

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

БЛОГІР-3

Склад:

діюча речовина: дезлоратадин;

1 таблетка містить 5 мг дезлоратадину;

допоміжні речовини: калію полакрилін; кислота лимонна, моногідрат; заліза оксид червоний (E 172); магнію стеарат; ароматизатор рідкий зі смаком тутті-фрутті; натрію кроскармелоза; аспартам (E 951); целюлоза мікрокристалічна; маніт (E 421).

Лікарська форма. Таблетки, що диспергуються в ротовій порожнині.

Основні фізико-хімічні властивості: круглі плоскі таблетки коричнево-рожевого кольору з вкрапленнями, зі скошеними краями та тисненням «5» на одному боці.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні засоби для системного застосування.

Код АТХ R06A X27.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Дезлоратадин – це неседативний антигістамінний препарат тривалої дії, що чинить 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 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 спостерігалось.

У пацієнтів з алергічним ринітом дезлоратадин ефективно усував такі симптоми, як чхання, виділення з носа та свербіж, а також подразнення очей, слезотечу та почервоніння, свербіж піднебіння. Дезлоратадин 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 дезлоратадину у добовій дозі 7,5 мг не чинив впливу на психомоторну активність.

Дезлоратадин ефективно полегшує тяжкість перебігу сезонного алергічного риніту з урахуванням сумарного показника опитувальника по оцінці якості життя при ринокон'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.

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 дезлоратадину або до інших компонентів препарату, або 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.

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.

Особливості застосування.

У хворих з нирковою недостатністю високого ступеня прийом дезлоратадину слід здійснювати під контролем лікаря. Пацієнтам із рідкісними спадковими проявами непереносимості галактози, уродженою недостатністю лактози або синдромом мальабсорбції глюкози та галактози не слід приймати цей препарат. Хворим із фенілкетонурією не слід приймати цей препарат через вміст аспартаму. Препарат містить менше ніж 1 ммоль сполук натрію, тобто практично вільний від натрію.

Дезлоратадин необхідно з обережністю призначати хворим, які мали напади судом в анамнезі. Діти можуть бути більш чутливими до розвитку нового нападу судом під час лікування дезлоратадином (див. розділ «Побічні реакції»). 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.

Дезлоратадин не продемонстрував тератогенності у дослідженнях на тваринах. Безпека застосування препарату під час вагітності не встановлена, тому застосування дезлоратадину під час вагітності не рекомендується.

Годування груддю.

Дезлоратадин проникає у грудне молоко, тому застосування препарату 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 їх здатність керувати автомобілем та складною технікою.

Спосіб застосування та дози.

Дорослим та підліткам (віком від 12 років) застосовувати по 1 таблетці 1 раз на добу незалежно від вживання їжі, для усунення симптомів, асоційованих з алергічним ринітом (включаючи інтермітуючий та персистуючий алергічний риніт) та кропив'яркою. Не слід запивати водою або іншою рідиною. Таблетку слід приймати одразу після розкриття блістера.

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 безпека застосування дезлоратадину дітям віком до 12 років не встановлена.

Передозування.

У разі передозування слід 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 застосування препарату за показаннями, включаючи алергічний риніт та хронічну ідіопатичну кропив'янку, про побічні реакції 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 реакції, як стомлюваність (1,2 %), сухість у роті (0,8 %) та головний біль (0,6 %).

Діти. У клінічних дослідженнях за участю 578 підлітків віком від 12 до 17 років найбільш розповсюдженою побічною реакцією був головний біль, він спостерігався у 5,9 % пацієнтів, які приймали дезлоратадин, і 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.

Інші побічні реакції, що виникають при застосуванні препарату, про які дуже рідко повідомлялося під час постмаркетингового періоду, класифіковані за системами органів та частотою їх прояву: 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 ($< 1/10000$); частота невідома (не підлягає оцінці з огляду на обмеженість наявних даних).

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 серцево-судинної системи

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 печінки та жовчовивідних шляхів

Дуже рідко: збільшення рівня ферментів печінки, підвищення білірубіну, гепатит.

Частота невідома: жовтяниця.

З боку органів зору

Частота невідома: сухість очей.

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 підвищеної чутливості (такі як анафілаксія, набряк Квінке, задишка, свербіж, висипання та кропив'янка).

Частота невідома: астенія.

Результати досліджень

Частота невідома: збільшення маси тіла.

З боку метаболізму та харчування

Частота невідома: підвищення апетиту.

Повідомлялося про збільшення частоти нападів судом у пацієнтів віком від 0 до 19 років після застосування дезлоратадину. Серед дітей віком 0-4 років збільшення становило 37,5 на 100000 пацієнто-років, тоді як для пацієнтів віком 5-19 років цей показник становив 11,3 на 100000 пацієнто-років (див. розділ «Особливості застосування»).

Повідомлення про підозрювані побічні реакції

Повідомлення про підозрювані побічні реакції після реєстрації лікарського засобу є важливою процедурою. Це дозволяє продовжувати моніторинг співвідношення «користь/ризик» для відповідного лікарського засобу. Медичним працівникам необхідно повідомляти про будь-які підозрювані побічні реакції через національну систему повідомлень.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

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

Категорія відпуску.

Без рецепта.

Виробник.

Белупо, ліки та косметика, д.д.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Вул. Даніца 5, 48000 Копривниця, Хорватія.