозиция на фексофенадин хидрохлорид (чрез плазмените стойности на AUC). Не са наблюдавани данни за канцерогенност при плъхове и мишки, третирани с терфенадин (до 150 mg/kg дневно).

## **6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ**

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

Сърцевина на таблетката

Microcrystalline cellulose, pregelatinised maize starch, croscarmellose sodium, magnesium stearate

Филмиращо покритие

Hypromellose, povidone, titanium dioxide (E171), colloidal silicon dioxide, Macrogol 400, iron oxide (pink;yellow).

### **6.2. Несъвместимости.**

Няма известни

### **6.3. Срок на годност**

36 месеца.

### **6.4. Специални предпазни мерки при съхранение**

Няма специални предпазни изисквания за съхранение.

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



Бели непрозрачни блистери от поливинилхлорид (фармацевтично качество) с дебелина 200 µm с филм от поливинилидин хлорид от 90 g/m<sup>2</sup> на вътрешната повърхност на блистера. PVC/PE/PVDC е запечатан към temperирано алуминиево фолио с дебелина 20 µm с винилово покритие. Блистерите са опаковани в картонени кутии.

Брой на таблетките в една опаковка: x 10;x 30,

**6.6. Специални инструкции за употреба**

Няма специални инструкции.

**7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

SANOFI-AVENTIS Deutschland GmbH, D-65926 Frankfurt am Main

**8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

20010554

**9. ДАТА НА ПЪРВОТО РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТРЕБА (ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО)**

12 06 2001

**10. ДАТА НА ПОСЛЕДНАТА РЕДАКЦИЯ НА ТЕКСТА**

МАРТ 2006

