

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Fexofast 120 mg, 120 mg, tabletki powlekane

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Każda tabletki powlekana zawiera 120 mg feksofenadyny chlorowodorku, co odpowiada 112 mg feksofenadyny.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletka powlekana

Podłużna, dwuwypukła tabletki powlekana koloru brzoskwiniowego, o wymiarach 14,9-15,3 mm x 6,4-6,8 mm, gładka po obu stronach.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Łagodzenie objawów sezonowego alergicznego zapalenia błony śluzowej nosa.

Fexofast 120 mg jest wskazany do stosowania u dorosłych i dzieci w wieku 12 lat i starszych.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Feksofenadyna jest farmakologicznie czynnym metabolitem terfenadyny.

Dawkowanie

Dorośli

Zalecana dawka to 120 mg feksofenadyny chlorowodorku raz na dobę, przed posiłkiem.

Dzieci i młodzież

Dzieci w wieku 12 lat i starsze:

Zalecana dawka to 120 mg feksofenadyny chlorowodorku raz na dobę, przed posiłkiem.

Dzieci w wieku poniżej 12 lat:

Skuteczność i bezpieczeństwo stosowania 120 mg feksofenadyny chlorowodorku nie były badane u dzieci w wieku poniżej 12 lat.

Dzieci w wieku od lat 6 do 11 lat:

tabletki zawierające 30 mg feksofenadyny chlorowodorku są odpowiednią postacią do podawania i dawkowania w tej grupie pacjentów.

Pacjenci z niewydolnością wątroby, nerek lub pacjenci w podeszłym wieku

Badania dotyczące stosowania produktu leczniczego w specjalnych grupach pacjentów jak: pacjenci w podeszłym wieku, z zaburzeniami czynności wątroby lub nerek dowodzą, że nie jest konieczne dostosowywanie dawki feksofenadyny chlorowodorku w tych grupach pacjentów.

4.3 Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na substancję czynną lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Jak dla większości nowych produktów leczniczych, dostępne są jedynie ograniczone dane dotyczące stosowania produktu leczniczego u osób w podeszłym wieku oraz u pacjentów z zaburzeniami czynności nerek lub wątroby. Feksofenadyny chlorowodorek należy stosować ostrożnie w tych grupach pacjentów.

Pacjenci z chorobą układu sercowo-naczyniowego występującą obecnie lub w wywiadzie powinni zostać ostrzeżeni, że leki antyhistaminowe mogą wywoływać niepożądane działania takie jak tachykardia i zaburzenia rytmu serca (patrz punkt 4.8).

Produkt leczniczy zawiera mniej niż 1 mmol (23 mg) sodu w tabletkce powlekanej Fexofast 120 mg, to znaczy, że produkt uznaje się za „wolny od sodu”.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Feksofenadyna nie ulega biotransformacji wątrobowej i dlatego nie wchodzi w interakcję z innymi produktami leczniczymi metabolizowanymi w wątrobie. Stwierdzono, że jednoczesne stosowanie feksofenadyny chlorowodoru i erytromycyny lub ketokonazolu powoduje 2-3-krotne zwiększenie stężenia feksofenadyny w osoczu. Zmiany te nie wpływały na długość odcinka QT w zapisie EKG ani nie wywoływały większej ilości działań niepożądanych w porównaniu z monoterapią.

Badania na zwierzętach wykazały, że wzrost stężenia feksofenadyny w osoczu przy jednoczesnym podaniu erytromycyny lub ketokonazolu, wydaje się być spowodowany zwiększeniem wchłaniania w przewodzie pokarmowym oraz odpowiednio spadkiem wydalania z żółcią lub spadkiem wydzielania żółdkowo-jelitowego.

Nie zaobserwowano interakcji pomiędzy feksofenadyną i omeprazolem. Jednakże podawanie leków zobojętniających kwas solny w żołądku, zawierających wodorotlenek glinu i magnezu 15 minut przed przyjęciem feksofenadyny chlorowodoru, powodowało zmniejszenie biodostępności feksofenadyny, najprawdopodobniej z powodu jej wiązania w przewodzie pokarmowym. Zaleca się zachowanie 2 godzin przerwy między zażyciem leków zobojętniających kwas solny w żołądku zawierających wodorotlenek glinu i magnezu, a podaniem feksofenadyny chlorowodoru.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

Brak danych dotyczących stosowania feksofenadyny chlorowodoru u kobiet w ciąży. Ograniczone badania na zwierzętach nie wykazały bezpośredniego ani pośredniego szkodliwego wpływu na przebieg ciąży, rozwój zarodka/płodu, przebieg porodu czy rozwój pourodzeniowy (patrz punkt 5.3). Feksofenadyny chlorowodorek nie powinien być stosowany w okresie ciąży, chyba, że jest to bezwzględnie konieczne.

Karmienie piersią

Brak danych dotyczących stężenia w mleku kobiecym po przyjęciu feksofenadyny chlorowodoru. Jednakże po podaniu terfenadyny matkom karmiącym piersią stwierdzono, że feksofenadyna przenika do mleka kobiecego. Dlatego też nie zaleca się podawania feksofenadyny chlorowodoru matkom karmiącym piersią.

Płodność

Brak danych dotyczących wpływu feksofenadyny chlorowodoru na płodność u ludzi. Badania przeprowadzone na myszach nie wykazują szkodliwego wpływu feksofenadyny chlorowodoru na reprodukcję (patrz punkt 5.3).

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Na podstawie profilu farmakodynamicznego oraz zgłoszonych działań niepożądanych wydaje się mało prawdopodobne, aby feksofenadyny chlorowodorek wywierał wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn.

W przeprowadzonych testach Fexofast 120 mg nie wykazywał znaczącego wpływu na funkcjonowanie ośrodkowego układu nerwowego. Oznacza to, że pacjenci mogą prowadzić pojazdy lub wykonywać zadania wymagające koncentracji. Jednakże przed prowadzeniem pojazdów i wykonywaniem skomplikowanych zadań zaleca się ustalenie indywidualnej reakcji na produkt leczniczy, w celu zidentyfikowania osób wrażliwych, u których występuje nietypowa reakcja na produkty lecznicze.

4.8 Działania niepożądane

Częstość możliwych działań niepożądanych wymienionych poniżej określono następująco:

- bardzo często ($\geq 1/10$);
- często ($\geq 1/100$ do $< 1/10$);
- niezbyt często ($\geq 1/1\ 000$ do $< 1/100$);
- rzadko ($\geq 1/10\ 000$ do $< 1/1\ 000$);
- bardzo rzadko ($< 1/10\ 000$);
- nieznaną (częstość nie może być określona na podstawie dostępnych danych).

W obrębie każdej grupy dotyczącej częstości występowania, działania niepożądane zostały uszeregowane od najcięższych to najlżejszych.

W trakcie badań klinicznych z udziałem dorosłych zgłaszano następujące działania niepożądane, występujące z częstością podobną do grupy placebo:

Zaburzenia układu nerwowego

Często: bóle głowy, senność, zawroty głowy

Zaburzenia żołądkowo-jelitowe

Często: nudności

Zaburzenia ogólne i w miejscu podania

Niezbyt często: zmęczenie

U pacjentów dorosłych w trakcie badań po wprowadzeniu leku do obrotu zgłaszano następujące działania niepożądane (częstość występowania nie może być określona na podstawie dostępnych danych):

Zaburzenia układu immunologicznego

reakcje nadwrażliwości z objawami, takimi jak: obrzęk naczynioruchowy, uczucie ucisku w klatce piersiowej, duszność, nagłe zaczerwienienie skóry i uogólnione objawy anafilaksji

Zaburzenia psychiczne

bezsenność, nerwowość, zaburzenia snu lub koszmary sennne/wyraziste sny

Zaburzenia układu sercowo-naczyniowego
tachykardia, zaburzenia rytmu serca

Zaburzenia żołądkowo-jelitowe
biegunka

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej
wysypka, pokrzywka, świąd

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych

Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych

Al. Jerozolimskie 181C

02-222 Warszawa

Tel.: +48 22 49 21 301

Faks: +48 22 49 21 309

Strona internetowa: <https://smz.ezdrowie.gov.pl>

Działania niepożądane można zgłaszać również podmiotowi odpowiedzialnemu.

4.9 Przedawkowanie

W przypadku przedawkowania feksofenadyny chlorowodorku zgłaszano działania niepożądane takie jak: zawroty głowy, senność, zmęczenie i suchość w jamie ustnej. W porównaniu z grupą placebo podawanie zdrowym dorosłym ochotnikom pojedynczych dawek do 800 mg i dawek do 690 mg dwa razy na dobę przez miesiąc lub 240 mg raz na dobę przez rok, nie powodowało klinicznie istotnych działań niepożądanych. Nie określono maksymalnej tolerowanej dawki feksofenadyny chlorowodorku.

W przypadku przedawkowania, należy rozważyć zastosowanie standardowych środków, w celu usunięcia niewchłoniętego produktu leczniczego. Zaleca się leczenie objawowe i podtrzymujące. Hemodializa nie usuwa skutecznie feksofenadyny chlorowodorku z krwi.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: Inne leki przeciwhistaminowe do stosowania ogólnego, kod ATC: R06AX26

Mechanizm działania

Feksofenadyny chlorowodorek jest lekiem przeciwhistaminowym, blokującym receptory H₁, nie wywołującym działania uspokajającego. Feksofenadyna jest farmakologicznie czynnym metabolitem terfenadyny.

Skuteczność kliniczna i bezpieczeństwo

W badaniach przeprowadzonych na modelu reakcji skórnej u ludzi, wywołanej przez histaminę (pęcherze i zaczerwienienia), podawano raz lub dwa razy na dobę dawkę feksofenadyny chlorowodorku. Badania te wykazały, że działanie przeciwhistaminowe produktu leczniczego rozpoczyna się w ciągu 1 godziny od podania, osiąga maksimum działania w ciągu 6 godzin i utrzymuje się przez 24 godziny. Nie stwierdzono przypadków rozwoju tolerancji na produkt leczniczy

po 28 dniach leczenia. Stwierdzono również pozytywną zależność pomiędzy dawką a reakcją podczas stosowania dawek, podawanych doustnie, z zakresu od 10 mg do 130 mg feksofenadyny chlorowodoru. W tym modelu działania antyhistaminowego wykazano, że dla uzyskania stałego działania utrzymującego się dłużej niż 24 godziny, niezbędne było podanie dawki wynoszącej przynajmniej 130 mg feksofenadyny chlorowodoru. Maksymalne hamowanie reakcji skórnej wynosiło więcej niż 80%.

W badaniach klinicznych dotyczących leczenia sezonowego alergicznego zapalenia błony śluzowej nosa wykazano, że dawka 120 mg była wystarczająca do zapewnienia skutecznego działania przez 24 godziny.

W porównaniu z grupą placebo, u pacjentów z sezonowym alergicznym zapaleniem błony śluzowej nosa, leczonych feksofenadyny chlorowodorkiem w dawce do 240 mg dwa razy na dobę przez dwa tygodnie, nie zaobserwowano znaczących zmian odstępu QT_C. W porównaniu z grupą placebo, nie stwierdzono również żadnych istotnych zmian odstępu QT_C u zdrowych ochotników, którzy otrzymywali do 60 mg feksofenadyny chlorowodoru dwa razy na dobę przez 6 miesięcy, 400 mg dwa razy na dobę przez 6,5 dnia oraz 240 mg raz na dobę przez rok. Feksofenadyna w stężeniach 32 razy większych niż stężenia terapeutyczne u ludzi nie wpływała na wolne kanały potasowe, sklonowane z ludzkiego mięśnia sercowego.

Feksofenadyny chlorowodorek po podaniu doustnym (5-10 mg/kg masy ciała), hamował indukowany antygenem skurcz oskrzeli u uczulonych świnek morskich. W stężeniach większych niż terapeutyczne (10-100 μM) feksofenadyny chlorowodorek hamował uwalnianie histaminy z otrzewnowych komórek tucznych.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Wchłanianie

Feksofenadyny chlorowodorek jest szybko wchłaniany po podaniu doustnym. T_{max} osiągane jest po około 1-3 godzinach po podaniu dawki produktu leczniczego. Po podaniu dawki 120 mg raz na dobę średnia wartość C_{max} wynosiła około 427 ng/ml.

Dystrybucja

Feksofenadyna wiąże się z białkami osocza w 60-70%.

Metabolizm

Feksofenadyna metabolizowana jest tylko w znikomym stopniu (w wątrobie lub poza wątrobą) i jest jedynym głównym związkiem wykrywanym w moczu i w kale zwierząt i ludzi.

Stężenie feksofenadyny w osoczu zmniejsza się w sposób dwuwykładniczy, z końcowym okresem półtrwania wynoszącym 11 do 15 godzin po podaniu wielokrotnym. Farmakokinetyka feksofenadyny po jednorazowym lub wielokrotnym podaniu jest liniowa w zakresie dawek doustnych do 120 mg dwa razy na dobę. Przy dawce 240 mg podawanej dwa razy na dobę zaobserwowano nieco większe (8,8%) niż proporcjonalne zwiększenie pola pod krzywą w stanie stacjonarnym, co może wskazywać na to, że farmakokinetyka feksofenadyny jest liniowa w zakresie dawek 40-240 mg na dobę.

Eliminacja

Przypuszcza się, że główną drogą eliminacji jest wydalanie z żółcią, natomiast do 10% podanej dawki wydalane jest w postaci niezmienionej z moczem.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Psy tolerowały dawki 450 mg/kg podawane dwa razy na dobę przez 6 miesięcy i nie stwierdzono u nich objawów toksyczności, z wyjątkiem sporadycznie występujących wymiotów. Sekcje psów i gryzoni nie wykazały zmian związanych z podawaniem pojedynczej dawki leku.

W badaniach dotyczących dystrybucji tkankowej znakowanego radioaktywnie feksofenadyny chlorowodoru przeprowadzonych na szczurach wykazano, że feksofenadyna nie przenika przez barierę krew-mózg.

Feksofenadyny chlorowodorek nie wykazał działania mutagennego w różnych testach mutagenności *in vitro* i *in vivo*.

Potencjalne działanie rakotwórcze feksofenadyny chlorowodoru oceniano w badaniach nad terfenadyną z zastosowaniem testów farmakokinetycznych, w których określono narażenie na feksofenadyny chlorowodorek (na podstawie wartości AUC w osoczu). Nie stwierdzono działania rakotwórczego u szczurów i myszy, którym podawano terfenadynę (do 150 mg/kg/dobę).

W badaniu toksycznego wpływu na reprodukcję przeprowadzonym na myszach, feksofenadyny chlorowodorek nie zaburzał płodności, nie wykazywał działania teratogennego i nie zaburzał rozwoju przed- i pourodzeniowego.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Rdzeń tabletki:

Celuloza mikrokryształiczna
Kroskarmeloza sodowa
Skrobia kukurydziana
Powidon
Magnezu stearynian

Otoczka:

Opadry 03C54667 Pink o składzie:
Hypromeloza 6 cP (E 464)
Tytanu dwutlenek (E 171)
Makrogol 400
Makrogol 4 000
Żelaza tlenek żółty (E 172)
Żelaza tlenek czerwony (E 172)

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

3 lata

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Brak specjalnych zaleceń dotyczących przechowywania produktu leczniczego.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Blistry PVC/PVDC/Aluminium w tekturowym pudełku.
7, 10, 20, 30 tabletek w opakowaniu.

Nie wszystkie rodzaje opakowań muszą znajdować się w obrocie.

6.6. Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania

Wszelkie niewykorzystane resztki produktu leczniczego lub jego odpady należy usunąć zgodnie z lokalnymi przepisami.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

PHARMALAB POLAND Sp. z o.o.
ul. Siemianowicka 84
41-902 Bytom

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

14245

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU I DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 12 grudzień 2007 r.
Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 21 maj 2012 r.

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO