



Листок-вкладыш лекарственного средства ДЕЗЛОРАТАДИН

*Прочитайте внимательно этот листок-вкладыш, прежде чем применять препарат!
Храните этот листок-вкладыш. Вам может понадобиться перечитать его. Если у Вас возникнут дополнительные вопросы, пожалуйста, проконсультируйтесь с Вашим врачом.*

*Этот препарат предназначен лично Вам и не следует передавать его другим лицам.
Это может навредить им, даже если симптомы их заболевания схожи с теми, которые наблюдаются у Вас.*

Торговое название

ДЕЗЛОРАТАДИН, таблетки, покрытые оболочкой, 5 мг

Международное непатентованное название

Desloratadine

Форма выпуска

Таблетки, покрытые оболочкой

Состав

Одна таблетка содержит:

действующее вещество: дезлоратадин 5 мг;

вспомогательные вещества: кальция гидрофосфата дигидрат, целлюлоза микрокристаллическая, крахмал кукурузный, тальк, воск карнаубский, воск белый;

оболочка: лактозы моногидрат, гипромеллоза, титана диоксид (Е 171), полиэтиленгликоль, индигокармин (Е 132).

Описание

Таблетки круглой формы, покрытые оболочкой, голубого цвета с верхней и нижней выпуклыми поверхностями.

Фармакотерапевтическая группа

Антигистаминные средства для системного применения. Прочие антигистаминные препараты для системного применения.

Код АТС: R06AX27

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Дезлоратадин является селективным блокатором периферических гистаминных H_1 -рецепторов, не вызывающий седативного эффекта. Дезлоратадин – первичный активный метаболит лоратадина. В ходе доклинических исследований дезлоратадина и лоратадина качественных или количественных расхождений токсичности двух препаратов в сравнительных дозах (с учетом концентрации дезлоратадина) не обнаружено.

После перорального приема препарат селективно блокирует периферические H_1 -гистаминные рецепторы и не проникает через гематоэнцефалический барьер.

В исследованиях *in vitro* дезлоратадин продемонстрировал противоаллергическое действие. Установлено, что дезлоратадин подавляет выделение провоспалительных цитокинов, таких как ИЛ-4, ИЛ-6, ИЛ-8 и ИЛ-13 из тучных клеток/базофилов человека, а также подавляет экспрессию молекул адгезии, таких как Р-селектин на эндотелиальных клетках. Клиническая значимость этих наблюдений нуждается в дальнейшем подтверждении.

Есть данные о ежедневном применении дезлоратадина в дозе до 20 мг в течение 14 дней, которое не сопровождалось статистически достоверными клинически значимыми изменениями

со стороны сердечно-сосудистой системы. В ходе исследования применение дезлоратадина 45 мг/сутки (в 9 раз выше терапевтической дозы) в течение 10 дней не вызывало удлинения интервала QT.

Дезлоратадин не проникает через гематоэнцефалический барьер. При применении рекомендованной дозы 5 мг частота сонливости не превышала такую в группе плацебо. В ходе исследований дезлоратадин не влиял на психомоторную функцию при приеме дозы до 7,5 мг.

Фармакокинетика

Всасывание

Дезлоратадин начинает определяться в плазме в течение 30 минут после приема. Максимальная концентрация дезлоратадина в плазме достигается в среднем через 3 часа, период полувыведения составляет в среднем 27 часов. Степень кумуляции дезлоратадина соответствует его периоду полувыведения (приблизительно 27 часов) и кратности применения (один раз в сутки). Биодоступность дезлоратадина была пропорциональна дозе в диапазоне от 5 до 20 мг.

В фармакокинетическом исследовании, в котором демографические показатели пациентов были сопоставимы с таковыми в целом у населения с сезонными аллергическими ринитами, у 4 % испытуемых были более высокие концентрации дезлоратадина. Этот процент может варьировать в зависимости от этнического происхождения. Максимальная концентрация дезлоратадина была примерно в 3 раза больше приблизительно через 7 часов с периодом терминальной фазы полувыведения примерно 89 часов. Профиль безопасности у этих субъектов ничем не отличался от общего профиля безопасности населения.

Распределение

Дезлоратадин умеренно (83-87 %) связывается с белками плазмы. При применении дезлоратадина в дозе от 5 до 20 мг один раз в сутки в течение 14 дней признаков клинически значимой кумуляции препарата не обнаружено.

Биотрансформация

Дезлоратадин (основной метаболит лоратадина) интенсивно метаболизируется до 3-гидроксидезлоратадина, активного метаболита, который впоследствии глюкуронируется.

Фермент, отвечающий за метаболизм дезлоратадина, пока не известен, поэтому нельзя полностью исключать взаимодействия с некоторыми лекарственными средствами.

Данные клинических исследований указывают на то, что у некоторой подгруппы населения в целом снижена способность формировать 3-гидроксидезлоратадин и замедлен метаболизм дезлоратадина. В фармакокинетических исследованиях (n=3748) примерно 6 % из испытуемых были медленными метаболиторами дезлоратадина (определяются как субъекты с соотношением AUC 3-гидроксидезлоратадина к дезлоратадину менее 0,1 или субъекты с периодом полувыведения дезлоратадина, превышающим 50 часов). Эти фармакокинетические исследования включали в себя группы в возрасте от 2 до 70 лет, включая 977 испытуемых в возрасте от 2 до 5 лет, 1575 испытуемых в возрасте от 6 до 11 лет и 1196 испытуемых возраст от 12 до 70 лет. Не было никакой разницы в распространенности медленных метаболиторов в разных возрастных группах. Частота встречаемости медленных метаболиторов была выше у чернокожих (17 %, n=988) по сравнению с европеоидами (2 %, n=1462) и латиноамериканцами (2 %, n=1,063). Медиана воздействия (AUC) дезлоратадина у медленных метаболиторов была примерно в 6 раз больше, чем у испытуемых, которые не являлись медленными метаболиторами. Субъекты, которые являются плохими метаболиторами дезлоратадина, не могут быть проспективно идентифицированы и будут подвергнуты воздействию более высоких уровней дезлоратадина после дозирования рекомендуемой дозой дезлоратадина. В мультидозных клинических исследованиях безопасности, там, где был выявлен статус метаболитора, в общей сложности было зарегистрировано 94 плохих метаболитора и 123 нормальных метаболитора, которые лечились с помощью дезлоратадина в форме перорального раствора в течение 15-35 дней. В этих исследованиях не наблюдалось никаких общих различий в безопасности между медленными метаболиторами и нормальными метаболиторами. Несмотря на то, что в этих исследованиях не наблюдалось увеличенной частоты развития побочных эффектов, связанных с воздействием препарата, повышенный риск их не исключается у пациентов, которые являются медленными метаболиторами дезлоратадина.

Выведение

Дезлоратадин выводится из организма в виде глюкуронидного соединения и в небольшом количестве (менее 2 % с мочой и менее 7 % с калом) в неизмененном виде. $T_{1/2}$ составляет в среднем 27 ч (20-30 ч).

В исследовании с однократным приемом дезлоратадина в дозе 7,5 мг установлено, что пища (жирный высококалорийный завтрак) или грейпфрутовый сок не влияют на распределение дезлоратадина.

Пациенты с нарушением функции почек

Фармакокинетику дезлоратадина у пациентов с хронической почечной недостаточностью (ХПН) сравнивали с фармакокинетикой у здоровых добровольцев при применении однократных и многократных доз. В исследовании при применении однократной дозы воздействие дезлоратадина было примерно в 2 и 2,5 раза выше у пациентов с легкой или средней и тяжелой ХПН, соответственно, чем у здоровых добровольцев. В исследовании при применении многократных доз равновесное состояние было достигнуто через 11 дней, и по сравнению со здоровыми добровольцами воздействие дезлоратадина было около в 1,5 раза выше у пациентов с легкой или средней ХПН и в около 2,5 раза выше у пациентов с тяжелой ХПН. В обоих исследованиях изменения в экспозиции (AUC и C_{max}) дезлоратадина и 3-гидроксидезлоратадина не были клинически значимыми.

Пациенты с нарушением функции печени

У пациентов с печеночной недостаточностью AUC увеличивается в 2,4 раза по сравнению с данными у здоровых добровольцев. Общий клиренс дезлоратадина при пероральном приеме у пациентов с легкой, средней и тяжелой печеночной недостаточностью составляет 37 %, 36 % и 28 % соответственно (по сравнению с данными у здоровых добровольцев). Отмечается увеличение $T_{1/2}$ дезлоратадина у пациентов с печеночной недостаточностью.

C_{max} и AUC 3-гидроксидезлоратадина у пациентов с печеночной недостаточностью не отличаются от данных у здоровых людей с нормальной функцией печени.

Пациенты пожилого возраста

У пациентов пожилого возраста (≥ 65 лет; $n=17$) после введения нескольких доз дезлоратадина в таблетках средние значения C_{max} и AUC были на 20 % выше, чем у более молодых пациентов (<65 лет). Общий клиренс, стандартизованный по массе тела, был похож между двумя возрастными группами. Средний период полувыведения дезлоратадина из плазмы составил 33,7 ч у пациентов ≥ 65 лет. Фармакокинетика 3-гидроксидезлоратадина не отличалась в группах сравнения. Эти возрастные различия вряд ли могут быть клинически значимыми, и коррекция дозировки у пожилых пациентов не рекомендуется.

Показания для применения

Препарат применяется у взрослых и подростков в возрасте от 12 лет и старше для облегчения симптомов, связанных с:

- аллергическим ринитом,
- крапивницей.

Способ применения и дозы

Препарат принимают внутрь независимо от приема пищи.

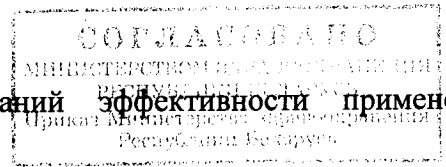
Рекомендуемая доза для взрослых и подростков в возрасте от 12 лет и старше – 1 таблетка (5 мг) 1 раз в сутки.

Терапию интермиттирующего аллергического ринита (наличие симптомов менее 4 дней в неделю или менее 4 недель) необходимо проводить с учетом данных анамнеза: прекратить после исчезновения симптомов и возобновить после повторного их возникновения.

При персистирующем аллергическом рините (наличие симптомов 4 и более дней в неделю или более 4 недель) необходимо продолжать лечение в течение всего периода контакта с аллергеном.

Дети

Эффективность и безопасность препарата в форме таблеток, покрытых оболочкой, 5 мг для детей до 12 лет не установлены.



Имеются данные ограниченных клинических испытаний эффективности применения дезлоратадина у подростков 12-17 лет.

Пациенты пожилого возраста

Клинические исследования дезлоратадина не включали достаточное количество пациентов в возрасте 65 лет и старше, чтобы определить отличия в их реагировании от молодых пациентов. Опыт клинического применения не выявил различий между пожилыми и молодыми пациентами. В целом подбор дозы для пожилого пациента следует проводить с осторожностью, учитывая большую частоту снижения функций печени, почек или сердца и сопутствующих заболеваний или другой лекарственной терапии.

Нарушения функций почек

Коррекция дозы не требуется.

Рекомендуется соблюдать осторожность, применяя препарат у пациентов с тяжелыми нарушениями функций почек.

Нарушения функций печени

Коррекция дозы не требуется.

Если Вы забыли принять препарат своевременно, примите пропущенную дозу как можно быстрее. Затем продолжайте прием препарата в обычное время. Принимать двойную дозу для компенсации пропущенной дозы не следует.

Побочное действие

Подобно всем лекарственным средствам дезлоратадин может вызывать нежелательные реакции, однако они возникают не у всех.

Во время применения дезлоратадина очень редко наблюдались случаи тяжелых аллергических реакций (затрудненное дыхание, свистящее дыхание, зуд, крапивница и отеки). В случае возникновения указанных побочных реакций следует прекратить принимать лекарственное средство и немедленно обратиться к врачу.

Побочные эффекты, наблюдавшиеся в ходе клинических исследований у взрослых, были приблизительно схожи с нежелательными явлениями при приеме плацебо. Тем не менее, усталость, сухость во рту и головная боль наблюдались чаще, чем при приеме плацебо. Головная боль отмечалась как наиболее частый побочный эффект у подростков.

По результатам клинических исследований дезлоратадина были отмечены следующие побочные эффекты:

Часто (менее чем у 1 человека из 10):

усталость, сухость во рту, головная боль, повышенная утомляемость.

Взрослые

Во время пострегистрационного применения дезлоратадина были отмечены следующие побочные эффекты:

Очень редко (менее чем у 1 человека из 10 000):

тяжелые аллергические реакции, сыпь, усиленное или нерегулярное сердцебиение, учащенное сердцебиение, боль в желудке, тошнота, рвота, расстройство пищеварения, диарея, головокружение, сонливость, нарушения сна, мышечная боль, галлюцинации, судороги, выраженное беспокойство, воспаление печени, аномальные результаты тестов функции печени.

Частота неизвестна (исходя из имеющихся данных, частоту возникновения определить невозможно):

необычная слабость, пожелтение кожи и/или глаз, повышенная чувствительность кожи к солнцу (даже в пасмурную погоду) и к ультрафиолетовому излучению (например, при посещении солярия), изменение частоты сердцебиения, нестандартное поведение, агрессия, повышение массы тела, повышенный аппетит.

Дети

Частота неизвестна (исходя из имеющихся данных, частоту возникновения определить невозможно):

слабое сердцебиение, изменение частоты сердцебиения, нестандартное поведение, агрессия

Сообщение о нежелательных побочных реакциях

Если у Вас возникают какие-либо нежелательные реакции, проконсультируйтесь с врачом. Данная рекомендация распространяется на любые возможные нежелательные реакции, в том

числе на не перечисленные в листке-вкладыше. Вы также можете сообщить о нежелательных реакциях в информационную базу данных по нежелательным реакциям (действиям) на лекарственные препараты, включая сообщения о неэффективности лекарственных препаратов. Сообщая о нежелательных реакциях, Вы помогаете получить больше сведений о безопасности препарата.

Противопоказания

Повышенная индивидуальная чувствительность к дезлоратадину, лоратадину и к какому-либо вспомогательному компоненту препарата.

Непереносимость галактозы, врожденная недостаточность лактазы или синдром мальабсорбции глюкозы и галактозы.

Передозировка

У взрослых и детей профиль нежелательных реакций, связанных с передозировкой, как установлено во время постмаркетингового применения, аналогичен тому, который наблюдался на фоне терапевтических доз, но выраженность эффектов может быть больше.

Лечение. В случае передозировки показаны стандартные мероприятия, направленные на удаление неабсорбированного активного вещества. Рекомендуется симптоматическое и поддерживающее лечение.

Дезлоратадин не выводится путем гемодиализа; возможность его выведения при перитонеальном диализе не установлена.

Симптомы. В клинических исследованиях многократных доз дезлоратадина, где применялись дозы до 45 мг (что в 9 раз превышали рекомендуемые), клинически значимых реакций не наблюдалось.

Детская популяция

Профиль неблагоприятных событий, связанных с передозировкой, как установлено во время постмаркетингового применения, аналогичен профилю побочных эффектов, связанных с применением терапевтических доз, но величина эффекта может быть более выраженной

Меры предосторожности

Перед началом лечения посоветуйтесь с врачом!

При применении препарата нужно придерживаться рекомендованных врачом доз!

В случае тяжелой почечной недостаточности, препарат следует применять с осторожностью.

Дезлоратадин следует применять с осторожностью пациентам с судорогами в анамнезе, включая семейный анамнез, особенно у детей, которые более подвержены развитию новых судорог на фоне лечения дезлоратадином. Медицинские работники могут рассмотреть вопрос о прекращении приема дезлоратадина у пациентов, которые испытывают приступ судорог во время лечения.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Если Вы принимаете какие-либо другие лекарственные средства, обязательно сообщите об этом врачу!

Клинически значимых изменений в плазменной концентрации дезлоратадина при одновременном применении с эритромицином, кетоконазолом, азитромицином, флюоксетином и циметидином выявлено не было. Дезлоратадин не усиливает негативное действие алкоголя на психомоторную функцию.

Тем не менее, были зарегистрированы случаи непереносимости алкоголя и интоксикации во время применения препарата. Поэтому рекомендуется соблюдать осторожность при одновременном приеме алкоголя.

Применение в период беременности или кормления грудью

Безопасность применения препарата беременным не установлена, поэтому не рекомендуется применять дезлоратадин во время беременности.

Дезлоратадин проникает в грудное молоко, поэтому женщинам, кормящим грудью, применять дезлоратадин не рекомендуется.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

На основе клинических испытаний установлено, что дезлоратадин не оказывает никакого влияния или незначительно влияет на способность управлять транспортными средствами и другими механизмами.

Пациенты должны иметь в виду, что большинство людей не испытывают сонливость. Тем не менее, есть индивидуальные различия в ответе на все лекарственные средства, поэтому пациентам рекомендуется не заниматься деятельностью, требующей умственного напряжения, такой как управление транспортными средствами или управление другими механизмами, до тех пор, пока они не установят свой собственный ответ на лекарственное средство.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере из пленки поливинилхлоридной и материала рулонного упаковочного на основе фольги алюминиевой.

По 1 или 3 блистера вместе с листком-вкладышем упаковывают в пачку из картона.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке для защиты от воздействия влаги и света при температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Препарат не должен применяться по истечении срока годности.

Условия отпуска

Без рецепта врача.

Информация о производителе (заявителе)

Произведено и расфасовано (заявитель)

ЧАО «Технолог», Украина,

20300, г. Умань, Черкасская обл., ул. Старая прорезная, 8.

Упаковано

ООО «Белалек», Республика Беларусь

222223, Минская область, Смолевичский район,

Китайско-Белорусский индустриальный парк «Великий камень»;

тел.: +375447777701

e-mail: info@belalek.by