

AKEROL[®] Sirop

Desloratadine Sirop 2.5mg /5 ml

FORMULE CHIMIQUE

Desloratadine: C₁₉H₉ClN₂, 8-chloro-6,11-dihydro-11-(4-piperidinylidene)- 5H-benzo[5,6]cyclohepta[1,2-b]pyridine

COMPOSITION

Chaque 5 ml contient
Desloratadine2,5 mg

INDICATIONS:

AKEROL[®] sirop est indiqué chez l'adulte, l'adolescent et l'enfant de plus d'un an pour le traitement symptomatique de :
- la rhinite allergique (voir rubrique Propriétés pharmacodynamiques)
- l'urticaire (voir rubrique Propriétés pharmacodynamiques)

MÉCANISME D'ACTION

La desloratadine est un antihistaminique non sédatif, d'action prolongée exerçant un effet antagoniste sélectif sur les récepteurs H1 périphériques. Après administration orale, la desloratadine bloque sélectivement les récepteurs histaminiques H1 périphériques car elle ne diffuse pas dans le système nerveux central.

PHARMACOCINETIQUE

a.Absorption

Les taux plasmatiques de desloratadine peuvent être détectés dans les 30 minutes qui suivent l'administration. La desloratadine est bien absorbée avec une concentration maximale atteinte après approximativement 3 heures;La demi-vie de la phase terminale est approximativement de 27 heures. Le facteur d'accumulation de la desloratadine correspond à sa demi-vie (27 heures environ) et son rythme d'administration en une prise par jour. Sa biodisponibilité est dose-dépendante sur un intervalle de 5 mg à 20 mg.

b.Distribution

La desloratadine se lie modérément (83 % - 87 %) aux protéines plasmatiques. Après l'administration quotidienne de desloratadine en une prise par jour (5 mg à 20 mg) pendant 14 jours, aucun élément clinique n'évoquait une accumulation du produit.

c.Métabolisme

L'enzyme impliquée dans le métabolisme de la desloratadine n'a pas encore été identifiée et, par conséquent, le risque d'interaction avec d'autres médicaments ne peut être totalement exclu. In vivo, la desloratadine n'inhibe pas le cytochrome P3A4 et les études in vitro ont montré que la substance active n'inhibe pas le cytochrome P2D6 et qu'elle n'est ni un substrat ni un inhibiteur de la P-glycoprotéine.

EFFETS SECONDAIRES

Hallucinations, céphalées, vertige, somnolence, insomnie, hyperactivité psychomotrice, convulsions, tachycardie, palpitations, sécheresse buccale, douleur abdominale, nausée, vomissement, dyspepsie, diarrhée, augmentations des enzymes hépatiques, augmentation de la bilirubine, hépatite, ictère, myalgie, asthénie, réactions d'hypersensibilité (telles que l'anaphylaxie, angio-œdème, dyspnée, prurit, rash et urticaire).

PRECAUTIONS D'EMPLOI

Chez les enfants de moins de 2 ans, il est difficile de différencier la rhinite allergique des autres formes de rhinites. Le diagnostic sera étayé par l'absence d'infection respiratoire haute ou de malformation, ainsi que les antécédents personnels, l'examen clinique, et les tests cutanés ou examens biologiques appropriés.

Environ 6 % des adultes et des enfants de 2 à 11 ans sont des métaboliseurs lents de la desloratadine ce qui entraîne une majoration de l'exposition systémique. La tolérance de la desloratadine apparaît identique chez les enfants de 2 à 11 ans métaboliseurs lents et chez ceux dont le métabolisme est normal. Les effets de solution buvable de desloratadine chez les enfants métaboliseurs lents de moins de 2 ans n'ont pas été étudiés. **AKEROL[®]** Sirop doit être utilisé avec précaution en cas d'insuffisance rénale sévère.

INTERACTIONS

Au cours des études cliniques réalisées avec des comprimés de desloratadine dans lesquels les patients recevaient de l'érythromycine ou du kétoconazole en association, aucune interaction cliniquement significative n'a été observée.

Au cours d'une étude de pharmacologie clinique, il n'a pas été mis en évidence de potentialisation des effets délétères de l'alcool sur les tests de performances, lors de l'association avec la desloratadine en comprimés.

CONTRE-INDICATIONS

Hypersensibilité au principe actif ou à l'un des excipients ou à la loratadine.

GROSSESSE ET ALLAITEMENT

La desloratadine n'a pas montré d'effet tératogène lors des études effectuées chez l'animal. La sécurité du produit pendant la grossesse n'a pas été établie. En conséquence, l'utilisation d'**AKEROL[®]** Sirop pendant la grossesse n'est pas recommandée.

La desloratadine est excrétée dans le lait maternel, par conséquent l'utilisation d'Akerol n'est pas recommandée chez la femme qui allaite.

POSOLOGIE

Adultes et adolescents (12 ans et plus) : 10 ml (5 mg) d'**AKEROL[®]** Sirop une fois par jour.

Le prescripteur devra garder en mémoire le fait que chez l'enfant de moins de 2 ans, la majorité des cas de rhinites est d'origine infectieuse et qu'il n'y a pas de données validant Akerol Sirop en traitement de la rhinite infectieuse.

Enfants de 1 à 5 ans : 2,5 ml (1,25 mg) d'**AKEROL[®]** Sirop une fois par jour.

Enfants de 6 à 11 ans : 5 ml (2,5 mg) d'**AKEROL[®]** Sirop une fois par jour.

SURDOSAGE

En cas de surdosage, l'élimination par les méthodes usuelles de la substance active non absorbée devra être envisagée. Un traitement symptomatique et des mesures thérapeutiques adaptées sont recommandés.

Au cours d'une étude clinique en dose répétée, chez l'adulte et l'adolescent, aucun effet cliniquement significatif n'a été observé lors de l'administration d'**AKEROL[®]** à une dose allant jusqu'à 45 mg (neuf fois la dose thérapeutique).

AKEROL[®] Sirop n'est pas éliminée par hémodialyse; Son élimination par dialyse péritonéale n'est pas documentée.

PRÉSENTATION: Flacon de 60 ml

CONSERVATION: Au frais à une température ne dépassant pas 30°

Fabricant: WEST-COAST
Pharmaceutical Works Ltd.
Meldi Estate, Near Prasang Party Plot,
Opp.Sola Bhagwat,Sayona City Road,
Gota, Ahmedabad-382481, GUJARAT, (INDIA)

Titulaire de l'AMM/MA Holder:
BEKRA PHARMA UK LTD
13, LAVINGTON
LONDON, UNITED KINGDOM.

CHEMISTRY

Desloratadine: C₁₉H₉ClN₂, 8-chloro-6,11-dihydro-11-(4-piperidinylidene)- 5H-benzo[5,6]cyclohepta[1,2-b]pyridine

COMPOSITION

Each 5 ml contains :
Desloratadine.....2.5 mg
Flavoured Syrup Base.....q.s.
Colour: Sunset yellow colour FCF

INDICATIONS: Akerol Syrup is indicated in adults, adolescents and children over the age of 1 year for the relief of symptoms associated with:

- Allergic rhinitis
- Urticaria

MECHANISM OF ACTION: Desloratadine is a non-sedating, long-acting histamine antagonist with selective peripheral H1- receptor antagonist activity. After oral administration, Desloratadine selectively blocks peripheral histamine H1- receptors because the substance is excluded from entry to the central nervous system.

PHARMACOKINETICS

Absorption: Desloratadine plasma concentrations can be detected within 30 minutes of administration. The bioavailability of Desloratadine was dose proportional over the range of 5 mg to 20 mg. In a pharmacokinetic trial in which patient demographics were comparable to those of the general seasonal allergic rhinitis population, 4 % of the subjects achieved a higher concentration of Desloratadine. Maximum Desloratadine concentration was about 3-fold higher at approximately 7 hours with a terminal phase half-life of approximately 89 hours.

Distribution: Desloratadine is moderately bound (83 % - 87 %) to plasma proteins. There is no evidence of clinically relevant medicine accumulation following once daily dosing of Desloratadine (5 mg to 20 mg) for 14 days.

Biotransformation: The enzyme responsible for the metabolism of Desloratadine has not been identified yet, and therefore, some interactions with other medicinal products can not be fully excluded. Desloratadine does not inhibit CYP3A4 in vivo, and in vitro studies have shown that the medicinal product does not inhibit CYP2D6 and is neither a substrate nor an inhibitor of P-glycoprotein.

ADVERSE REACTIONS: Hallucinations, dizziness, somnolence, insomnia, psychomotor hyperactivity, seizures, tachycardia, palpitations, abdominal pain, nausea, vomiting, dyspepsia, diarrhoea, elevations of liver enzymes, increased bilirubin, hepatitis, Myalgia, hypersensitivity reactions (such as anaphylaxis, angioedema, dyspnoea, pruritus, rash, and urticaria).

WARNINGS/PRECAUTIONS

- In children below 2 years of age, the diagnosis of allergic rhinitis is particularly difficult to distinguish from other forms of rhinitis. The absence of upper respiratory tract infection or structural abnormalities, as well as patient history, physical examinations, and appropriate laboratory and skin tests should be considered.
- Approximately 6 % of adults and children 2- to 11-year old are phenotypic poor metabolisers of Desloratadine and exhibit a higher exposure. The safety of Desloratadine in children 2- to 11-years of age who are poor metabolisers is the same as in children who are normal metabolisers. The effects of Desloratadine in poor metabolisers < 2 years of age have not been studied.
- In the case of severe renal insufficiency, Akerol Syrup should be used with caution.

DRUG INTERACTIONS

No clinically relevant interactions were observed in clinical trials with Desloratadine in which erythromycin or ketoconazole were co-administered. In a clinical pharmacology trial Desloratadine taken concomitantly with alcohol did not potentiate the performance impairing effects of alcohol.

CONTRAINDICATIONS: Hypersensitivity to the active substance, to any of the excipients.

PREGNANCY AND LACTATION

Pregnancy: Desloratadine was not teratogenic in animal studies. The safe use of the medicinal product during pregnancy has not been established, therefore not recommended.

Lactation: Desloratadine is excreted into breast milk, therefore the use is not recommended in breastfeeding women.

DOSE

Adults and adolescents (12 years of age and over)

The recommended dose of Akerol Syrup is 10 ml (5 mg) oral solution once a day.

Paediatric population

The prescriber should be aware that most cases of rhinitis below 2 years of age are of infectious origin and there are no data supporting the treatment of infectious rhinitis with Akerol Syrup.

Children 1 through 5 years of age: 2.5 ml (1.25 mg) Akerol Syrup once a day.

Children 6 through 11 years of age: 5 ml (2.5 mg) Akerol Syrup once a day.

OVERDOSE AND TREATMENT: In the event of overdose, consider standard measures to remove unabsorbed active substance. Symptomatic and supportive treatment is recommended. Based on a multiple dose clinical trial, in which up to 45 mg of Desloratadine was administered (nine times the clinical dose), no clinically relevant effects were observed.

Desloratadine is not eliminated by haemodialysis, it is not known if it is eliminated by peritoneal dialysis.

PRESENTATION: 60 ml Bottle Pack.

STORAGE: Store in a dry place at a temperature below 30°C.

Manufacturer: WEST-COAST
Pharmaceutical Works Ltd.
Meldi Estate, Near Prasang Party Plot,
Opp.Sola Bhagwat,Sayona City Road,
Gota, Ahmedabad-382481, GUJARAT, (INDIA)

MA Holder
BEKRA PHARMA UK LTD
13, LAVINGTON
LONDON, UNITED KINGDOM.