ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ЕРІУС®

AERIUS®

Склад:

діюча речовина: дезлоратадин;

1 мл сиропу містить 0,5 мг дезлоратадину;

допоміжні речовини: пропіленгліколь, сорбіту розчин, що не кристалізується, кислота лимонна безводна, натрію цитрату дигідрат, натрію бензоат (Е 211), динатрію едетат, цукроза, віддушка натуральна та штучна зі смаком жувальної гумки (№ 15864), барвник жовтий FD&C № 6 (Е 110), вода очищена.

Лікарська форма. Сироп.

Основні фізико-хімічні властивості: прозора рідина оранжевого кольору.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні засоби для системного застосування.

Код АТХ R06A X27.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Дезлоратадин є потужним селективним блокатором периферичних гістамінових H_1-рецепторів, який не виявляє седативного ефекту. Дезлоратадин – первинний активний метаболіт лоратадину.

Після перорального прийому Еріус® селективно блокує периферичні H_1-гістамінові рецептори, оскільки препарат майже не проникає крізь гематоенцефалічний бар'єр.

Численні дослідження показали, що крім антигістамінної активності Еріус® продемонстрував свої протиалергічні та протизапальні властивості. Встановлено, що Еріус® пригнічує каскад різних реакцій, які лежать в основі алергічного запалення, а саме:

- виділення прозапальних цитокінів, включаючи ІЛ-4, ІЛ-6, ІЛ-8, ІЛ-13;
- виділення прозапальних хемокінів, таких як RANTES;

· продукцію супероксидного аніону активованими поліморфноядерними нейтрофілами;

· адгезію і хемотаксис еозинофілів;

· експресію молекул адгезії, таких як Р-селектин;

· IgE-залежне виділення гістаміну, простагландину D_2 і лейкотрієну C_4;

· гострий алергічний бронхоспазм та алергічний кашель у ході досліджень на тваринах.

Безпека застосування препарату Еріус® дітям була продемонстрована у 3-х клінічних дослідженнях. Препарат призначався дітям віком від 6 місяців до 11 років, яким було необхідне проведення антигістамінної терапії, у добовій дозі 1 мг (вікова група від 6 до 11 місяців), 1,25 мг (вікова група від 1 до 5 років) або 2,5 мг (вікова група від 6 до 11 років). Лікування переносилося добре, що було підтверджено результатами клінічних лабораторних досліджень, станом життєво важливих функцій організму та даними ЕКГ (включаючи довжину інтервалу QT).

Під час клінічних досліджень щоденне застосування препарату Еріус® у дозі до 20 мг протягом 14 днів не супроводжувалося статистично клінічно значущими змінами з боку серцево-судинної системи. У ході клініко-фармакологічного дослідження застосування Еріус® 45 мг/добу (у 9 разів вище терапевтичної дози) протягом 10 днів не спричинило подовження інтервалу QT.

Дезлоратадин майже не проникає крізь гематоенцефалічний бар’єр. При застосуванні рекомендованої дози 5 мг частота сонливості не перевищувала таку в групі плацебо. У ході клінічних досліджень Еріус® не впливав на психомоторні функції при прийомі дози до 7,5 мг.

Крім прийнятого поділу алергічного риніту на сезонний та цілорічний, за тривалістю симптомів алергічний риніт можна також альтернативно класифікувати на інтермітуючий та персистуючий. Інтермітуючий алергічний риніт визначається як наявність симптомів протягом менше 4 днів на тиждень або менше 4 тижнів. У разі персистуючого алергічного риніту симптоми спостерігаються впродовж 4 днів або більше на тиждень чи впродовж періоду, що перевищує 4 тижні.

Клінічна ефективність препарату Еріус® при лікуванні сезонного алергічного риніту була продемонстрована в чотирьох плацебо-контрольованих клінічних дослідженнях із застосуванням багаторазових доз.

У пацієнтів з алергічним ринітом Еріус® ефективно усував такі симптоми: чхання, виділення з носа та свербіж, а також подразнення очей, сльозотеча та почервоніння, свербіж піднебіння.

Фармакокінетика.

Дезлоратадин починає визначатися в плазмі протягом 30 хв після прийому препарату. Еріус® ефективно контролює симптоми упродовж 24 годин. Дезлоратадин добре всмоктується. Максимальна концентрація дезлоратадину в плазмі досягається у середньому через 3 години, період напіввиведення становить у середньому 27 годин. Ступінь кумуляції дезлоратадину відповідає його періоду напіввиведення (приблизно 27 годин) і кратності застосування (один раз на добу). Біодоступність дезлоратадину була пропорційна дозі в

діапазоні від 5 до 20 мг.

Дезлоратадин помірно (83–87 %) зв’язується з білками плазми. При застосуванні дезлоратадину в дозі від 5 до 20 мг один раз на добу протягом 14 днів ознак клінічно значущої кумуляції препарату не виявлено.

Низька швидкість метаболізму дезлоратадину відмічена у близько 8 % суб’єктів, у яких спостерігалось значне підвищення рівня препарату в плазмі та подовження періоду напіввиведення. Поширеність випадків уповільнення метаболізму може бути зумовлена расовою приналежністю. Цей факт вважається наразі клінічно нерелевантним.

При проведенні перехресних порівняльних досліджень з однаковою дозою препарату було виявлено біоеквівалентність препарату у формі таблеток і сиропу.

При проведенні фармакокінетичних досліджень у педіатричній практиці було виявлено, що показники AUC і C_{max} дезлоратадину (при застосуванні у рекомендованих дозах) можуть бути прирівняні до таких же показників у дорослих, які приймали дезлоратадин у формі сиропу в дозі 5 мг.

Результати досліджень показали, що дезлоратадин не пригнічує CYP3A4 чи CYP2D6 та не є ні субстратом, ні інгібітором Р-глікопротеїду.

Клінічні характеристики.

Показання.

Для усунення симптомів, пов'язаних з алергічним ринітом, таких як чхання, виділення з носа, свербіж, набряк та закладеність носа, а також свербіж та почервоніння очей, сльозотеча, свербіж піднебіння та кашель.

Для усунення симптомів, пов'язаних із кропив'янкою, таких як свербіж та висипання.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до дезлоратадину, до будь-якого допоміжного компонента препарату або до лоратадину.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Клінічно значущих змін у плазмовій концентрації дезлоратадину при неодноразовому сумісному застосуванні з кетоконазолом, еритроміцином, азитроміцином, флюоксетином, циметидином виявлено не було. У зв’язку з тим, що фермент, який відповідає за метаболізм дезлоратадину, не встановлений, взаємодію з іншими лікарськими засобами повністю виключити неможливо.

Їжа (жирний висококалорійний сніданок) або грейпфрутовий сік не впливають на розподіл дезлоратадину.

Вплив на результати лабораторних досліджень

Застосування препарату Еріус® необхідно припинити приблизно за 48 годин до проведення шкірних проб, оскільки антигістамінні препарати можуть попереджати виникнення чи зменшувати прояви позитивних дерматологічних реакцій на подразники.

Особливості застосування.

У ході клініко-фармакологічних досліджень Еріус® не посилював такі ефекти алкоголю: порушення психомоторної функції і сонливість. Результати психомоторних тестів істотно не відрізнялися у пацієнтів, які застосовували Еріус®, і пацієнтів, які приймали плацебо, окремо чи разом з алкоголем.

У хворих з нирковою недостатністю тяжкого ступеня прийом препарату Еріус® слід здійснювати під контролем лікаря. Лікарський засіб містить сорбіт, тому його не слід застосовувати пацієнтам із вродженою непереносимістю фруктози.

Дезлоратадин слід призначати з обережністю хворим, які мали напад судом в анамнезі. Діти можуть бути більш чутливими до розвитку нового нападу судом під час лікування дезлоратадином. Лікар має ухвалити рішення щодо припинення лікування дезлоратадином хворих, у яких під час застосування препарату спостерігався напад судом.

Застосування у період вагітності або годування груддю. Чимало даних застосування дезлоратадину протягом вагітності (більше 1000 випадків) свідчать про відсутність тератогенної, фетотоксичної дії та несприятливого впливу на новонародженого. В ході досліджень на тваринах не виявлено прямого або непрямого несприятливого впливу на репродуктивну функцію. Як запобіжний захід, бажано уникати застосування лікарського засобу Еріус® протягом вагітності.

Дезлоратадин проникає в грудне молоко, тому жінкам, які годують груддю, рекомендується визначити чи є необхідним припинення грудного вигодовування або уникнення застосування препарату, беручи до уваги переваги грудного вигодовування для дитини та користь від застосування лікарського засобу для матері.

Фертильність. Дані щодо впливу на фертильність відсутні.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Дані клінічних досліджень свідчать, що Еріус® не впливає чи має незначний вплив на здатність керувати автотранспортом чи іншими механізмами. Пацієнтів слід інформувати, що більшість людей не відчувають сонливості. Слід брати до уваги, що індивідуальна реакція на лікарські засоби може відрізнятися. Пацієнтам рекомендується не займатися діяльністю, що вимагає концентрації уваги, такою як керування автомобілем або використання інших механізмів, доки вони не визначили власну реакцію на лікарський засіб.

Спосіб застосування та дози.

Для усунення симптомів, пов'язаних з алергічним ринітом (у тому числі інтермітуючим і персистуючим) і кропив’янкою, Еріус® застосовують незалежно від прийому їжі у таких дозах:

дорослі та підлітки (³ 12 років): 10 мл сиропу (5 мг дезлоратадину) один раз на добу.

Терапію інтермітуючого алергічного риніту (наявність симптомів менше 4 днів на тиждень або менше 4 тижнів) необхідно проводити з урахуванням даних анамнезу: припинити після зникнення симптомів та відновити після повторного їх виникнення. При персистуючому алергічному риніті (наявність симптомів більше 4 днів на тиждень або більше 4 тижнів) необхідно продовжувати лікування протягом усього періоду контакту з алергеном.

Діти. Ефективність і безпека застосування сиропу Еріус® дітям віком до 6 місяців не встановлені. Препарат не рекомендується призначати дітям віком до 6 місяців для лікування хронічної ідіопатичної кропив’янки та дітям віком до 12 місяців для лікування алергічного риніту. Для лікування застосовується наступний режим дозування:

- дітям віком від 6 до 11 місяців: по 2 мл сиропу (1 мг дезлоратадину) один раз на добу;

- віком від 1 до 5 років: по 2,5 мл сиропу (1,25 мг дезлоратадину) один раз на добу;

- віком від 6 до 11 років: по 5 мл сиропу (2,5 мг дезлоратадину) один раз на добу.

Передозування.

У разі передозування вживають стандартних заходів, спрямованих на видалення неабсорбованої активної речовини, застосовують симптоматичне лікування.

При застосуванні дезлоратадину у дозах до 45 мг (що у 9 разів перевищує рекомендовані) у ході клінічних досліджень у дорослих і підлітків клінічно значущих ефектів не спостерігалось.

Дезлоратадин не видаляється шляхом гемодіалізу, можливість його видалення шляхом перитонеального діалізу не встановлена.

Побічні реакції.

У ході клінічних досліджень за показаннями, включаючи алергічний риніт та хронічну ідіопатичну кропив'янку, про небажані ефекти у пацієнтів, які отримували дозу 5 мг на добу, повідомляли на 3 % частіше, ніж у пацієнтів, які отримували плацебо. Найчастіше, порівняно з плацебо, повідомляли про такі побічні ефекти: стомлюваність (1,2 %), сухість у роті (0,8 %) та головний біль (0,6 %). Під час клінічних досліджень препарату Еріус® у дітей віком від 2 до 11 років кількість випадків побічних реакцій була однакова як у групі застосування сиропу, так і в групі плацебо. У дітей віком від 6 до 23 місяців найбільш частими (порівняно з плацебо) небажаними явищами були діарея (3,7 %), підвищення температури (2,3 %) і безсоння (2,3 %).

Існує ризик психомоторної гіперактивності (аномальної поведінки), пов’язаної із застосуванням дезлоратадину (що може проявлятися у вигляді злості та агресії, а також збудження).

У постреєстраційному періоді спостерігалися (частота невідома): подовження інтервалу QT, аритмії та брадикардії.

Інші побічні ефекти, про які дуже рідко повідомлялося під час постмаркетингового періоду, наведені у таблиці нижче. Частота появи побічних реакцій класифікується таким чином: дуже часті (≥1/10), часті (≥1/100, <1/10), нечасті (≥1/1000, <1/100), поодинокі (≥1/10000, <1/1000), рідкісні (<1/10000) та частота невідома.

Класи/системи органів	**Частота виникнення**	**Побічні реакції**
Розлади метаболізму та харчування	Частота невідома	Підвищення апетиту
З боку психіки	Рідкісні Частота невідома	Галюцинації Аномальна поведінка, агресія
З боку нервової системи	Часті Часті (для дітей віком до 2 років) Рідкісні	Головний біль Безсоння Запаморочення, сонливість, безсоння, психомоторна гіперактивність, судоми, депресивний настрій
З боку серця	Рідкісні	Тахікардія, відчуття серцебиття, подовження інтервалу QT, суправентрикулярна тахіаритмія
З боку шлунково-кишкового тракту	Часті Часті (для дітей віком до 2 років) Рідкісні	Сухість у роті Діарея Біль у животі, нудота, блювання, диспепсія, діарея
З боку гепатобіліарної системи	Рідкісні Частота невідома	Збільшення рівня ферментів печінки, підвищений білірубін, гепатит Жовтяниця
З боку скелетно-м'язової системи та сполучної тканини	Рідкісні	Міалгія
З боку шкіри та підшкірних тканин	Частота невідома	Фоточутливість
З боку органів зору	Частота невідома	Сухість очей
Загальні порушення	Часті Часті (для дітей віком до 2 років) Рідкісні Частота невідома	Стомлюваність Підвищення температури Реакції гіперчутливості (анафілаксія, набряк Квінке, задишка, свербіж, висипання, кропив’янка) Астенія
Дослідження	Частота невідома	Збільшення маси тіла

Дезлоратадин майже не проникає в центральну нервову систему. При застосуванні в рекомендованій дозі для дорослих, що становить 5 мг, не відмічалось підвищення показника

частоти сонливості порівняно з групою плацебо. В клінічних дослідженнях препарат Еріус® в одноразовій добовій дозі 7,5 мг не виявляв впливу на психомоторну активність.

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання. Зберігати у недоступному для дітей місці при температурі не вище 30 °С.

Упаковка. Флакони по 60 мл або 120 мл, закриті кришечкою з контролем першого відкриття та із захистом від відкриття дітьми, у комплекті з мірною ложечкою або дозуючим шприцом, у картонній коробці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Виробник.

Органон Хейст Б.В./

Organon Heist B.V.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Індустріепарк 30, Хейст-оп-ден-Берг, 2220, Бельгія/

Industriepark 30, Heist-op-den-Berg, 2220, Belgium.