

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ФРІ-АЛ

(FREE-AL)

Склад:

діюча речовина: desloratadine;

1 таблетка містить дезлоратадину 5 мг;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна гранульована, целюлоза мікрокристалічна, натрію крохмальгліколят (тип А), магнію стеарат, заліза оксид червоний (Е 172).

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: круглі двоопуклі таблетки рожевого або майже рожевого кольору, з рискою. Риска не призначена для розламування таблетки.

Фармакотерапевтична група.

Антигістамінні засоби для системного застосування. Код АТХ R06A X27.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Дезлоратадин – це неседативний антигістамінний лікарський засіб тривалої дії, що має селективну антагоністичну дію на периферичні H₁-рецептори. Після перорального застосування дезлоратадин селективно блокує периферичні гістамінові H₁-рецептори.

У дослідженнях *in vitro* дезлоратадин продемонстрував на клітинах ендотелію свої антиалергічні та протизапальні властивості. Це проявлялося пригніченням виділення прозапальних цитокінів, таких як IL-4, IL-6, IL-8 та IL-13, з мастоцитів/базофілів людини, а також пригніченням експресії молекул адгезії, таких як Р-селектин. Клінічна значущість цих спостережень ще потребує підтвердження.

У клінічних дослідженнях високих доз, у яких дезлоратадин вводили щоденно у дозі до 20 мг протягом 14 днів, статистично значущі зміни з боку серцево-судинної системи не спостерігалися. У клінічно-фармакологічному дослідженні при застосуванні 45 мг на день протягом 10 днів подовження інтервалу QT не спостерігалось.

У пацієнтів з алергічним ринітом ФРІ-АЛ ефективно усував такі симптоми, як чхання, виділення з носа, свербіж, подразнення очей, слезотеча та почервоніння, свербіж піднебіння. ФРІ-АЛ ефективно контролював симптоми упродовж 24 годин.

Дезлоратадин майже не проникає в центральну нервову систему. У контрольованих клінічних дослідженнях при прийомі в рекомендованій дозі 5 мг на добу частота виникнення сонливості не відрізнялася від такої у групі плацебо. У клінічних дослідженнях одноразовий прийом препарату дезлоратадину у добовій дозі 7,5 мг не чинив впливу на психомоторну активність. ФРІ-АЛ значно полегшує тяжкість перебігу сезонного алергічного риніту, про що свідчить сумарний показник опитувальника з оцінки якості життя при ринокон'юнктивіті. Максимальне покращення відзначалося в пунктах опитувальника, пов'язаних з практичними проблемами і щоденною діяльністю.

Хронічну ідіопатичну кропив'янку вивчали в клінічній моделі з умовами кропив'янки. Оскільки викид гістаміну є причинним фактором при всіх формах кропив'янки, очікується, що дезлоратадин буде ефективно полегшувати симптоми при інших формах кропив'янки, крім хронічної ідіопатичної кропив'янки.

У двох плацебоконтрольованих 6-тижневих дослідженнях з участю пацієнтів з хронічною ідіопатичною кропив'янкою ФРІ-АЛ ефективно полегшував свербіж і зменшував кількість та розмір уртикарії до кінця першого інтервалу дозування. У кожному дослідженні ефект тривав протягом 24-годинного інтервалу дозування. Полегшення свербіжу на більш ніж 50 % відзначалося у 55 % пацієнтів, які приймали дезлоратадин, порівняно з 19 % пацієнтів, які приймали плацебо. Прийом препарату не виявляє істотного впливу на сон та денну активність.

Фармакокінетика.

Всмоктування.

Концентрації дезлоратадину у плазмі крові можна визначити через 30 хвилин після прийому препарату. Дезлоратадин добре абсорбується, максимальна концентрація досягається приблизно через 3 години; період напіввиведення становить приблизно 27 годин. Ступінь кумуляції дезлоратадину відповідав його періоду напіввиведення (приблизно 27 годин) та частоті прийому 1 раз на добу. Біодоступність дезлоратадину була пропорційна до дози у діапазоні від 5 до 20 мг.

У фармакокінетичну дослідженні, в якому демографічні дані пацієнтів можна було порівняти з загальною популяцією з сезонним алергічним ринітом, у 4 % учасників спостерігалась вища концентрація дезлоратадину. Ця кількість може варіюватися залежно від етнічної приналежності. Максимальна концентрація дезлоратадину була приблизно в 3 рази вища через приблизно 7 годин, термінальний період напіввиведення становив приблизно 89 годин. Профіль безпеки цих пацієнтів не відрізнявся від профілю у загальній популяції.

Розподіл

Дезлоратадин помірно зв'язується з білками плазми (83-87 %). При застосуванні дози дезлоратадину від 5 до 20 мг 1 раз на добу протягом 14 днів ознак клінічно значущої кумуляції препарату не виявлено.

Біотрансформація

Фермент, який відповідає за метаболізм дезлоратадину, поки ще не виявлено, тому неможливо

повністю виключити деякі взаємодії з іншими лікарськими препаратами. Дезлоратадин не пригнічує CYP3A4 *in vivo*, дослідження *in vitro* продемонстрували, що лікарський препарат не пригнічує CYP2D6, субстрат або інгібітор Р-глікопротеїну.

Виведення

У дослідженні одноразового прийому дезлоратадину в дозі 7,5 мг прийом їжі (жирний висококалорійний сніданок) не впливав на фармакокінетику дезлоратадину. Також встановлено, що грейпфрутовий сік також не впливає на фармакокінетику дезлоратадину.

Клінічні характеристики.

Показання.

Усунення симптомів, пов'язаних з:

- алергічним ринітом;
- кропив'янкою.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до активної речовини або до будь-якої допоміжної речовини чи до лоратадину.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

У клінічних дослідженнях таблеток дезлоратадину при сумісному застосуванні еритроміцину або кетоконазолу жодних клінічно значущих взаємодій не спостерігалось.

За даними клініко-фармакологічних досліджень, при застосуванні препарату разом з алкоголем не відзначалося посилення негативного впливу етанолу на психомоторну функцію. Однак у постреєстраційний період спостерігалися випадки непереносимості алкоголю та алкогольна інтоксикація під час застосування препарату. Тому необхідно бути обережними при застосування алкоголю у період лікування ФРІ-АЛом.

Особливості застосування.

Хворим з нирковою недостатністю тяжкого ступеня застосування лікарського засобу ФРІ-АЛ слід здійснювати під контролем лікаря.

Пацієнтам з рідкісними спадковими проявами непереносимості галактози, уродженою

недостатністю лактози або синдромом мальабсорбції глюкози та галактози не слід приймати цей препарат.

До складу лікарського засобу входить натрію крохмальгліколят (тип А), тому пацієнтам, які дотримуються дієти з обмеженим вмістом натрію, необхідно враховувати кількість натрію, яка потрапляє в організм при лікуванні. Кожна таблетка містить 0,147 мг натрію.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Дезлоратадин не продемонстрував тератогенність у дослідженнях на тваринах.

Безпека застосування препарату у період вагітності не встановлена, тому застосування лікарського засобу ФРІ-АЛ у цей період не рекомендується.

Годування груддю.

Дезлоратадин проникає у грудне молоко, тому застосування лікарського засобу ФРІ-АЛ жінкам, які годують груддю, не рекомендується.

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

У клінічних дослідженнях, під час яких оцінювали здатність керувати автотранспортом, жодних погіршень у пацієнтів, які приймали дезлоратадин, не виявлено. Однак пацієнтів слід проінформувати, що дуже рідко деякі люди відчують сонливість, що може вплинути на їхню здатність керувати автомобілем та складною технікою.

Спосіб застосування та дози.

Дорослим та дітям віком від 12 років: 1 таблетка 1 раз на добу, незалежно від прийому їжі, для усунення симптомів, асоційованих з алергічним ринітом (включаючи інтермітуючий та персистуючий алергічний риніт) та кропив'янкою.

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.

Існують обмежені дані клінічних досліджень ефективності застосування таблеток дезлоратадину підліткам від 12 до 17 років (див. розділ «Побічні реакції»).

Ефективність та безпечність застосування лікарського засобу ФРІ-АЛ дітям віком до 12 років не встановлена.

Передозування.

У разі передозування застосовувати стандартні заходи для видалення неабсорбованої активної речовини. Рекомендується симптоматичне та підтримувальне лікування. У клінічних дослідженнях, у яких дезлоратадин вводили у дозах 45 мг (що у 9 разів перевищували рекомендовані), клінічно значущі небажані реакції не спостерігалися. Дезлоратадин не видаляється шляхом гемодіалізу; можливість його видалення при перитонеальному діалізі не встановлена.

Побічні реакції.

У клінічних дослідженнях лікування алергічного риніту та хронічної ідіопатичної кропив'янки небажані ефекти у пацієнтів, які отримували дозу 5 мг на добу, спостерігалися на 3 % частіше, ніж у пацієнтів, які отримували плацебо.

Найчастіше, порівняно з плацебо, повідомлялося про такі побічні ефекти, як підвищена стомлюваність (1,2 %), сухість у роті (0,8 %) та головний біль (0,6 %).

Діти. У клінічних дослідженнях з участю 578 підлітків віком від 12 до 17 років найбільш розповсюдженим побічним ефектом був головний біль: він спостерігався у 5,9 % пацієнтів, які приймали дезлоратадин, та у 6,9 % пацієнтів, які отримували плацебо.

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

У постреєстраційний період спостерігалися (частота невідома): подовження інтервалу QT, аритмії та брадикардії.

Сумарна таблиця частоти побічних реакцій.

Частота появи побічних реакцій класифікується таким чином: дуже часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), рідко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$), дуже рідко ($< 1/10000$) та частота невідома.

Системи органів	Частота виникнення	Побічні реакції
З боку психіки	дуже рідко	галюцинації
З боку нервової системи	часто	головний біль
	дуже рідко	запаморочення, сонливість, безсоння, психомоторна гіперактивність, судоми
З боку серця	дуже рідко	тахікардія, прискорене серцевиття
	частота невідома	подовження інтервалу QT, суправентрикулярна тахіаритмія

З боку шлунково-кишкового тракту	часто	сухість у роті
	дуже рідко	біль у животі, нудота, блювання, диспепсія, діарея
З боку гепатобіліарної системи	дуже рідко	збільшення рівня ферментів печінки, підвищення рівня білірубіну, гепатит
	частота невідома	жовтяниця
З боку скелетно-м'язової системи та сполучної тканини	дуже рідко	міалгія
З боку шкіри та підшкірних тканин	частота невідома	фоточутливість
Загальні порушення	часто	підвищена стомлюваність
	дуже рідко	реакції гіперчутливості (такі як анафілаксія, набряк Квінке, задишка, свербіж, висипання та кропив'янка)
	частота невідома	астенія

Термін придатності.

5 років.

Умови зберігання.

Для лікарського засобу не вимагається спеціальних умов зберігання. Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері, по 1 або по 2, або по 3, або по 9 блістерів у картонній пачці.

Категорія відпуску.

Без рецепта.

Виробник.

Санека Фармасьютікалз АТ.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Нітрянська 100, 920 27 Глоговець, Словацька Республіка.