Інструкція

для медичного застосування лікарського засобу

ТИГОФАСТ-120

ТИГОФАСТ-180

(TIGOFAST-120

TIGOFAST-180)

Склад:

діюча речовина: фексофенадину гідрохлорид;

1 таблетка, вкрита плівковою оболонкою, містить фексофенадину гідрохлориду 120 мг або 180 мг;

допоміжні речовини:

таблетки по 120 мг: целюлоза мікрокристалічна, крохмаль кукурудзяний, натрію крохмальгліколят (тип А), кремнію діоксид колоїдний безводний, плівкове покриття Insta Coat White (етилцелюлоза, гідроксипропілметилцелюлоза, титану діоксид (Е 171)), тальк;

таблетки по 180 мг: целюлоза мікрокристалічна, крохмаль кукурудзяний, натрію крохмальгліколят (тип А), кремнію діоксид колоїдний безводний, плівкове покриття Insta Coat Sunset Yellow (етилцелюлоза, гідроксипропілметилцелюлоза, Жовтий захід FCF (Е 110)), тальк.

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості:

таблетки по 120 мг: таблетки, вкриті плівковою оболонкою, круглі, двоопуклі, білого або майже білого кольору;

таблетки по 180 мг: таблетки, вкриті плівковою оболонкою, круглі, двоопуклі, оранжевого кольору.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні препарати для системного застосування.

Код АТХ R06A X26.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Фексофенадину гідрохлорид – неседативний антигістамінний засіб групи антагоністів специфічних рецепторів H_1. Фексофенадин є фармакологічно активним метаболітом терфенадину. Стабілізує мембрани опасистих клітин, перешкоджає виділенню гістаміну. Усуває симптоми алергії: чихання, ринорею, свербіж, почервоніння очей та сльозотечу. Не чинить седативної дії.

Антигістамінний ефект фексофенадину гідрохлориду, що призначався 1 та 2 рази на добу, проявився протягом 1 години, досягнувши максимуму через 6 годин і тривав протягом 24 годин. Ознак розвитку непереносимості не було виявлено навіть після 28-денного прийому. Клінічний ефект спостерігався після одноразових пероральних доз від 10 до 130 мг. Доза в 120 мг достатня для забезпечення 24-годинної ефективності.

Навіть при концентраціях у плазмі крові, що в 32 рази перевищували терапевтичні концентрації, фексофенадин не виявляв впливу на повільні калієві канальці серця людини.

Фексофенадину гідрохлорид (5–10 мг/кг перорально) купірує бронхоспазм антигенного походження у сенсибілізованих тварин та при концентрації вище терапевтичної (10–100 мікромоль) спричиняє вивільнення гістаміну з перитонеальних мастоцитів.

Фармакокінетика.

Фексофенадину гідрохлорид швидко всмоктується після прийому всередину. Максимальна концентрація досягається приблизно через 1–3 години. При добовій дозі 120 мг середня величина максимальної концентрації ≈ 427 нг/мл. При добовій дозі 180 мг середня величина максимальної концентрації ≈ 494 нг/мл.

60-70 % фексофенадину зв’язується з білками плазми крові. Діюча речовина не проникає крізь гематоенцефалічний бар’єр.

Фексофенадин майже не метаболізується (як у печінці, так і поза нею): в сечі та калових масах людини і тварин у значних кількостях виявлено тільки фексофенадин.

Виведення фексофенадину з плазми відбувається з біекспоненціальним зниженням та термінальним періодом напіввиведення від 11 до 15 годин після багаторазового приймання. Кінетика одноразової та багаторазової доз лінійна при пероральних дозах до 120 мг двічі на добу. У стадії насичення дози до 240 мг 2 рази на добу спричиняли збільшення AUC, яке було дещо більше пропорційного (8,8 %). Це вказує на те, що при добових дозах 40–240 мг фармакокінетика фексофенадину майже лінійна.

Більша частина дози виводиться з жовчю, з сечею в незміненому стані виводиться до 10 %.

Мутагенні та канцерогенні властивості.

Різні тести на мутагенність *in vitro* та *in vivo* не виявили наявності у фексофенадину гідрохлориду мутагенних властивостей.

У дослідженні канцерогенності експозицію фексофенадину було визначено (за показниками

плазмової AUC) після застосування терфенадину в ході вторинних фармакокінетичних досліджень. При застосуванні терфенадину щурам та мишам (до 150 мг/кг маси тіла на добу) ознак канцерогенності не виявлено.

Клінічні характеристики.

Показання.

Тигофаст-120: симптоматичне лікування сезонного алергічного риніту у дорослих та дітей віком від 12 років.

Тигофаст-180: симптоматичне лікування хронічної ідіопатичної кропив'янки у дорослих та дітей віком від 12 років.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до компонентів лікарського засобу, вік до 12 років.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Тигофаст не біотрансформується в печінці і тому не взаємодіє з іншими препаратами, які метаболізуються мікросомальними ферментами печінки.

Фексофенадин є субстратом **Р-глікопротеїну (**P-gp**)** та **поліпептиду, що транспортує органічні аніони (**OATP**)**. **Одночасне** застосування фексофенадину з інгібіторами або індукторами P-gp може вплинути на експозицію фексофенадину. При одночасному прийомі Тигофасту з інгібіторами P**-gp** еритроміцином або з кетоконазолом концентрація Тигофасту в плазмі крові підвищується в 2–3 рази. Вказані зміни не супроводжуються зміною інтервалу QT та не спричиняють збільшення частоти побічних реакцій порівняно з частотою побічних реакцій у разі призначення кожного з цих препаратів окремо.

Клінічне дослідження взаємодії між лікарськими засобами показало, що одночасне застосування апалутаміду (слабкого індуктора Р-gp**) і разової пероральної дози 30 мг фексофенадину призводило до 30 % зниження** AUC **фексофенадину.**

Взаємодії Тигофасту та омепразолу не спостерігалося. При прийомі антацидів, які містять алюміній або магній за 15 хвилин до прийому Тигофасту, його біодоступність знижується за рахунок зв'язування в травному тракті. Рекомендується зробити інтервал у 2 години між прийомом Тигофасту та антацидів, які містять алюмінію або магнію гідроксид.

Особливості застосування.

Слід дотримуватись обережності при застосуванні препарату Тигофаст хворим літнього віку та пацієнтам із порушенням печінкової або ниркової функції через недостатність даних.

Пацієнтам, які перенесли у минулому або мають у теперішньому серцево-судинні захворювання, слід мати на увазі, що препарати класу антигістамінів можуть сприяти виникненню таких побічних ефектів як тахікардія та прискорене серцебиття (див. розділ «Побічні реакції»).

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність. Дані про застосування вагітним жінкам недостатні. Нечисленні дослідження на тваринах не вказують на наявність прямого або опосередкованого впливу на вагітність, ембріональний/фетальний розвиток, пологи або постнатальний розвиток. Фексофенадину гідрохлорид не можна застосовувати у період вагітності, окрім випадків нагальної потреби, коли очікувана користь для матері переважає можливий ризик для плода.

Годування груддю. Оскільки фексофенадин проникає у грудне молоко, препарат не можна застосовувати у період годування груддю.

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

На підставі фармакодинамічного профілю та відомих побічних ефектів можна зробити висновок, що прийом Тигофасту не впливає на здатність керувати транспортними засобами та виконувати роботи, які вимагають концентрації уваги. При проведенні об'єктивних досліджень було виявлено, що Тигофаст не чинить значного впливу на функції центральної нервової системи (ЦНС). Однак рекомендується оцінити індивідуальну реакцію на лікарський засіб до того, як починати керування транспортними засобами або виконувати роботи, що потребують концентрації уваги.

Спосіб застосування та дози.

Дорослим та дітям віком від 12 років призначати Тигофаст при сезонному алергічному риніті – 120 мг 1 раз на добу, при хронічній ідіопатичній кропив’янці – 180 мг 1 раз на добу. Приймати всередину перед їдою, запиваючи водою. Тривалість лікування визначати індивідуально, залежно від тяжкості захворювання.

Дітям віком до 12 років

Жодних досліджень щодо вивчення ефективності та переносимості препарату Тигофаст-120 або Тигофаст-180 у дітей віком до 12 років не проводили.

Окремі популяції

Згідно з результатами досліджень з участю пацієнтів з деяких груп ризику (пацієнтів літнього віку, пацієнтів з порушенням функції нирок або печінки) коригування дози таким пацієнтам не потрібно.

Тривалість лікування залежить від перебігу захворювання та визначається лікарем індивідуально.

Діти.

У даному дозуванні препарат не застосовувати дітям віком до 12 років.

Передозування.

Більшість повідомлень про передозування фексофенадину гідрохлориду недостатньо інформативні. Так, було зареєстровано запаморочення, сонливість та сухість у роті.

У разі передозування слід застосовувати звичайні заходи з видалення неабсорбованих діючих речовин. Рекомендується симптоматична та підтримуюча терапія. Видалення фексофенадину гідрохлориду з крові за допомогою гемодіалізу неефективне.

Побічні реакції.

З боку нервової системи: головний біль, сонливість, запаморочення.

З боку органів зору: розмитість зору.

З боку шлунково-кишкового тракту: нудота, діарея, спазми в епігастрії.

Загальні розлади та реакції у місці введення: відчуття підвищеної втомлюваності.

З боку імунної системи: реакції підвищеної чутливості, включаючи набряк Квінке, відчуття стискання у грудях, задишка, почервоніння обличчя та системні анафілактичні реакції, диспное, припливи.

З боку психіки: безсоння, підвищена дратівливість та порушення сну або незвичайні сновидіння (паронірія).

З боку серця: тахікардія, підсилене серцебиття.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: висипання, екзантема, кропив'янка, свербіж.

Лікарський засіб містить барвник «Жовтий захід FCF» (Е 110), що може спричиняти алергічні реакції.

Термін придатності. 2 роки.

Не застосовувати препарат після закінчення терміну придатності.

Умови зберігання.

Зберігати у недоступному для дітей місці. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не

вище 25 ºС.

Упаковка. По 10 таблеток у блістері, по 1 або 3 блістери у пачці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Виробник.

Ананта Медікеар Лімітед.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Чак 17 МЛ, Агро фуд парк Роуд, РІІКО Індастріал Еріа, Удіог Віхар, Шріганганагар-335002 (Раджастан), Індія.

Заявник.

Ананта Медікеар Лтд.

Місцезнаходження заявника.

Сьют 1, 2 Стейшн Корт, Імперіал Варф, Таунмед Роад, Фулхам, Лондон, Велика Британія.

Інструкція

для медичного застосування лікарського засобу

ТИГОФАСТ-120

ТИГОФАСТ-180

(TIGOFAST-120

TIGOFAST-180)

Склад:

діюча речовина: фексофенадину гідрохлорид;

1 таблетка, вкрита плівковою оболонкою, містить фексофенадину гідрохлориду 120 мг або 180 мг;

допоміжні речовини:

таблетки по 120 мг: целюлоза мікрокристалічна, крохмаль кукурудзяний, натрію крохмальгліколят (тип А), кремнію діоксид колоїдний безводний, плівкове покриття Insta Coat White (етилцелюлоза, гідроксипропілметилцелюлоза, титану діоксид (Е 171)), тальк;

таблетки по 180 мг: целюлоза мікрокристалічна, крохмаль кукурудзяний, натрію крохмальгліколят (тип А), кремнію діоксид колоїдний безводний, плівкове покриття Insta Coat Sunset Yellow (етилцелюлоза, гідроксипропілметилцелюлоза, Жовтий захід FCF (Е 110)), тальк.

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості:

таблетки по 120 мг: таблетки, вкриті плівковою оболонкою, круглі, двоопуклі, білого або майже білого кольору;

таблетки по 180 мг: таблетки, вкриті плівковою оболонкою, круглі, двоопуклі, оранжевого кольору.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні препарати для системного застосування.

Код АТХ R06A X26.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Фексофенадину гідрохлорид – неседативний антигістамінний засіб групи антагоністів специфічних рецепторів H_1. Фексофенадин є фармакологічно активним метаболітом терфенадину. Стабілізує мембрани опасистих клітин, перешкоджає виділенню гістаміну. Усуває симптоми алергії: чихання, ринорею, свербіж, почервоніння очей та сльозотечу. Не чинить седативної дії.

Антигістамінний ефект фексофенадину гідрохлориду, що призначався 1 та 2 рази на добу, проявився протягом 1 години, досягнувши максимуму через 6 годин і тривав протягом 24 годин. Ознак розвитку непереносимості не було виявлено навіть після 28-денного прийому. Клінічний ефект спостерігався після одноразових пероральних доз від 10 до 130 мг. Доза в 120 мг достатня для забезпечення 24-годинної ефективності.

Навіть при концентраціях у плазмі крові, що в 32 рази перевищували терапевтичні концентрації, фексофенадин не виявляв впливу на повільні калієві канальці серця людини.

Фексофенадину гідрохлорид (5–10 мг/кг перорально) купірує бронхоспазм антигенного походження у сенсибілізованих тварин та при концентрації вище терапевтичної (10–100 мікромоль) спричиняє вивільнення гістаміну з перитонеальних мастоцитів.

Фармакокінетика.

Фексофенадину гідрохлорид швидко всмоктується після прийому всередину. Максимальна концентрація досягається приблизно через 1–3 години. При добовій дозі 120 мг середня величина максимальної концентрації ≈ 427 нг/мл. При добовій дозі 180 мг середня величина максимальної концентрації ≈ 494 нг/мл.

60-70 % фексофенадину зв’язується з білками плазми крові. Діюча речовина не проникає крізь гематоенцефалічний бар’єр.

Фексофенадин майже не метаболізується (як у печінці, так і поза нею): в сечі та калових масах людини і тварин у значних кількостях виявлено тільки фексофенадин.

Виведення фексофенадину з плазми відбувається з біекспоненціальним зниженням та термінальним періодом напіввиведення від 11 до 15 годин після багаторазового приймання. Кінетика одноразової та багаторазової доз лінійна при пероральних дозах до 120 мг двічі на добу. У стадії насичення дози до 240 мг 2 рази на добу спричиняли збільшення AUC, яке було дещо більше пропорційного (8,8 %). Це вказує на те, що при добових дозах 40–240 мг фармакокінетика фексофенадину майже лінійна.

Більша частина дози виводиться з жовчю, з сечею в незміненому стані виводиться до 10 %.

Мутагенні та канцерогенні властивості.

Різні тести на мутагенність *in vitro* та *in vivo* не виявили наявності у фексофенадину гідрохлориду мутагенних властивостей.

У дослідженні канцерогенності експозицію фексофенадину було визначено (за показниками плазмової AUC) після застосування терфенадину в ході вторинних фармакокінетичних досліджень. При застосуванні терфенадину щурам та мишам (до 150 мг/кг маси тіла на добу) ознак канцерогенності не виявлено.

Клінічні характеристики.

Показання.

Тигофаст-120: симптоматичне лікування сезонного алергічного риніту у дорослих та дітей віком від 12 років.

Тигофаст-180: симптоматичне лікування хронічної ідіопатичної кропив’янки у дорослих та дітей віком від 12 років.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до компонентів лікарського засобу, вік до 12 років.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Тигофаст не біотрансформується в печінці і тому не взаємодіє з іншими препаратами, які метаболізуються мікросомальними ферментами печінки.

Фексофенадин є субстратом **Р-глікопротеїну (**P-gp**)** та **поліпептиду, що транспортує органічні аніони (**OATP**)**. **Одночасне** застосування фексофенадину з інгібіторами або індукторами P-gp може вплинути на експозицію фексофенадину. При одночасному прийомі Тигофасту з інгібіторами P**-gp** еритроміцином або з кетоконазолом концентрація Тигофасту в плазмі крові підвищується в 2–3 рази. Вказані зміни не супроводжуються зміною інтервалу QT та не спричиняють збільшення частоти побічних реакцій порівняно з частотою побічних реакцій у разі призначення кожного з цих препаратів окремо.

Клінічне дослідження взаємодії між лікарськими засобами показало, що одночасне застосування апалутаміду (слабкого індуктора Р-gp**) і разової пероральної дози 30 мг фексофенадину призводило до 30 % зниження** AUC **фексофенадину.**

Взаємодії Тигофасту та омепразолу не спостерігалося. При прийомі антацидів, які містять алюміній або магній за 15 хвилин до прийому Тигофасту, його біодоступність знижується за рахунок зв’язування в травному тракті. Рекомендується зробити інтервал у 2 години між прийомом Тигофасту та антацидів, які містять алюмінію або магнію гідроксид.

Особливості застосування.

Слід дотримуватись обережності при застосуванні препарату Тигофаст хворим літнього віку та пацієнтам із порушенням печінкової або ниркової функції через недостатність даних.

Пацієнтам, які перенесли у минулому або мають у теперішньому серцево-судинні захворювання, слід мати на увазі, що препарати класу антигістамінів можуть сприяти виникненню таких побічних ефектів як тахікардія та прискорене серцебиття (див. розділ «Побічні реакції»).

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність. Дані про застосування вагітним жінкам недостатні. Нечисленні дослідження на тваринах не вказують на наявність прямого або опосередкованого впливу на вагітність, ембріональний/фетальний розвиток, пологи або постнатальний розвиток. Фексофенадину гідрохлорид не можна застосовувати у період вагітності, окрім випадків нагальної потреби, коли очікувана користь для матері переважає можливий ризик для плода.

Годування груддю. Оскільки фексофенадин проникає у грудне молоко, препарат не можна застосовувати у період годування груддю.

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

На підставі фармакодинамічного профілю та відомих побічних ефектів можна зробити висновок, що прийом Тигофасту не впливає на здатність керувати транспортними засобами та виконувати роботи, які вимагають концентрації уваги. При проведенні об'єктивних досліджень було виявлено, що Тигофаст не чинить значного впливу на функції центральної нервової системи (ЦНС). Однак рекомендується оцінити індивідуальну реакцію на лікарський засіб до того, як починати керування транспортними засобами або виконувати роботи, що потребують концентрації уваги.

Спосіб застосування та дози.

Дорослим та дітям віком від 12 років призначати Тигофаст при сезонному алергічному риніті – 120 мг 1 раз на добу, при хронічній ідіопатичній кропив’янці – 180 мг 1 раз на добу. Приймати всередину перед їдою, запиваючи водою. Тривалість лікування визначати індивідуально, залежно від тяжкості захворювання.

Дітям віком до 12 років

Жодних досліджень щодо вивчення ефективності та переносимості препарату Тигофаст-120 або Тигофаст-180 у дітей віком до 12 років не проводили.

Окремі популяції

Згідно з результатами досліджень з участю пацієнтів з деяких груп ризику (пацієнтів літнього віку, пацієнтів з порушенням функції нирок або печінки) коригування дози таким пацієнтам не потрібно.

Тривалість лікування залежить від перебігу захворювання та визначається лікарем індивідуально.

Діти.

У даному дозуванні препарат не застосовувати дітям віком до 12 років.

Передозування.

Більшість повідомлень про передозування фексофенадину гідрохлориду недостатньо інформативні. Так, було зареєстровано запаморочення, сонливість та сухість у роті.

У разі передозування слід застосовувати звичайні заходи з видалення неабсорбованих діючих речовин. Рекомендується симптоматична та підтримуюча терапія. Видалення фексофенадину гідрохлориду з крові за допомогою гемодіалізу неефективне.

Побічні реакції.

З боку нервової системи: головний біль, сонливість, запаморочення.

З боку органів зору: розмитість зору.

З боку шлунково-кишкового тракту: нудота, діарея, спазми в епігастрії.

Загальні розлади та реакції у місці введення: відчуття підвищеної втомлюваності.

З боку імунної системи: реакції підвищеної чутливості, включаючи набряк Квінке, відчуття стискання у грудях, задишка, почервоніння обличчя та системні анафілактичні реакції, диспное, припливи.

З боку психіки: безсоння, підвищена дратівливість та порушення сну або незвичайні сновидіння (паронірія).

З боку серця: тахікардія, підсилене серцебиття.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: висипання, екзантема, кропив'янка, свербіж.

Лікарський засіб містить барвник «Жовтий захід FCF» (Е 110), що може спричиняти алергічні реакції.

Термін придатності. 2 роки.

Не застосовувати препарат після закінчення терміну придатності.

Умови зберігання.

Зберігати у недоступному для дітей місці. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 ºС.

Упаковка. По 10 таблеток у блістері, по 1 або 3 блістери у пачці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Виробник.

Артура Фармасьютікалз Пвт. Лтд.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

1505 Портія Роуд, Шрі Сіті СЕЗ, Сетяведу Мандал, Район Чіттор – 517 588, штат Андхра Прадеш, Індія.

Заявник.

Ананта Медікеар Лтд.

Місцезнаходження заявника.

Сьют 1, 2 Стейшн Корт, Імперіал Варф, Таунмед Роад, Фулхам, Лондон, Велика Британія.

Інструкція

для медичного застосування лікарського засобу

ТИГОФАСТ-120

ТИГОФАСТ-180

(TIGOFAST-120

TIGOFAST-180)

Склад:

діюча речовина: фексофенадину гідрохлорид;

1 таблетка, вкрита плівковою оболонкою, містить фексофенадину гідрохлориду 120 мг або 180 мг;

допоміжні речовини:

таблетки по 120 мг: целюлоза мікрокристалічна, крохмаль кукурудзяний, натрію крохмальгліколят (тип А), кремнію діоксид колоїдний безводний, плівкове покриття Insta Coat White (етилцелюлоза, гідроксипропілметилцелюлоза, титану діоксид (Е 171)), тальк;

таблетки по 180 мг: целюлоза мікрокристалічна, крохмаль кукурудзяний, натрію крохмальгліколят (тип А), кремнію діоксид колоїдний безводний, плівкове покриття Insta Coat Sunset Yellow (етилцелюлоза, гідроксипропілметилцелюлоза, Жовтий захід FCF (Е 110)), тальк.

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості:

таблетки по 120 мг: таблетки, вкриті плівковою оболонкою, круглі, двоопуклі, білого або майже білого кольору;

таблетки по 180 мг: таблетки, вкриті плівковою оболонкою, круглі, двоопуклі, оранжевого кольору.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні препарати для системного застосування.

Код АТХ R06A X26.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Фексофенадину гідрохлорид – неседативний антигістамінний засіб групи антагоністів специфічних рецепторів H_1. Фексофенадин є фармакологічно активним метаболітом терфенадину. Стабілізує мембрани опасистих клітин, перешкоджає виділенню гістаміну. Усуває симптоми алергії: чихання, ринорею, свербіж, почервоніння очей та сльозотечу. Не чинить седативної дії.

Антигістамінний ефект фексофенадину гідрохлориду, що призначався 1 та 2 рази на добу, проявився протягом 1 години, досягнувши максимуму через 6 годин і тривав протягом 24 годин. Ознак розвитку непереносимості не було виявлено навіть після 28-денного прийому. Клінічний ефект спостерігався після одноразових пероральних доз від 10 до 130 мг. Доза в 120 мг достатня для забезпечення 24-годинної ефективності.

Навіть при концентраціях у плазмі крові, що в 32 рази перевищували терапевтичні концентрації, фексофенадин не виявляв впливу на повільні калієві канальці серця людини.

Фексофенадину гідрохлорид (5–10 мг/кг перорально) купірує бронхоспазм антигенного походження у сенсибілізованих тварин та при концентрації вище терапевтичної (10–100 мікромоль) спричиняє вивільнення гістаміну з перитонеальних мастоцитів.

Фармакокінетика.

Фексофенадину гідрохлорид швидко всмоктується після прийому всередину. Максимальна концентрація досягається приблизно через 1–3 години. При добовій дозі 120 мг середня величина максимальної концентрації ≈ 427 нг/мл. При добовій дозі 180 мг середня величина максимальної концентрації ≈ 494 нг/мл.

60-70 % фексофенадину зв’язується з білками плазми крові. Діюча речовина не проникає крізь гематоенцефалічний бар’єр.

Фексофенадин майже не метаболізується (як у печінці, так і поза нею): в сечі та калових масах людини і тварин у значних кількостях виявлено тільки фексофенадин.

Виведення фексофенадину з плазми відбувається з біекспоненціальним зниженням та термінальним періодом напіввиведення від 11 до 15 годин після багаторазового приймання. Кінетика одноразової та багаторазової доз лінійна при пероральних дозах до 120 мг двічі на добу. У стадії насичення дози до 240 мг 2 рази на добу спричиняли збільшення AUC, яке було дещо більше пропорційного (8,8 %). Це вказує на те, що при добових дозах 40–240 мг фармакокінетика фексофенадину майже лінійна.

Більша частина дози виводиться з жовчю, з сечею в незміненому стані виводиться до 10 %.

Мутагенні та канцерогенні властивості.

Різні тести на мутагенність *in vitro* та *in vivo* не виявили наявності у фексофенадину гідрохлориду мутагенних властивостей.

У дослідженні канцерогенності експозицію фексофенадину було визначено (за показниками плазмової AUC) після застосування терфенадину в ході вторинних фармакокінетичних досліджень. При застосуванні терфенадину щурам та мишам (до 150 мг/кг маси тіла на добу) ознак канцерогенності не виявлено.

Клінічні характеристики.

Показання.

Тигофаст-120: симптоматичне лікування сезонного алергічного риніту у дорослих та дітей віком від 12 років.

Тигофаст-180: симптоматичне лікування хронічної ідіопатичної кропив’янки у дорослих та дітей віком від 12 років.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до компонентів лікарського засобу, вік до 12 років.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Тигофаст не біотрансформується в печінці і тому не взаємодіє з іншими препаратами, які метаболізуються мікросомальними ферментами печінки.

Фексофенадин є субстратом **Р-глікопротеїну (**P-gp**)** та **поліпептиду, що транспортує органічні аніони (**OATP**)**. **Одночасне** застосування фексофенадину з інгібіторами або індукторами P-gp може вплинути на експозицію фексофенадину. При одночасному прийомі Тигофасту з інгібіторами P**-gp** еритроміцином або з кетоконазолом концентрація Тигофасту в плазмі крові підвищується в 2–3 рази. Вказані зміни не супроводжуються зміною інтервалу QT та не спричиняють збільшення частоти побічних реакцій порівняно з частотою побічних реакцій у разі призначення кожного з цих препаратів окремо.

Клінічне дослідження взаємодії між лікарськими засобами показало, що одночасне застосування апалутаміду (слабкого індуктора Р-gp**) і разової пероральної дози 30 мг фексофенадину призводило до 30 % зниження** AUC **фексофенадину.**

Взаємодії Тигофасту та омепразолу не спостерігалося. При прийомі антацидів, які містять алюміній або магній за 15 хвилин до прийому Тигофасту, його біодоступність знижується за рахунок зв’язування в травному тракті. Рекомендується зробити інтервал у 2 години між прийомом Тигофасту та антацидів, які містять алюмінію або магнію гідроксид.

Особливості застосування.

Слід дотримуватись обережності при застосуванні препарату Тигофаст хворим літнього віку та пацієнтам із порушенням печінкової або ниркової функції через недостатність даних.

Пацієнтам, які перенесли у минулому або мають у теперішньому серцево-судинні захворювання, слід мати на увазі, що препарати класу антигістамінів можуть сприяти виникненню таких побічних ефектів як тахікардія та прискорене серцебиття (див. розділ «Побічні реакції»).

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність. Дані про застосування вагітним жінкам недостатні. Нечисленні дослідження на тваринах не вказують на наявність прямого або опосередкованого впливу на вагітність, ембріональний/фетальний розвиток, пологи або постнатальний розвиток. Фексофенадину гідрохлорид не можна застосовувати у період вагітності, окрім випадків нагальної потреби, коли очікувана користь для матері переважає можливий ризик для плода.

Годування груддю. Оскільки фексофенадин проникає у грудне молоко, препарат не можна застосовувати у період годування груддю.

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

На підставі фармакодинамічного профілю та відомих побічних ефектів можна зробити висновок, що прийом Тигофасту не впливає на здатність керувати транспортними засобами та виконувати роботи, які вимагають концентрації уваги. При проведенні об'єктивних досліджень було виявлено, що Тигофаст не чинить значного впливу на функції центральної нервової системи (ЦНС). Однак рекомендується оцінити індивідуальну реакцію на лікарський засіб до того, як починати керування транспортними засобами або виконувати роботи, що потребують концентрації уваги.

Спосіб застосування та дози.

Дорослим та дітям віком від 12 років призначати Тигофаст при сезонному алергічному риніті – 120 мг 1 раз на добу, при хронічній ідіопатичній кропив’янці – 180 мг 1 раз на добу. Приймати всередину перед їдою, запиваючи водою. Тривалість лікування визначати індивідуально, залежно від тяжкості захворювання.

Дітям віком до 12 років

Жодних досліджень щодо вивчення ефективності та переносимості препарату Тигофаст-120 або Тигофаст-180 у дітей віком до 12 років не проводили.

Окремі популяції

Згідно з результатами досліджень з участю пацієнтів з деяких груп ризику (пацієнтів літнього віку, пацієнтів з порушенням функції нирок або печінки) коригування дози таким пацієнтам не потрібно.

Тривалість лікування залежить від перебігу захворювання та визначається лікарем індивідуально.

Діти.

У даному дозуванні препарат не застосовувати дітям віком до 12 років.

Передозування.

Більшість повідомлень про передозування фексофенадину гідрохлориду недостатньо інформативні. Так, було зареєстровано запаморочення, сонливість та сухість у роті.

У разі передозування слід застосовувати звичайні заходи з видалення неабсорбованих діючих речовин. Рекомендується симптоматична та підтримуюча терапія. Видалення фексофенадину гідрохлориду з крові за допомогою гемодіалізу неефективне.

Побічні реакції.

З боку нервової системи: головний біль, сонливість, запаморочення.

З боку органів зору: розмитість зору.

З боку шлунково-кишкового тракту: нудота, діарея, спазми в епігастрії.

Загальні розлади та реакції у місці введення: відчуття підвищеної втомлюваності.

З боку імунної системи: реакції підвищеної чутливості, включаючи набряк Квінке, відчуття стискання у грудях, задишка, почервоніння обличчя та системні анафілактичні реакції, диспное, припливи.

З боку психіки: безсоння, підвищена дратівливість та порушення сну або незвичайні сновидіння (паронірія).

З боку серця: тахікардія, підсилене серцебиття.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: висипання, екзантема, кропив'янка, свербіж.

Лікарський засіб містить барвник «Жовтий захід FCF» (Е 110), що може спричиняти алергічні реакції.

Термін придатності. 2 роки.

Не застосовувати препарат після закінчення терміну придатності.

Умови зберігання.

Зберігати у недоступному для дітей місці. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 ºС.

Упаковка. По 10 таблеток у блістері, по 1 або 3 блістери у пачці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Виробник.

Фламінго Фармасьютикалс Лтд.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Е-28, Опп. Фаєр Брігейд, М.І.Д.С., Талоджа, Район Райгад, Махараштра, ІН– 410208, Індія.

Заявник.

Ананта Медікеар Лтд.

Місцезнаходження заявника.

Сьют 1, 2 Стейшн Корт, Імперіал Варф, Таунмед Роад, Фулхам, Лондон, Велика Британія.