ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ЕРІУС ®

(AERIUS®)

Склад:

діюча речовина: дезлоратадин мікронізований;

1 таблетка містить 5 мг дезлоратадину мікронізованого;

допоміжні речовини: кальцію гідрофосфат дигідрат, целюлоза мікрокристалічна, крохмаль кукурудзяний, тальк, Opadry II Blue 32B10817 (лактози моногідрат, гіпромелоза 15ср, титану діоксид (Е 171), поліетиленгліколь, FD&C Blue #2/індигокармін алюмінієвий лак (Е 132)), віск карнаубський.

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: круглі таблетки світло-блакитного кольору з круглим тисненням по центру з одного боку і гладенькі з іншого боку.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні засоби для системного застосування.

Код АТХ R06A X27.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Дезлоратадин – це неседативний антигістамінний препарат тривалої дії, що має селективну антагоністичну дію на периферичні H_1-рецептори. Після перорального застосування дезлоратадин селективно блокує периферичні гістамінові H_1-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 пригнічення 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 (у 10 разів більше максимальної добової клінічної дози) протягом 10 днів, подовження інтервалу QT не спостерігалося.

У пацієнтів з алергічним ринітом Еріус® ефективно усував такі симптоми як чхання, виділення з носа та свербіж, а також подразнення очей, сльозотеча та почервоніння, свербіж піднебіння. Еріус® 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 групи плацебо. У клінічних дослідженнях одноразовий прийом препарату Еріус® у добовій дозі 7,5 мг не чинив впливу на психомоторну активність.

Еріус® ефективно полегшує тяжкість перебігу сезонного алергічного риніту з урахуванням сумарного показника опитувальника по оцінці якості життя при рінокон'юнктивіті. Максимальне покращення відзначалося в пунктах опитувальника, пов'язаних з практичними проблемами і щоденною діяльністю, які обмежували симптоми.

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, включаючи хронічну ідіопатичну кропив'янку.

У двох плацебо контрольованих 6-тижневих дослідженнях з участю пацієнтів з хронічною ідіопатичною кропив'янкою Еріус® 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 свербежу 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 впливає на фармакокінетику дезлоратадину. Також встановлено, що грейпфрутовий сік також не впливає на фармакокінетику дезлоратадину.

Клінічні характеристики.

Показання.

Усунення симптомів, пов'язаних з:

– алергічним ринітом (див. розділ «Фармакологічні властивості»);

– кропив'янкою (див. розділ «Фармакологічні властивості»).

Протипоказання.

Підвищена чутливість до активної речовини або до будь-якої допоміжної 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 спостерігалося.

У клініко-фармакологічних дослідженнях при застосуванні препарату разом з алкоголем, не відзначалося посилення негативного впливу етанолу на психомоторну функцію. Однак у постреєстраційному періоді спостерігалися випадки непереносимості алкоголю та алкогольна інтоксикація під час застосування препарату. Тому необхідно бути обережними при застосуванні алкоголю у період лікування Еріус®.

Особливості застосування.

У хворих з нирковою недостатністю високого ступеня прийом препарату Еріус® слід здійснювати під контролем лікаря.

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.

Пацієнтам з рідкісними спадковими проявами непереносимості галактози, уродженою недостатністю лактози або синдромом мальабсорбції глюкози та галактози не слід приймати цей препарат.

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 Еріус® у цей період не рекомендується.

Годування груддю.

Дезлоратадин проникає у грудне молоко, тому застосування Еріус® 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 відчувають сонливість, що може вплинути на їх 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 у підлітків від 12 до 17 років (див. розділ «Побічні реакції»).

Ефективність та безпечність застосування таблеток Еріус® у дітей віком до 12 років не встановлена.

Передозування.

У разі передозування застосовувати стандартні заходи для видалення неабсорбованої активної речовини. Рекомендується симптоматичне та підтримуюче 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 щодо показань, включаючи алергічний риніт та хронічну ідіопатичну кропив'янку, про небажані ефекти у пацієнтів, які отримували дозу 5 мг на добу, повідомлялося 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 з використанням дезлоратадину (що може проявлятися у вигляді злості та агресії, а також збудженні).

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

Сумарна таблиця частоти побічних реакцій.

Частота появи побічних реакцій класифікується наступним чином: дуже часто (≥1/10), часто (≥1/100, <1/10), непоширені (≥1/1000, <1/100), рідко (≥1/10000, <1/1000), дуже рідко (<1/10000) та частота невідома.

Класи/систем органів	**Частота виникнення**	**Побічні реакції***
Психічні розлади	*дуже рідко*	галюцинації
З боку нервової системи	*часто*	головний біль
	дуже рідко	запаморочення, сонливість, безсоння, психомоторна гіперактивність, судоми, депресивний настрій

З боку серця	*дуже рідко*	тахікардія, прискорене серцебиття
	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, підвищений білірубін, 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
З боку органів зору	*частота невідома*	сухість очей
Загальні порушення	*часто*	підвищена стомлюваність
	дуже рідко	реакції гіперчутливості (такі як анафілаксія, набряк Квінке, задишка, свербіж, висипання та кропив'янка)
	частота невідома	астенія
Розлади метаболізму та харчування	*частота невідома*	підвищення апетиту
Дослідження	*частота невідома*	збільшення ваги

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання.

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

Упаковка.

По 7 таблеток або 10 таблеток у блістері. По 1 блістеру у картонній коробці. По 15 таблеток у блістері. По 2 блістери у картонній коробці.

Категорія відпуску.

Без рецепта.

Виробник.

Байєр Біттерфельд ГмбХ/

Bayer Bitterfeld GmbH.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Ортштайль Греппін, Сейлгастер Шоссе 1, 06803 Біттерфельд-Вольфен, Німеччина/

Ortsteil Greppin, Salegaster Chaussee 1, 06803 Bitterfeld-Wolfen, Germany.