

## Aerius®

R F<sub>f</sub>

### Organon Sweden

Filmdragerad tablett 5 mg

(Ljusblå, runda filmdragerade tabletter, märkta med bokstäverna "S" och "P" på ena sidan och släta på andra sidan.)

Antihistamin - H1 -antagonist

### Aktiv substans:

Desloratadin

### ATC-kod:

R06AX27

Läkemedel från Organon Sweden omfattas av Läkemedelsförsäkringen.

Läkemedlet distribueras också av företag som inte omfattas av Läkemedelsförsäkringen, se Förpackningar.

Texten nedan gäller för:

**Aerius®** filmdragerad tablett 5 mg;

**Aerius** oral lösning 0,5 mg/ml

**FASS-text:** *Denna text är avsedd för vårdpersonal.*

Texten är baserad på produktresumé: 09/2022

## Indikationer

*Filmdragerade tabletter 5 mg:*

Aerius är avsett för vuxna och ungdomar 12 år och äldre för lindring av symtom i samband med :

- allergisk rinit (se avsnitt Farmakodynamik)
- urtikaria (se avsnitt Farmakodynamik)

*Oral lösning 0,5 mg/ml:*

Aerius är avsett för vuxna, ungdomar och barn över 1 år för lindring av symtom i samband med:

- allergisk rinit (se avsnitt Farmakodynamik)
- urtikaria (se avsnitt Farmakodynamik)

## Kontraindikationer

Överkänslighet mot den aktiva substansen eller mot något hjälpämne som anges i avsnitt Innehåll eller mot loratadin.

## Dosering

### Dosering

#### **5 mg filmdragerade tabletter**

*Vuxna och ungdomar (12 år och äldre)* : Rekommenderad dos av Aeries är en tablett en gång dagligen.

Intermittent allergisk rinit (närvaro av symtom i mindre än 4 dagar per vecka eller i mindre än 4 veckor) ska behandlas i enlighet med bedömningen av patientens sjukdomshistoria och behandlingen kan avbrytas efter att symtom har upphört och återupptas när de återkommer.

Vid persisterande allergisk rinit (närvaro av symtom i 4 dagar eller mer per vecka och i mer än 4 veckor) kan kontinuerlig behandling rekommenderas till patienterna under de perioder de exponeras för allergen.

#### *Pediatrisk population*

Det finns begränsad erfarenhet av effekten av desloratadin från kliniska prövningar hos ungdomar mellan 12 och 17 år (se avsnitt Biverkningar och Farmakodynamik).

Säkerhet och effekt för Aeries 5 mg filmdragerade tabletter för barn under 12 år har inte fastställts.

#### **0,5 mg/ml oral lösning**

*Vuxna och ungdomar (12 år och äldre)*: Rekommenderad dos av Aeries är 10 ml (5 mg) oral lösning en gång dagligen.

#### *Pediatrisk population*

Förskrivaren ska vara medveten om att de flesta fall av rinit under 2 års ålder har infektiöst ursprung (se avsnitt Varningar och försiktighet) och att det saknas data som stöder behandling av infektiös rinit med Aeries.

Barn från 1 till och med 5 år: 2,5 ml (1,25 mg) Aeries oral lösning en gång dagligen.

Barn från 6 till och med 11 år: 5 ml (2,5 mg) Aeries oral lösning en gång dagligen.

Säkerhet och effekt för Aeries 0,5 mg/ml oral lösning för barn under 1 år har inte fastställts.

Det finns begränsad erfarenhet av effekten av desloratadin från kliniska prövningar hos barn mellan 1 och 11 år och ungdomar mellan 12 och 17 år (se avsnitt Biverkningar och Farmakodynamik).

Intermittent allergisk rinit (närvaro av symtom i mindre än 4 dagar per vecka eller i mindre än 4 veckor) ska behandlas i enlighet med bedömningen av patientens sjukdomshistoria och behandlingen kan avbrytas efter att symtom har upphört och återupptas när de återkommer.

Vid persisterande allergisk rinit (närvaro av symtom i 4 dagar eller mer per vecka och i mer än 4 veckor) kan kontinuerlig behandling rekommenderas till patienterna under de perioder de exponeras för allergen.

## Administreringssätt

*0,5 mg/ml oral lösning & 5 mg filmdragerade tabletter:* Oral användning. Dosen kan tas med eller utan mat.

## **Varningar och försiktighet**

### Nedsatt njurfunktion

Vid allvarligt nedsatt njurfunktion ska Aerius användas med försiktighet (se avsnitt Farmakokinetik).

### Krampanfall

Desloratadin ska administreras med försiktighet hos patienter med medicinsk eller familjär historia av krampanfall, främst hos yngre barn (se avsnitt Biverkningar), eftersom de är mer benägna att utveckla nya krampanfall vid behandling med desloratadin. Hälso- och sjukvårdspersonal kan överväga att avbryta desloratadin hos patienter som upplever ett krampanfall under behandling.

### ***5 mg filmdragerade tabletter:***

#### Aerius tabletter innehåller laktos

Patienter med sällsynta ärftliga tillstånd med galaktosintolerans, total laktasbrist eller glukos-galaktosmalabsorption ska inte använda detta läkemedel.

### ***0,5 mg/ml oral lösning:***

#### Aerius oral lösning innehåller sorbitol (E420)

Detta läkemedel innehåller 150 mg sorbitol (E420) per ml oral lösning.

Den sammantagna effekten av samtidig administrering av produkter vilka innehåller sorbitol (E420) (eller fruktos) och intag av sorbitol (E420) (eller fruktos) genom födointag ska beaktas. Innehåll av sorbitol (E420) i läkemedel för oral användning kan påverka biotillgängligheten för andra läkemedel för oral användning som administreras samtidigt.

Sorbitol är en källa till fruktos, patienter med hereditär fruktosintolerans (HFI) bör inte ta detta läkemedel.

#### Aerius oral lösning innehåller propylenglykol (E1520)

Detta läkemedel innehåller 100,75 mg propylenglykol (E1520) per ml oral lösning.

#### Aerius oral lösning innehåller natrium

Detta läkemedel innehåller mindre än 1 mmol (23 mg) natrium per dos, d.v.s. är näst intill "natriumfritt".

#### Aerius oral lösning innehåller bensylalkohol

Detta läkemedel innehåller 0,75 mg bensylalkohol per ml oral lösning.

Bensylalkohol kan orsaka anafylaktoida reaktioner.

Ökad risk för ackumulering hos små barn. Det är inte rekommenderat att användas mer än en vecka hos små barn (under 3 år).

Stora volymer ska användas med försiktighet och bara om nödvändigt, särskilt hos personer med nedsatt lever- eller njurfunktion eftersom det finns en risk för ackumulation vilket kan leda till metabolisk acidosis.

### Pediatrisk population

Hos barn under 2 år är diagnosen allergisk rinit speciellt svår att skilja från andra former av rinit. Frånvaro av övre luftvägsinfektion eller strukturella abnormiteter såväl som patienthistoria, fysisk undersökning och lämpliga laboratorie- och hudtester ska övervägas.

Ca 6 % av vuxna och barn 2 till 11 år är fenotypiskt långsamma metaboliserare av desloratadin och uppvisar en hög exponering (se avsnitt Farmakokinetik). Säkerheten av desloratadin hos barn 2 till 11 år med långsam metabolism är samma som hos barn med normal metabolism. Effekten av desloratadin hos barn < 2 år med långsam metabolism har inte studerats.

## **Interaktioner**

Några kliniskt betydelsefulla interaktioner har inte observerats i kliniska prövningar med desloratadintabletter när erytromycin eller ketokonazol gavs samtidigt (se avsnitt Farmakodynamik).

### Pediatrisk population

Interaktionsstudier har endast utförts på vuxna.

I en klinisk farmakologistudie ökade inte de negativa effekterna av alkohol på prestationsförmågan då Aerius tabletter gavs tillsammans med alkohol (se avsnitt Farmakodynamik). Dock, har fall av alkoholintolerans och alkoholförgiftning rapporterats vid användning efter marknadsintroduktionen. Därför rekommenderas försiktighet vid samtidigt intag med alkohol.

## **Graviditet**

En stor mängd data från gravida kvinnor (mer än 1 000 graviditeter) tyder inte på risk för missbildningstoxicitet och inte heller på foster/neonatal toxicitet av desloratadin. Djurstudier tyder inte på direkta eller indirekta reproduktionstoxikologiska effekter (se avsnitt Prekliniska uppgifter). Som försiktighetsåtgärd bör man undvika användning av Aerius under graviditet.

## **Amning**

Desloratadin har identifierats hos ammade nyfödda/spädbarn till kvinnor som behandlats. Effekten av desloratadin på nyfödda/spädbarn är inte känd. Ett beslut måste fattas om man ska avbryta amningen eller avbryta/avstå från behandling med Aerius efter att man tagit hänsyn till fördelen med amning för barnet och fördelen med behandling för kvinnan.

## **Fertilitet**

Det finns inga fertilitetsdata för män och kvinnor.

## **Trafik**

Aerius har ingen eller försumbar effekt på förmågan att framföra fordon och använda maskiner baserat på kliniska prövningar. Patienterna bör informeras om att de flesta personer inte känner sig dåliga. Eftersom det förekommer individuella skillnader i reaktion för alla läkemedel, bör patienterna trots det rekommenderas att inte utföra aktiviteter som kräver skärpt uppmärksamhet, såsom att framföra fordon eller använda maskiner, tills de vet hur de reagerar på läkemedlet.

## **Biverkningar**

### Sammanfattning av säkerhetsprofilen

I kliniska prövningar som omfattade vuxna och ungdomar, vid en rad olika indikationer inklusive allergisk rinit och kronisk idiopatisk urtikaria vid den rekommenderade dosen 5 mg dagligen, rapporterades biverkningar med Aerius tabletter hos 3 % fler patienter än vid placebobehandling. Av de biverkningar som rapporterats utöver placebo var trötthet (1,2 %), muntorrhet (0,8 %) och huvudvärk (0,6 %) vanligast.

#### Pediatrisk population

I en klinisk prövning med 578 ungdomar, mellan 12 och 17 år, var huvudvärk den vanligaste biverkningen; den förekom hos 5,9 % av de patienter som behandlades med desloratadin och hos 6,9 % av de patienter som fick placebo.

#### *0,5 mg/ml oral lösning:*

I kliniska studier på barn gavs desloratadin som beredningsformen sirap till totalt 246 barn i åldrarna 6 månader till 11 år. Den sammanlagda förekomsten av biverkningar hos barn 2 till 11 år var lika i grupperna med desloratadin och placebo. Hos spädbarn och mindre barn 6 till 23 månader var de mest frekvent rapporterade biverkningarna utöver placebo diarré (3,7 %), feber (2,3 %) och sömnlöshet (2,3 %). I en ytterligare studie sågs inga biverkningar hos patienter mellan 6 och 11 år efter en enstaka 2,5 mg dos desloratadin oral lösning.

#### Tabell över biverkningar

Frekvensen av biverkningar från kliniska prövningar som rapporterats utöver placebo och andra biverkningar som rapporterats efter marknadsintroduktionen redovisas i nedanstående tabell. Frekvenserna definieras som mycket vanliga ( $\geq 1/10$ ), vanliga ( $\geq 1/100$ ,  $< 1/10$ ), mindre vanliga ( $\geq 1/1\,000$ ,  $< 1/100$ ), sällsynta ( $\geq 1/10\,000$ ,  $< 1/1\,000$ ), mycket sällsynta ( $< 1/10\,000$ ) och ingen känd frekvens (kan inte beräknas från tillgängliga data).

| Organsystemklass                          | Frekvens                  | Biverkningar observerade med Aerius                                |
|-------------------------------------------|---------------------------|--------------------------------------------------------------------|
| <b>Metabolism och nutrition</b>           | Ingen känd frekvens       | Ökad aptit                                                         |
| <b>Psykiska störningar</b>                | Mycket sällsynta          | Hallucinationer                                                    |
|                                           | Ingen känd frekvens       | Avvikande beteende, aggression, nedstämdhet                        |
| <b>Centrala och perifera nervsystemet</b> | Vanliga                   | Huvudvärk                                                          |
|                                           | Vanliga (barn under 2 år) | Insomnia                                                           |
|                                           | Mycket sällsynta          | Yrsel, somnolens, insomnia, psyko motorisk hyperaktivitet, kramper |
| <b>Ögon</b>                               | Ingen känd frekvens       | Torra ögon                                                         |
| <b>Hjärtat</b>                            | Mycket sällsynta          | Takykardi, palpitationer                                           |
|                                           | Ingen känd frekvens       | QT-förlängning                                                     |
| <b>Magtarmkanalen</b>                     | Vanliga                   | Muntorrhet                                                         |
|                                           | Vanliga (barn under 2 år) | Diarré                                                             |
|                                           | Mycket sällsynta          |                                                                    |

|                                                                    |                           |                                                                                                   |
|--------------------------------------------------------------------|---------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------|
|                                                                    |                           | Buksmärtor, illamående, kräkningar, dyspepsi, diarré                                              |
| <b>Lever och gallvägar</b>                                         | Mycket sällsynta          | Förhöjda leverenzymmer, förhöjt bilirubin, hepatit                                                |
|                                                                    | Ingen känd frekvens       | Ikterus                                                                                           |
| <b>Hud och subkutan vävnad</b>                                     | Ingen känd frekvens       | Fotosensitivitet                                                                                  |
| <b>Muskuloskeletala systemet och bindväv</b>                       | Mycket sällsynta          | Myalgi                                                                                            |
| <b>Allmänna symtom och/eller symtom vid administreringsstället</b> | Vanliga                   | Trötthet                                                                                          |
|                                                                    | Vanliga (barn under 2 år) | Feber                                                                                             |
|                                                                    | Mycket sällsynta          | Överkänslighetsreaktioner (såsom anafylaxi, angioödem, dyspné, pruritus, hudutslag och urtikaria) |
|                                                                    | Ingen känd frekvens       | Asteni                                                                                            |
| <b>Undersökningar</b>                                              | Ingen känd frekvens       | Viktökning                                                                                        |

#### Pediatrisk population

Andra biverkningar rapporterades efter marknadsintroduktionen hos pediatriska patienter med ingen känd frekvens omfattar QT-förlängning, arytm, bradykardi, avvikande beteende och aggression.

En retrospektiv observationsstudie för att utvärdera säkerhet indikerade en ökad incidens av nydebuterade krampanfall hos patienter 0 till 19 år när de fick desloratadin jämfört med perioder utan att få desloratadin. Bland barn 0-4 år var den justerade absoluta ökningen 37,5 (95 % konfidensintervall (KI) 10,5-64,5) per 100 000 personår med en bakgrundsfrekvens av nydebuterade krampanfall på 80,3 per 100 000 personår. Bland patienter 5-19 år var den justerade absoluta ökningen 11,3 (95 % KI 2,3-20,2) per 100 000 personår med en bakgrundsfrekvens på 36,4 per 100 000 personår. (Se avsnitt Varningar och försiktighet.)

#### *Rapportering av misstänkta biverkningar*

Det är viktigt att rapportera misstänkta biverkningar efter att läkemedlet godkänts. Det gör det möjligt att kontinuerligt övervaka läkemedlets nytta-riskförhållande. Hälso- och sjukvårdspersonal uppmanas att rapportera varje misstänkt biverkning till Läkemedelsverket, men alla kan rapportera misstänkta biverkningar till Läkemedelsverket, [www.lakemedelsverket.se](http://www.lakemedelsverket.se). Postadress

Läkemedelsverket

Box 26

751 03 Uppsala

## Överdoser

Biverkningsprofilen i samband med överdosering, som setts efter marknadsintroduktionen, liknar den som ses vid terapeutiska doser, men omfattningen av effekterna kan vara större.

### Behandling

Vid överdosering ska gängse metoder för att avlägsna oabsorberad aktiv substans övervägas. Symtomatisk och understödjande behandling rekommenderas.

Desloratadin elimineras inte genom hemodialys. Det är inte känt om det elimineras genom peritoneal dialys.

### Symtom

Baserat på en klinisk flerdosstudie, i vilken 45 mg desloratadin gavs (nio gånger den kliniska dosen), sågs inga kliniskt relevanta effekter.

### Pediatrik population

Biverkningsprofilen i samband med överdosering, som setts efter marknadsintroduktionen, liknar den som ses vid terapeutiska doser, men omfattningen av effekterna kan vara större.

## **Farmakodynamik**

### Verkningsmekanism

Desloratadin är en icke-sederande, långtidsverkande histaminantagonist med selektiv perifer  $H_1$ -receptorantagonistaktivitet. Efter oral administrering blockerar desloratadin selektivt perifera histamin  $H_1$ -receptorer då substansen hindras att gå över till centrala nervsystemet.

Desloratadin har visat sig ha antiallergiska egenskaper i *in vitro* studier. Dessa omfattar hämning av frisättning av proinflammatoriska cytokiner såsom IL-4, IL-6, IL-8 och IL-13 från humana mastceller/basofiler, liksom hämning av uttryck av adhesionsmolekylen P-selektin på endotelceller. Den kliniska betydelsen av dessa iakttagelser har ännu inte bekräftats.

### Klinisk effekt och säkerhet

I en klinisk prövning med upprepad dosering till vuxna och ungdomar, där upp till 20 mg desloratadin gavs dagligen i 14 dagar, sågs inga kliniskt betydelsefulla kardiovaskulära effekter. I en klinisk prövning, där desloratadin gavs i en dos på 45 mg dagligen (nio gånger den kliniska dosen) i tio dagar, sågs ingen förlängning av QTc-intervall.

Inga kliniskt relevanta förändringar av desloratadins plasmakoncentrationer observerades i interaktionsstudier med upprepad dosering av ketokonazol och erytromycin.

### Farmakodynamisk effekt

Desloratadin penetrerar med svårighet det centrala nervsystemet. Vid den rekommenderade dosen 5 mg dagligen förekom ingen ökad incidens av somnolens jämfört med placebo. När Aeries gavs i en daglig dos på 7,5 mg påverkades inte den psykomotoriska funktionen i kliniska prövningar. I en singeldosstudie utförd på vuxna påverkade inte 5 mg desloratadin resultaten av standardtester för prestationsförmåga vid flygning, i vilka ingick uppgifter relaterade till flygning samt subjektiv sömnhet.

I kliniska farmakologistudier ökade inte samtidigt intag av alkohol den alkoholinducerade försämringen av prestationsförmågan eller ökningen av sömnheten. Inga signifikanta skillnader fanns i de psykomotoriska testresultaten mellan desloratadin- och placebogrupperna, oavsett om de givits ensamma eller tillsammans med alkohol.

Hos patienter med allergisk rinit lindrade Aeries effektivt symtom såsom nysningar, rinnande och kliande näsa liksom kliande, rinnande och röda ögon och gomklåda. Aeries kontrollerade effektivt symtomen i 24 timmar.

Förutom de vedertagna klassificeringarna av säsong- och helårsrinit, kan allergisk rinit även klassificeras som intermittent allergisk rinit och persisterande allergisk rinit beroende på symtomens varaktighet. Intermittent allergisk rinit definieras som närvaro av symtom i mindre än 4 dagar per vecka eller i mindre än 4 veckor. Persisterande allergisk rinit definieras som närvaro av symtom i 4 dagar eller mer per vecka och i mer än 4 veckor.

Aeries tabletter lindrade effektivt symtomen från säsongsbunden allergisk rinit, vilket framkommer av den totala skattningen i ett livskvalitetsformulär vid rinokonjunktivit. Den största förbättringen såg man beträffande "praktiska problem" och "dagliga aktiviteter" som begränsats av symtom.

Kronisk idiopatisk urtikaria studerades som en klinisk modell för urtikariella tillstånd, eftersom den underliggande patofysiologin är likartad, oavsett etiologi och eftersom kroniska patienter lättare kan rekryteras prospektivt. Eftersom histaminfrisättning är en bakomliggande orsak vid alla urtikariella sjukdomar, förväntas desloratadin ge effektiv symtomlindring vid andra urtikariella tillstånd, utöver kronisk idiopatisk urtikaria, såsom anges i kliniska riktlinjer.

I två placebokontrollerade sexveckorsstudier på patienter med kronisk idiopatisk urtikaria minskade Aeries effektivt klåda och storleken på och antalet nässelutslag vid slutet av det första doseringsintervallet. I alla studier bibehölls effekterna under det 24 timmar långa doseringsintervallet. Som i andra prövningar med antihistaminer vid kronisk idiopatisk urtikaria exkluderades de fåtal patienter som inte svarade på antihistaminer. Förbättring av pruritus med mer än 50 % sågs hos 55 % av de patienter som behandlades med desloratadin jämfört med 19 % av de patienter som behandlades med placebo. Behandling med Aeries minskade också signifikant påverkan på sömnen och funktionerna under dagtid, mätt med en fyrapunktskala som användes för att utvärdera dessa variabler.

#### Pediatrisk population

Effekten av Aeries tabletter har inte tydligt visats i prövningar på ungdomar mellan 12 och 17 år.

#### *0,5 mg/ml oral lösning:*

Effekten av Aeries oral lösning har inte undersökts i särskilda studier på barn. Säkerheten hos desloratadin i beredningsformen sirap, som innehåller samma koncentration av desloratadin som Aeries oral lösning, har emellertid visats i tre barnstudier. Barn i åldern 1-11 år för vilka antihistaminbehandling ansågs lämplig erhöll en daglig desloratadindos på 1,25 mg (1 till och med 5 år) eller 2,5 mg (6 till och med 11 år). Behandlingen tolererades väl vilket visades med hjälp av kliniska laborietester, vitala tecken och EKG-intervalldata inklusive QTc. När desloratadin gavs i rekommenderad dos var plasmakoncentrationerna (se avsnitt Farmakokinetik) jämförbara i pediatrika och vuxna populationer. Eftersom förloppet för allergisk rinit/kronisk idiopatisk urtikaria och desloratadins profil är snarlika hos vuxna och barn kan därför effektdata för desloratadin extrapoleras till den pediatrika populationen.

Effekten av Aeries sirap har inte undersökts i prövningar på barn yngre än 12 år.

## **Farmakokinetik**

#### Absorption

Plasmanivåer av desloratadin kan uppmätas inom 30 minuter efter dosering. Desloratadin absorberas väl och maximal koncentration uppnås efter cirka 3 timmar; halveringstiden i den terminala fasen är cirka

27 timmar. Graden av ackumulering av desloratadin överensstämde med dess halveringstid (cirka 27 timmar) och en dosering om en gång dagligen. Biotillgängligheten för desloratadin var proportionell mot dosen i intervallet 5 mg till 20 mg.

I en farmakokinetisk studie i vilken demografiska patientdata var jämförbara med data i den allmänna säsongsbundna allergiska rinit-populationen erhöll 4 % av individerna högre koncentration desloratadin. Denna procentsiffra kan variera beroende på etnisk bakgrund. Maximal koncentration av desloratadin var cirka 3 gånger högre efter cirka 7 timmar med en halveringstid i den terminala fasen på cirka 89 timmar. Säkerhetsprofilen hos dessa individer skiljde sig inte från den hos den allmänna befolkningen.

I en serie farmakokinetiska och kliniska studier uppnådde 6 % av individerna högre koncentration av desloratadin. Prevalensen av denna fenotyp med långsam metabolisering var jämförbar för vuxna (6 %) och barn 2 till 11 år (6 %) och högre för svarta (18 % vuxna, 16 % barn) än för kaukasier (2 % vuxna, 3 % barn) i båda populationerna, dock skiljde sig inte säkerhetsprofilen hos dessa individer från den hos den allmänna populationen.

I en farmakokinetisk flerdosstudie med tabletten, genomförd på friska vuxna individer, fann man att fyra individer hade långsam metabolisering av desloratadin. Dessa individers  $C_{\max}$ -koncentration var ungefär 3 gånger högre efter cirka 7 timmar med en halveringstid i den terminala fasen på cirka 89 timmar.

Jämförbara farmakokinetiska parametrar observerades i en flerdos farmakokinetisk studie utförd med sirap en hos barn 2 till 11 år med långsam metabolism som diagnostiserats med allergisk rinit. Exponeringen (AUC) av desloratadin var ungefär 6 gånger högre och  $C_{\max}$  ungefär 3 till 4 gånger högre vid 3-6 timmar med en halveringstid i den terminala fasen av cirka 120 timmar. Exponeringen var densamma hos vuxna respektive barn med långsam metabolism när de behandlades med doser i enlighet med deras ålder. Den sammanlagda säkerhetsprofilen hos dessa individer skiljde sig inte från den allmänna populationen. Effekten av desloratadin hos barn < 2 år med långsam metabolism har inte studerats.

I separata singeldosstudier vid rekommenderade doser hade pediatrika patienter AUC och  $C_{\max}$ -värden för desloratadin jämförbara med de hos vuxna som erhöll 5 mg desloratadin sirap.

### Distribution

Desloratadin binds måttligt (83 % - 87 %) till plasmaproteiner. Det saknas bevis för kliniskt signifikant ackumulering av läkemedlet efter dosering en gång dagligen av desloratadin (5 mg till 20 mg) i 14 dagar till vuxna och ungdomar.

### Metabolism

Det enzym som svarar för metaboliseringen av desloratadin har inte identifierats än och därför kan interaktioner med andra läkemedel inte helt uteslutas. Desloratadin hämmar inte CYP3A4 *in vivo* och studier *in vitro* har visat att läkemedlet inte hämmar CYP2D6 och inte heller är ett substrat för eller en hämmare av P-glykoprotein.

I en cross-over singeldosstudie med desloratadin befanns tabletterna och sirapen bioekvivalenta.

### *0,5 mg/ml oral lösning:*

Eftersom Aeri<sup>us</sup> oral lösning innehåller samma koncentration av desloratadin krävdes ingen bioekvivalensstudie och den förväntas vara ekvivalent med sirap och tabletter.

### Eliminering

I en singeldosstudie med 7,5 mg desloratadin påverkades inte fördelningen av desloratadin efter födointag (fettrik, kaloririk frukost). I en annan studie hade grapefruktjuice ingen effekt på fördelningen av desloratadin.

#### Patienter med nedsatt njurfunktion

Farmakokinetiken för desloratadin hos patienter med kronisk nedsatt njurfunktion jämfördes med den hos friska försökspersoner i en singeldosstudie och en studie med upprepad dosering. I singeldosstudien var exponeringen av desloratadin cirka 2 gånger högre hos individer med mild till måttlig nedsatt njurfunktion respektive cirka 2,5 gånger högre hos individer med allvarligt nedsatt njurfunktion, jämfört med den hos friska individer. I studien med upprepad dosering, uppnåddes steady state efter dag 11. Hos friska individer var exponeringen för desloratadin cirka 1,5 gånger högre hos individer med mild till måttlig nedsatt njurfunktion och cirka 2,5 gånger högre hos individer med allvarligt nedsatt njurfunktion. I båda studierna var förändringar i exponering (AUC och  $C_{\max}$ ) av desloratadin och 3-hydroxydesloratadin inte kliniskt relevant.

## Prekliniska uppgifter

Desloratadin är den huvudsakliga aktiva metaboliten av loratadin. Prekliniska studier utförda med desloratadin och loratadin visade att det inte föreligger några kvalitativa eller kvantitativa skillnader i den toxikologiska profilen för desloratadin och loratadin vid jämförbara exponeringsnivåer med desloratadin.

Gängse studier avseende säkerhetsfarmakologi, allmäntoxicitet, gentoxicitet, karcinogenicitet, reproduktionseffekter och effekter på utveckling visade inte några särskilda risker för människa. Avsaknad av karcinogenicitet har visats i studier som utförts med desloratadin och loratadin.

## Innehåll

*1 filmdragerad 5 mg tablett innehåller:*

5 mg desloratadin, kalciumvätefosfatdihydrat, mikrokristallin cellulosa, majsstärkelse, talk, laktosmonohydrat, hypromellos, titandioxid, makrogol 400, indigotin (E132), karnaubavax, vitt vax.

*1 ml oral lösning innehåller:*

0,5 mg desloratadin (0,5 mg/ml), sorbitol (E420), propylenglykol (1520), sukralos (E 955), hypromellos 2910, natriumcitratdihydrat, naturliga och artificiella smakämnen (bubbelgum, vilken innehåller propylenglykol (E1520) och bensylalkohol), vattenfri citronsyra, dinatriumedetat, renat vatten.

## Blandbarhet

Ej relevant.

## Hållbarhet, förvaring och hantering

**Hållbarhet**

2 år

#### **Särskilda förvaringsanvisningar**

*Filmdragerade tabletter 5 mg:*

Förvaras vid högst 30 °C. Förvaras i originalförpackningen.

*Oral lösning 0,5 mg/ml:*

Får ej frysas. Förvaras i originalförpackningen.

## Särskilda anvisningar för destruktion

Inga särskilda anvisningar.

## Egenskaper hos läkemedelsformen

### 5 mg filmdragerade tabletter

Ljusblå, runda filmdragerade tabletter, märkta med bokstäverna "S" och "P" på ena sidan och släta på andra sidan. Den filmdragerade tabletten är 6,5 mm i diameter.

### 0,5 mg/ml oral lösning

Oral lösning är en klar, färglös lösning.

## Förpackningsinformation

AERIUS®

*Filmdragerad tablett 5 mg* Ljusblå, runda filmdragerade tabletter, märkta med bokstäverna "S" och "P" på ena sidan och släta på andra sidan.

30 styck blister, 87:23, F, Övriga förskrivare: sjuksköterska

100 styck blister, 162:54, F, Övriga förskrivare: sjuksköterska

10 styck blister (fri prissättning), *tillhandahålls ej*

AERIUS

*Oral lösning 0,5 mg/ml* Oral lösning

120 milliliter flaska, 130:98, F, Övriga förskrivare: sjuksköterska

Följande produkter har även parallelldistribuerade förpackningar:

Filmdragerad tablett 5 mg

Oral lösning 0,5 mg/ml