ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

Дезрадин®

(Desradin®)

Склад:

діюча речовина: дезлоратадин;

1 таблетка, вкрита плівковою оболонкою, містить 5 мг дезлоратадину;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, гіпромелоза, кислота хлористоводнева, натрію гідроксид, крохмаль кукурудзяний (висушений), лактози моногідрат, тальк, макрогол 400, титану діоксид (Е 171), індигокармін (Е 132).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: блакитні круглі таблетки, вкриті плівковою оболонкою зі скошеними краями.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні засоби – антагоністи H_1-рецепторів.

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 введення дезлоратадин селективно блокує периферичні гістамінові H_1-рецептори. Дезлоратадин є первинним активним метаболітом лоратадину.

У дослідженнях *in vitro* дезлоратадин продемонстрував на клітинах ендотелію свої антиалергічні 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.

Численні дослідження показали, що, крім антигістамінної активності, препарат чинить протиалергічну та протизапальну дію.

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.

Препарат не проникає крізь гематоенцефалічний бар'єр. Не впливає на серцево-судинну систему, не спричиняє подовження інтервалу QT на ЕКГ. Не впливає на центральну нервову систему, не уповільнює швидкість психомоторних реакцій, не спричиняє седативного ефекту. Попереджає розвиток і полегшує протікання алергічних реакцій, чинить протисвербіжну та протиексудативну дію (зменшує проникність капілярів, попереджає розвиток набряку тканин, спазму гладкої мускулатури).

Дезлоратадин не проникає у центральну нервову систему та не впливає на психомоторну функцію.

У пацієнтів з алергічним ринітом дезлоратадин ефективно усував такі симптоми як чхання, виділення з носа та свербіж, а також подразнення очей, сльозотеча та почервоніння, свербіж піднебіння. Дезлоратадин ефективно контролював симптоми упродовж 24 годин.

Фармакокінетика.

Абсорбція

Концентрації дезлоратадину у плазмі крові можна визначити через 30 хвилин після застосування. 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 фармакокінетичному дослідженні, в якому демографічні дані пацієнтів порівняли з загальною популяцією з сезонними алергічними ринітами, у 4 % випробовуваних спостерігалася більш висока концентрація дезлоратадину. Цей відсоток може змінюватися залежно від етнічного походження. Максимальна концентрація дезлоратадину була приблизно в 3 рази вищою орієнтовно через 7 годин із термінальним періодом напіввиведення приблизно 89 годин. Профіль безпеки цих суб'єктів не відрізнявся від профілю загальної популяції.

Розподіл

Дезлоратадин помірно зв'язується з білками плазми крові (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

Ферменту, який відповідає за метаболізм дезлоратадину, поки ще не виявлено, тому неможливо повністю виключити деякі взаємодії з іншими лікарськими препаратами. Дезлоратадин не інгібує CYP3A4 *in vivo*, дослідження *in vitro* продемонстрували, що лікарський препарат не інгібує CYP2D6, субстрат або інгібітор Р-глікопротеїну.

Виведення.

У дослідженні одноразового прийому дезлоратадину в дозі 7,5 мг не виявлено впливу їжі (жирний висококалорійний сніданок) на фармакокінетику дезлоратадину. В іншому дослідженні встановлено, що грейпфрутовий сік не впливає на фармакокінетику дезлоратадину.

Клінічні характеристики.

Показання.

Усунення симптомів, пов'язаних із:

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

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

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 при сумісному застосуванні таблеток дезлоратадину з еритроміцином або кетоконазолом жодних клінічно значущих взаємодій не спостерігалося (див. розділ «Фармакодинаміка»).

Діти.

Дослідження взаємодії провидили з участю дорослих пацієнтів.

У клініко-фармакологічних дослідженнях при застосуванні препарату разом з алкоголем не відзначалося посилення негативного впливу етанолу на зниження продуктивності (див. розділ «Фармакодинаміка»). Однак у постреєстраційному періоді спостерігалися випадки непереносимості алкоголю та алкогольна інтоксикація під час застосування препарату. Тому необхідно бути обережними при супутньому застосуванні з алкоголем.

Особливості застосування.

Пацієнтам із тяжкою нирковою недостатністю прийом препарату слід здійснювати під контролем лікаря (див. розділ «Фармакокінетика»).

Дезлоратадин слід призначати з обережністю пацієнтам, які мали напад судом в анамнезі/сімейному анамнезі, особливо дітям (див. розділ «Побічні реакції»), які можуть бути

більш чутливими до розвитку нового нападу судом під час лікування дезлоратадином. Лікар має ухвалити рішення щодо припинення лікування дезлоратадином пацієнтів, у яких під час застосування препарату спостерігався напад судом.

Особливі застереження щодо неактивних інгредієнтів

Дезрадин® містить лактозу. Пацієнтам із 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.

Вагітність

Дезлоратадин не продемонстрував тератогенність у дослідженнях на тваринах.

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

Годування груддю

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

Фертильність

Відсутні доступні дані щодо впливу на фертильність чоловіків та жінок.

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

Дезлоратадин не впливає або має незначний вплив на здатність керувати транспортними засобами та іншими механізмами на основі клінічних випробувань. Пацієнтам слід повідомити, що більшість людей не відчуває сонливості. Однак, оскільки існують індивідуальні відмінності щодо реакції на будь-які лікарські засоби, рекомендується радити пацієнтам не займатися діяльністю, що вимагає концентрації уваги, наприклад, керувати автомобілем або працювати з іншими механізмами, поки вони не встановлять власну реакцію на лікарський засіб.

Спосіб застосування та дози.

Дорослі та діти віком від 12 років

Рекомендованою дозою препарату Дезрадин® є 1 таблетка 1 раз на добу.

Лікування інтермітуючого алергічного риніту (присутність симптомів менше 4 днів на тиждень або менше 4 тижнів) здійснюється з урахуванням історії хвороби пацієнта до усунення симптомів та може бути поновлене при їх повторній появі. При лікуванні персистуючого алергічного риніту (присутність симптомів більше 4 днів на тиждень або більше 4 тижнів)

можна пропонувати пацієнтам тривале лікування упродовж періодів дії алергену.

Спосіб застосування

Застосовувати препарат перорально незалежно від прийому їжі.

Діти.

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

Ефективність та безпека застосування таблеток Дезрадин® у дітей віком до 12 років не встановлена.

Передозування.

Діти та дорослі пацієнти.

Профіль побічних реакцій, пов’язаний із передозуванням, який спостерігається під час постмаркетингового застосування, схожий на той, що спостерігається у терапевтичних дозах, але ефекти можуть бути сильнішими.

Лікування

У разі передозування слід застосовувати стандартні заходи для видалення неабсорбованої активної речовини. Рекомендується симптоматичне та підтримувальне лікування.

Дезлоратадин не видаляється шляхом гемодіалізу. Можливість його видалення при перитонеальному діалізі не встановлена.

Симптоми

У клінічних дослідженнях, у яких дезлоратадин вводили у дозах 45 мг (що у 9 разів перевищували рекомендовані), клінічно значущі небажані реакції не спостерігалися.

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, повідомляли на 3 % частіше, ніж у пацієнтів, які отримували плацебо.

Найчастіше, порівняно з плацебо, повідомляли про такі побічні ефекти як підвищена втомлюваність (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 застосуванням дезлоратадину (що може проявлятися у вигляді злості та агресії, а також збудженні).

Інші побічні реакції, про які повідомляли протягом постмаркетингового періоду, у дітей з невідомою частотою, включали подовження інтервалу QT, аритмію і 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.

З боку обміну речовин:

частота невідома: підвищений апетит.

З боку психіки:

дуже рідко: галюцинації;

частота невідома: аномальна поведінка, агресія, пригнічений настрій.

З боку нервової системи:

часто: головний біль;

дуже рідко: запаморочення, сонливість, безсоння, психомоторна гіперактивність, судоми.

З боку органів зору.

частота невідома: сухість очей.

З боку серця:

дуже рідко: тахікардія, відчуття серцебиття;

частота невідома: подовження QT інтервалу, суправентрикулярна тахіаритмія.

З боку шлунково-кишкового тракту:

часто: сухість у роті;

дуже рідко: біль у животі, нудота, блювання, диспепсія, діарея.

З боку печінки та жовчовивідних шляхів:

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.

Загальні порушення:

часто: підвищена стомлюваність;

дуже рідко: реакції гіперчутливості (такі як анафілаксія, набряк Квінке, задишка, свербіж, висипи та кропив'янка);

частота невідома: астенія.

Дослідження:

частота невідома: збільшення маси тіла.

Ретроспективне обсерваційне дослідження з безпеки виявило збільшену частоту нових нападів судом у пацієнтів віком від 0 до 19 років під час прийому дезлоратадину, порівняно з періодами, коли вони не отримували дезлоратадин.

Серед дітей віком 0–4 років скориговане абсолютне збільшення становило 37,5 (95 % довірчий інтервал (ДІ) 10,5–64,5) на 100000 людино-років (ЛР) з попереднім рівнем нападів, що почалися, 80,3 на 100000 ЛР. Серед пацієнтів віком 5–19 років скориговане абсолютне збільшення становило 11,3 (95 % ДІ 2,3–20,2) на 100000 ЛР з попереднім показником 36,4 на 100000 ЛР (див. розділ «Особливості застосування».

Звіт про підозрювані побічні реакції

Звіт про передбачувані побічні реакції після реєстрації лікарського засобу має важливе значення. Це дає змогу вести безперервне спостереження балансу користь/ризик застосування лікарського засобу. Спеціалісти у галузі охорони здоров'я зобов'язані подавати інформацію про будь-які підозрювані побічні реакції за допомогою національної системи звітності.

Термін придатності.

5 років.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 30 °С в оригінальній упаковці для захисту від дії вологи. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері; по 1 або по 3 блістери у картонній коробці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Виробник.

КРКА, д.д., Ново место, Словенія/

KRKA, d.d., Novo mesto, Slovenia.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Шмар’єшка цеста 6, 8501 Ново место, Словенія/

Smarjeska cesta 6, 8501 Novo mesto, Slovenia.