

Состав

действующее вещество: дезлоратадин;

1 таблетка содержит дезлоратадина 5 мг;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, кальция гидрофосфат дигидрат, крахмал кукурузный, гипромелоза, тальк, натрия стеарилфумарат, кремния диоксид коллоидный безводный;

пленочное покрытие: Опадрай II 33G 205005 синий (гипромелоза, лактозы моногидрат, титана диоксид (Е 171), макрогол 3350, триацетин, индигокармин алюминиевый лак (Е 132), хинолиновый желтый алюминиевый лак (Е 104)).

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства: светло-синего цвета, круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, диаметром 6 мм ± 0,2 мм.

Фармакотерапевтическая группа

Другие антигистаминные средства для системного применения.

Код АТХ R06A X27.

Фармакодинамика

Дезлоратадин – это неседативный антигистаминный препарат длительного действия, имеет селективное антагонистическое действие на периферические H₁-рецепторы. После перорального применения дезлоратадин селективно блокирует периферические гистаминовые H₁-рецепторы.

В исследованиях *in vitro* дезлоратадин продемонстрировал на клетках эндотелия свои антиаллергические и противовоспалительные свойства. Это проявлялось угнетением выделения провоспалительных цитокинов, таких как IL-4, IL-6, IL-8 и IL-13 с мастоцитов/ базофилов человека, а также угнетением экспрессии молекул клеточной адгезии Р-селектина на эндотелиальных клетках.

Клиническая значимость этих наблюдений еще нуждается в подтверждении.

В клинических исследованиях высоких доз, в которых дезлоратадин ежедневно применяли в дозе до 20 мг в течение 14 дней, никаких статистически или клинически значимых изменений со стороны сердечно-сосудистой системы не наблюдалось. В клинико-фармакологическом исследовании, в котором применялся дезлоратадин в дозе 45 мг в сутки (в 9 раз больше клинической дозы) в течение 10 дней, удлинение интервала QT не наблюдалось.

Дезлоратадин почти не проникает в центральную нервную систему. В контролируемых клинических исследованиях, при приеме в рекомендуемой дозе по 5 мг в сутки, чрезмерной частоты возникновения сонливости по сравнению с плацебо не наблюдалось. В клинических исследованиях при однократном приеме дезлоратадин в суточной дозе 7,5 мг не оказывал влияния на психомоторную активность.

В клинико-фармакологических исследованиях при одновременном применении с алкоголем нарушения, связанные с алкоголем, такие как ухудшение производительности или повышение сонливости, не прогрессировали. Не было выявлено существенных различий в результатах психомоторного тестирования между группами с дезлоратадином и плацебо, как при самостоятельном применении, так и при одновременном применении с алкоголем.

У пациентов с аллергическим ринитом дезлоратадин эффективно устранял такие симптомы как чихание, выделения из носа и зуд, а также раздражение глаз, слезотечение и покраснение, зуд неба. Дезлоратадин эффективно контролировал симптомы в течение 24 часов.

Дезлоратадин эффективно облегчает тяжесть течения сезонного аллергического ринита, как видно из суммарного показателя опросника по оценке качества жизни при риноконъюнктивите. Максимальное улучшение отмечалось в пунктах, связанных с практическими проблемами и ежедневной деятельностью, которые ограничивали симптомы.

Хроническую идиопатическую крапивницу изучали в клинической модели с условиями крапивницы. Поскольку выброс гистамина является причинным фактором при всех формах крапивницы, ожидается, что дезлоратадин, кроме хронической идиопатической крапивницы, будет эффективно облегчать симптомы при других формах крапивницы, как рекомендовано в клинических руководствах.

В двух плацебо-контролируемых 6-недельных исследованиях с участием пациентов с хронической идиопатической крапивницей дезлоратадин эффективно облегчал зуд и уменьшал количество и размер высыпаний до конца первого интервала дозирования. В каждом исследовании эффект длился в

течение 24-часового интервала дозирования. Облегчение зуда на более чем 50 % отмечалось в 55 % пациентов, принимавших дезлоратадин, по сравнению с 19 % пациентов, принимавших плацебо. Прием препарата не оказывает существенного влияния на сон и дневную активность.

Фармакокинетика

Всасывание. Концентрации дезлоратадина в плазме крови можно определить через 30 минут после приема препарата. Дезлоратадин хорошо абсорбируется, максимальная концентрация достигается приблизительно через 3 часа; период полувыведения составляет около 27 часов. Степень кумуляции дезлоратадина отвечал его периоду полувыведения (примерно 27 часов) и частоте приема 1 раз в сутки. Биодоступность дезлоратадина была пропорциональна дозе в диапазоне от 5 до 20 мг.

В фармакокинетическом исследовании, в котором демографические данные пациентов были сравнимы с общей популяцией с сезонным аллергическим ринитом, 4 % участников достигали высокой концентрации дезлоратадина. Этот процент может варьироваться в зависимости от этнической принадлежности. Максимальная концентрация дезлоратадина была примерно в 3 раза выше спустя примерно 7 часов, с терминальным периодом полувыведения около 89 часов. Профиль безопасности этих пациентов не отличался от профиля в общей популяции.

Распределение. Дезлоратадин умеренно связывается с белками плазмы крови (83-87 %). При применении дозы дезлоратадина (от 5 до 20 мг) 1 раз в сутки в течение 14 дней признаков клинически значимой кумуляции активного вещества не обнаружено.

Метаболизм. Фермент, отвечающий за метаболизм дезлоратадина, пока еще не обнаружен, поэтому невозможно полностью исключить некоторые взаимодействия с другими лекарственными средствами. Дезлоратадин не угнетает CYP3A4 *in vivo*, исследования *in vitro* продемонстрировали, что лекарственное средство не подавляет CYP2D6 и не является ни субстратом, ни ингибитором Р-гликопротеина.

Выведение. В исследовании однократного приема дезлоратадина в дозе 7,5 мг прием пищи (жирный высококалорийный завтрак) не влияет на фармакокинетику дезлоратадина. Также установлено, что грейпфрутовый сок также не влияет на фармакокинетику дезлоратадина.

Показания

Дезлоратадин назначается взрослым и детям старше 12 лет для облегчения симптомов, связанных с:

- аллергическим ринитом (см. раздел «Фармакологические свойства»);
- крапивницей (см. раздел «Фармакологические свойства»).

Противопоказания

Повышенная чувствительность к активному веществу или к любому из вспомогательных веществ препарата или к лоратадину.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

В клинических исследованиях таблеток дезлоратадина при одновременном применении эритромицина или кетоконазола никаких клинически значимых взаимодействий не наблюдалось.

Из данных клинико-фармакологических исследований, при одновременном применении препарата с алкоголем не отмечалось усиления негативного влияния этанола на психомоторную функцию. Однако в пострегистрационном периоде наблюдались случаи непереносимости алкоголя и алкогольная интоксикация при применении препарата. Поэтому необходимо быть осторожным при одновременном применении алкоголя в период лечения дезлоратадином.

Особенности применения

У больных с почечной недостаточностью высокой степени прием дезлоратадина следует осуществлять под контролем врача.

Дезлоратадин следует применять с осторожностью пациентам с приступами судорог в медицинском или семейном анамнезе, главным образом маленьким детям, которые более склонны к развитию новых судорог при лечении дезлоратадином. Доктор может рассмотреть вопрос о прекращении применения дезлоратадина у пациентов, у которых наблюдаются приступы судорог во время лечения.

Дезлоратадин содержит лактозу. Пациенты с редкими наследственными проявлениями непереносимости галактозы, дефицита лактозы Лаппа или глюкозо-галактозной мальабсорбции не должны принимать это лекарственное средство.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

В клинических исследованиях, во время которых оценивали способность управлять автотранспортом, никаких ухудшений у пациентов, принимавших дезлоратадин, не обнаружено. Однако пациентов следует проинформировать, что очень редко некоторые люди испытывают сонливость, что может повлиять на их способность управлять автомобилем и сложной техникой.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность. Дезлоратадин не продемонстрировал тератогенность в исследованиях на животных. Безопасность применения препарата в период беременности не установлена, поэтому применение дезлоратадина в этот период не рекомендуется.

Кормление грудью. Дезлоратадин проникает в грудное молоко, поэтому его применение женщинам, которые кормят грудью, не рекомендуется.

Способ применения и дозы

Применять перорально, независимо от приема пищи.

Взрослым и детям старше 12 лет: рекомендуется по 1 таблетке 1 раз в сутки, независимо от приема пищи, для устранения симптомов, ассоциированных с аллергическим ринитом (включая интермиттирующий и персистирующий аллергический ринит) и крапивницей.

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 восстановить после повторного их появления.

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

Дети

Существуют ограниченные данные клинических исследований эффективности применения дезлоратадина у подростков от 12 до 17 лет (см. раздел «Побочные реакции»).

Нет установленных данных по эффективности и безопасности применения дезлоратадина у детей до 12 лет.

Передозировка

При передозировке побочные реакции аналогичны тем, которые наблюдались в терапевтических дозах, но проявления могут быть сильнее.

Симптомы. В клинических исследованиях, в которых дезлоратадин вводили в дозах до 45 мг (что в 9 раз превышали рекомендуемые), клинически значимые нежелательные реакции не наблюдались.

Лечение. В случае передозировки следует применять стандартные меры для удаления неадсорбированного активного вещества. Рекомендуется симптоматическое и поддерживающее лечение. Дезлоратадин не удаляется путем гемодиализа; возможность его удаления при перитонеальном диализе не установлена.

Побочные реакции

В клинических исследованиях относительно показаний, включая аллергический ринит и хроническую идиопатическую крапивницу, о нежелательных эффектах на дезлоратадин у пациентов, получавших рекомендованную дозу 5 мг в сутки, сообщалось на 3 % чаще, чем у пациентов, получавших плацебо.

Чаще всего, по сравнению с плацебо, сообщалось о таких побочных реакциях как повышенная утомляемость (1,2 %), сухость во рту (0,8 %) и головная боль (0,6 %).

Дети. В клинических исследованиях с участием 578 подростков в возрасте от 12 до 17 лет наиболее распространенным побочным эффектом была головная боль, она наблюдалась в 5,9 % пациентов, принимавших дезлоратадин, и в 6,9 % пациентов, получавших плацебо.

Другие побочные реакции, которые наблюдались в пострегистрационный период с неизвестной частотой: удлинение интервала QT, аритмии и брадикардии.

Суммарная таблица частоты побочных реакций.

Частота определяется как очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$) и частота неизвестна (не может быть оценена исходя из существующих данных).

Классы/системы органов	Частота возникновения	Побочные реакции
<i>Психические расстройства</i>	<i>очень редко</i>	галлюцинации
	<i>частота неизвестна</i>	аномальное поведение, агрессия
<i>Со стороны нервной системы</i>	<i>часто</i>	головная боль
	<i>очень редко</i>	головокружение, сонливость, бессонница, психомоторная гиперактивность, судороги ми
<i>Со стороны сердца</i>	<i>очень редко</i>	тахикардия, учащенное сердцебиение
	<i>частота неизвестна</i>	удлинение интервала QT
<i>Со стороны желудочно-кишечного тракта</i>	<i>часто</i>	сухость во рту
	<i>очень редко</i>	боль в животе, тошнота, рвота, диспепсия, диарея
<i>Со стороны гепатобилиарной системы</i>	<i>очень редко</i>	повышение уровня ферментов печени, повышение билирубина, гепатит
	<i>частота неизвестна</i>	желтуха
<i>Со стороны кожи и подкожных тканей</i>	<i>частота неизвестна</i>	фоточувствительность
<i>Со стороны костно-мышечной системы и соединительной ткани</i>	<i>очень редко</i>	миалгия
<i>Общие нарушения</i>	<i>часто</i>	повышенная утомляемость
	<i>очень редко</i>	реакции повышенной чувствительности (анафилаксия, ангионевротический отек, одышка, зуд, сыпь и крапивница)

<i>частота неизвестна</i>	астения	
<i>Расстройства метаболизма и питания</i>	<i>частота неизвестна</i>	повышение аппетита
<i>Исследования</i>	<i>частота неизвестна</i>	увеличение веса

Срок годности

2 года.

Условия хранения

Хранить в недоступном для детей месте.

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере. По 1 или 3 блистера в картонной пачке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

АО «Софарма».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

ул. Илиенское шоссе, 16, София, 1220, Болгария.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).