إيرياليرج ®

ديسلوراتادين

الوصف:

كل قرص من إيرياليرج® يحتوي على 5 ملغم من الديسلوراتادين.

المواد غير الفعالة:

مانيتول، سيليولوز دقيق البلورية، نشا غليكولات الصوديوم، ثاني أكسيد السيليكون الغروي، ستيرات المغنيسيوم، أوبادري أبيض، لون FD&C أزرق# 1، لون FD&C أحمر # 40، جليكول متعدد الإثيلين، ماء منقى.

التأثير:

الديسلوراتادين مضاد للهيستامين، طويل المفعول، لا يسبب النعاس، ذو تأثير مضاد للمستقبلات هـ₁ الطرفية. وقد أوضح الديسلوراتادين تأثير مضاد للحساسية ومضاد للهيستامين ومضاد للالتهاب.

دراسات السمية قبل السريرية:

ديسلوراتادين هو المستقلب الفعال الابتدائي اللوراتادين. وقد أوضحت الدراسات قبل السريرية التي تمت على الديسلوراتادين أن لا يوجد فروق كمية أو كيفية في السيماء السمي للديسلوراتادين واللوراتادين عند مستويات متقاربة عند التعرض للديسلوراتادين، تشير البيانات قبل الإكلينيكية مع الديسلوراتادين إلى عدم وجود مخاطر خاصة على الإنسان بناء على الدراسات التقليدية عن الأمان الدوائي، وسمية الجرعة المتكررة، والسمية الجينية، والسمية على التناسل. وقد تم إثبات عدم وجود قدرة على السرطنة على الدراسات التي تم إجراؤها مع لوراتادين.

الفارماكولوجيا الإكلينيكية:

خصائص فعل العقار:

بعد تناول الديسلوراتادين عن طريق الفم، يقوم اختياريا بحصر مستقبلات هـ₁ الطرفية الهيستامين وهذا بسبب انه يُمنع العقار من الوصول إلى الجهاز العصبي المركزي. بالإضافة إلى نشاط المضاد للهيستامين، فأن الديسلوراتادين أظهر نشاط مضاد للحساسية ومضاد للالتهاب في المختبر (تمت على خلايا من أصل إنساني) وأيضا في دراسات الكائن الحي. وقد أوضحت هذه الدراسات أن الديسلوراتادين يمنع الأحداث التي تبدأ وتنشر الالتهابات التحسسية متضمنة:

- إفراز السيتوكينز المسبب للالتهاب (IL-4, IL-6, IL-8, IL-13).
- إفراز الكيموكينز المسبب الهام للالتهاب كالرانتز (تُنظم عند التنشيط خلايا الـT العادية المفرزة).
- إفراز انيون السوبر اوكسيد عن طريق الكريات المفصصة النووية المنشطة.
- التصاق الايوسين والانجذاب الكيميائي.
- انحسار جزيئات الالتصاق كال P-Selectin.
- إفراز الهيستامين المعتمد على IgE والبروستاجلاندين (PGD2) والليكوترين (LTC4).
- استجابة المضيق القصبي التحسسي الحاد والسعال التحسسي في النموذج الحيواني.

في تجربة إكلينيكية ذات جرعات متعددة، حيث أعطي 20 ملغم من الديسلوراتادين يوميا لمدة 14 يوم لم يلاحظ أي آثار قلبية وعائية ذات قيمة إكلينيكيا وفي تجربة إكلينيكية فارماكولوجية حيث أعطي ديسلوراتادين بجرعة 45ملغم/يوميا (9 أضعاف الجرعة الإكلينيكية) لمدة عشرة أيام، لم يلاحظ أي إطالة في زمن الـ QTC، الديسلوراتادين لا يخترق الجهاز العصبي المركزي ولم يلاحظ أي زيادة في حالات الأرق مقارنة بالغفل عند الجرعات الموصى بها من 5 ملغم يوميا. لم يؤثر الإيرياليرج على الأداء النفسي الحركي في التجارب الإكلينيكية عند جرعات 7.5 ملغم يوميا. لم تؤثر جرعة مفردة 5 ملغم من ديسلوراتادين على القياسات المعيارية للأداء أثناء الطيران متضمنا ذلك اشتداد الرغبة في النعاس أو الوظائف المرتبطة بالطيران.

لم تشاهد أية تغيرات ذات دلالة إكلينيكية في تركيز ديسلوراتادين في البلازما في تجارب التأثيرات المتبادلة مع الجرعة المتعددة من كيتوكونازول، إريثرومايسين، أزيثرومايسين، فلوكسيتين، وسيميتيدين.

في تجارب الفارماكولوجيا الإكلينيكية، إعطاء الكحول مصاحبا، لم يزيد من التغير في الأداء أو زيادة في النعاس. لم يوجد أي اختلافات ذات أهمية في نتائج الاختبارات النفسية الحركية بين مجموعة الديسلوراتادين ومجموعة الغفل عند إعطائهم بمفردهم أو مصاحبا بالكحول في المرضى الذين لديهم حساسية أرجية بالأنف (AR)، كانت أقراص ديسلوراتادين فعالة في تخفيف الأعراض مثل العطاس، والإفراز الأنفي، والتهيج، والاحتقان/الانسداد وكذلك حكة العينين، وزيادة إفراز الدموع واحمرار العينين، وحكة سقف الفم. وقد سيطرت أقراص ديسلوراتادين على الأعراض بشكل فعال لمدة 24 ساعة. في تجربتين على مدى 4 أسابيع في مرضى الحساسية الأرجية الموسمية (SAR) الذين يعانون في نفس الوقت من الربو، ثبت أن ديسلوراتادين فعال في تقليل أعراض الحساسية الأرجية الموسمية SAR (ارتشاح الأنف، احتقان بالأنف، حكة الأنف، عطاس، حكة/حرقة العينين، زيادة إفراز الدموع، احمرار العينين، وحكة بالأذنين أو سقف الفم) وربو (سعال، أزيز، صعوبة التنفس)، وتقليل استعمال منشطات البيتا. لم يتغير حجم الزفير الجبري (FEV1) في أي من المجموعتين المعالجتين ديسلوراتادين أو العلاج المموه.

في التجارب التي تم إجراؤها في مرضى الأرتيكاريا المزمنة الذاتية المنشأ (CIU)، كانت أقراص ديسلوراتادين فعالة في تخفيف الحكة وتقليل حجم وعدد البثور بعد مدة قد لا تزيد عن يوم واحد من بدء العلاج. في كل تجربة استمرت الآثار طوال فترة الـ 24 ساعة الفاصلة بين الجرعات. وقد أدى أيضا استعمال ديسلوراتادين إلى تحسين النوم والأداء الوظيفي أثناء النهار، والتي تم قياسها في شكل نقص الإعاقة للنوم وللأنشطة الروتينية اليومية.

وقد كان ديسلوراتادين فعالا في تخفيف عبء الالتهاب الأنفي الأرجي الموسمي كما هو واضح من التقدير الإجمالي لاستبيان جودة الحياة فيما يتعلق بالتهاب الأنف والملتحمة. وقد ظهر التحسن الأكبر في مجال المشاكل العملية والأنشطة اليومية التي تتأثر بالأعراض.

الخصائص الحركية للدواء:

يمكن الكشف عن تركيزات الديسلوراتادين في البلازما في خلال 30 دقيقة من إعطائه. الديسلوراتادين جيد الامتصاص ويصل أعلى تركيز بعد حوالي 3 ساعات ويكون العمر النصف نهائي الطور حوالي 27 ساعة وكانت درجة تجمع الديسلوراتادين متوافقة مع العمر النصف له (حوالي 27 ساعة) ومع تكرار الجرعة مرة يوميا. التواجد الحيوي للديسلوراتادين يتناسب مع الجرعة على المدى من 5 إلى 20 ملغم. الديسلوراتادين يتحد بنسبة (83%-87%) مع بروتين البلازما. لا يوجد دليل عن تجمع اكلينيكي ذا أهمية بعد الجرعة الواحدة يوميا من الديسلوراتادين (5 ملغم إلى 20 ملغم) لمدة 14 يوما، لم يتم بعد تحديد الإنزيم المسئول عن أيض ديسلوراتادين، وبالتالي فلا يمكن أن نستبعد بالكامل بعض التأثيرات المتبادلة مع الأدوية الأخرى. أثبتت الدراسات في الجسم مع المثبطات النوعية لإنزيم CYP3A4 و CYP2D6 أن هذين الإنزيمين غير مهمين في أيض ديسلوراتادين. لا يؤدي ديسلوراتادين إلى تثبيط CYP3A4 و CYP2D6 كما أنه ليس من ركائز ولا من مثبطات بي- جلايكوبروتين. في تجربة واحدة مستخدما 7.5 ملغم من الديسلوراتادين لم يكن هناك أي أثر للطعام (عالي الدهون – إفطار ذا سعرات حرارية عالية) على تخلص الجسم من الديسلوراتادين. في دراسة أخرى، ثبت أن الجريب فروت لا يؤثر على تخلص الجسم من الديسلوراتادين.

دواعي الاستعمال:

يستعمل ديسلوراتادين لعلاج الأعراض المصاحبة للحساسية الأرجية بالأنف (AR) كالعطس والرشح والحكة والاحتقان، وأيضا حرقان وحكة العين، التدمع والاحمرار، حكة الحلق والسعال. يوصى أيضا باستعمال ديسلوراتادين لتخفيف الأعراض المصاحبة للأرتيكاريا المزمنة الذاتية المنشأ مثل تخفيف الحكة وتقليل حجم وعدد البثور.

الجرعة والاستعمال:

البالغين والشباب ≥ 12 سنة: قرص واحد 5 ملغم من أقراص إيرياليرج® يؤخذ يومياً بغض النظر عن أوقات الطعام.

تفاعلات الدواء:

لم يلاحظ أي تفاعلات ذات أهمية إكلينيكية مع ديسلوراتادين أثناء التجارب الإكلينيكية. لم يؤثر الطعام أو عصير الجريب فروت على تخلص الجسم من الديسلوراتادين، عند تناول ديسلوراتادين متزامنا مع الكحول، لم يحدث زيادة في التدهور في الأداء المصاحب الكحول.

التأثيرات الجانبية:

في تجارب إكلينيكية على عدد من دواعي الاستعمال وتشمل الحساسية الأرجية بالأنف (AR) والأرتيكاريا المزمنة الذاتية المنشأ (CIU)، باستعمال الجرعة الموصى بها 5ملغم يوميا، تم الإبلاغ عن آثار غير مرغوبة لأقراص ديسلوراتادين في 3 % من المرضى أكثر من أولئك الذين تلقوا العلاج المموه. وقد شملت الأحداث المناوئة الأكثر شيوعا التي تم الإبلاغ عنها أكثر من العلاج المموه: التعب (1.3%)، وجفاف الفم (0.8%)، والصداع (0.6 %).

أثناء تسويق الديسلوراتادين، تم الإبلاغ عن حالات نادرة جدا من تفاعلات الحساسية المفرطة، وتشمل التفاعلات الاستهدافية والطفح. وتسرع القلب وخفقان وفرط نشاط نفسي حركي وتشنجات وارتفاع في إنزيمات الكبد والتهاب كبدي وزيادة في البيليروبين.

موانع الاستعمال:

لا تستخدم أقراص إيرياليرج للمرضى الذين لديهم حساسية للمادة الفعالة أو مكوناته أو مادة اللوراتادين.

الاحتياطات:

لم يثبت بعد أمان وفعالية استعمال أقراص ديسلوراتادين في الأطفال أقل من 12 سنة.

فعاليته على القدرة على القيادة وإدارة الآلات:

لم يلاحظ أي أثر لديسلوراتادين على القدرة على القيادة واستخدام الآلات.

الاستخدام أثناء الحمل وللأمهات المرضعات:

لم يلاحظ أثر على خصوبة الجرذان مع الديسلوراتادين عند تعرضهم 34 مرة أكثر من تعرض الإنسان الجرعة الإكلينيكية الموصى بها. لم يلاحظ أثر مسبب للمسخ أو مطفرة في تجارب الحيوانات مع الديسلوراتادين. نظرا لعدم وجود معلومات إكلينيكية في حالات الحمل مع الديسلوراتادين، فانه لم يتبين سلامة استخدام ديسلوراتادين أثناء الحمل. لا ينبغي استعمال ديسلوراتادين أثناء الحمل ما لم تكن الفوائد المتوقعة تفوق المخاطر.

يمر الديسلوراتادين إلى حليب الإرضاع ولهذا لا ينصح باستخدام إيرياليرج للنساء المرضعات.

فرط الجرعة:

في حالة زيادة الجرعة، يتبع الإجراءات العيارية لإزالة المادة الفعالة التي لم يحدث لها امتصاص. ينصح بالعلاج العرضي والمساعد. بناء على تجربة إكلينيكية على الجرعة المتكررة في البالغين والمراهقين، والتي تم فيها تناول جرعة تصل إلى 45 مجم ديسلوراتادين (أي 9 أضعاف الجرعة الإكلينيكية)، لم تشاهد أية آثار ذات دلالة إكلينيكية. لا يتم إزالة الديسلوراتادين عن طريق ديلزة الدم، ولا يعرف إذا كان يتم إزالته عن طريق الديال الصفاقي.

العبوات:

إيرياليرج® 5 ملغم أقراص متوفر بعبوات مختلفة.

الحفظ:

يحفظ في درجة حرارة دون 30°م.

إن هذا دواء - لا تترك الأدوية في متناول أيدي الأطفال

- الدواء مستحضر يؤثر على صحتك واستهلاكه خلافا للتعليمات يعرضك للخطر.
- اتبع بدقة وصفة الطبيب وطريقة الاستعمال المنصوص عليها وتعليمات الصيدلاني الذي صرفها لك.
- إن الطبيب والصيدلاني هما الخبيران بالدواء وبنفعه وضرره.
- لا تقطع مدة العلاج المحددة لك من تلقاء نفسك.
- لا تكرر صرف الدواء بدون وصفة طبية.

Rev. date: Nov. 2010 I 252 00