

Состав

действующее вещество: дезлоратадин;

1 мл раствора орального содержит дезлоратадина 0,5 мг;

вспомогательные вещества: пропиленгликоль; натрия цитрат; кислота лимонная, моногидрат; динатрия эдетат; сорбита раствор не кристаллизирующийся (Е 420); сахаралоза; гипромелоза; ароматизатор вишневый; вода очищенная.

Лекарственная форма

Раствор оральный.

Основные физико-химические свойства: прозрачная, бесцветная сиропообразная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа

Другие антигистаминные средства для системного применения. Код АТХ R06A X27.

Фармакодинамика

Дезлоратадин является мощным селективным блокатором периферических гистаминовых H_1 -рецепторов, который не проявляет седативного эффекта. Дезлоратадин – первичный активный метаболит лоратадина.

После перорального приема дезлоратадин селективно блокирует периферические гистаминовые H_1 -рецепторы, поскольку он почти не проникает через гематоэнцефалический барьер.

В исследованиях *in vitro* дезлоратадин продемонстрировал свои антиаллергические и противовоспалительные свойства. Они включают подавление высвобождения противовоспалительных цитокинов, таких как IL-4, IL-6, IL-8 и IL-13, из тучных клеток/ базофилов человека, а также подавление экспрессии молекул адгезии Р-селектина на эндотелиальных клетках. Клиническая значимость этих наблюдений еще не до конца установлена.

Эффективность раствора орального, содержащего дезлоратадин, не изучалась в специальных исследованиях у детей. Однако безопасность сиропа, содержащего дезлоратадин в той же концентрации, показана в трех испытаниях у детей. Дети от 1 года до 11 лет с показаниями к антигистаминной терапии получали суточную дозу дезлоратадина 1,25 мг (дети от 1 года до 5 лет) или 2,5 мг (дети от 6 до 11 лет). Лечение хорошо переносилось, что задокументировано посредством клинических лабораторных исследований жизненных показателей и ЭКГ (включая длительность интервала QT).

При применении в рекомендуемой дозе плазменные концентрации дезлоратадина были сравнимы у детей и взрослых. Поскольку течение аллергического ринита и хронической идиопатической уртикарии, как и профиль дезлоратадина, схожи у детей и взрослых, данные об эффективности дезлоратадина у взрослых могут быть экстраполированы и на детей.

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 через гематоэнцефалический барьер. При применении рекомендованной дозы 5 мг частота возникновения сонливости не превышала таковую в группе плацебо. В клинических исследованиях при однократном приеме дезлоратадин в дозе 7,5 мг не оказывал влияния на психомоторную активность.

При исследовании однократной суточной дозы дезлоратадина 5 мг в сутки у взрослых не установлены изменения стандартных тестов во время полета, в том числе и усиление субъективного ощущения сонливости или других, связанных с полетом, показателей. При клинических фармакологических испытаниях совместного приема с алкоголем не установлено повышения связанного с алкоголем изменения поведения или усиления сонливости. Не установлены значимые различия в результатах психомоторных тестов у групп, принимающих дезлоратадин, и таковых, принимающих плацебо (независимо от употребления алкоголя).

Во время клинических испытаний с многократным дозированием совместного применения дезлоратадина с кетоконазолом и эритромицином не установлены клинически значимые изменения в плазменной концентрации дезлоратадина.

У взрослых и подростков с аллергическим ринитом дезлоратадин, таблетки, эффективен в отношении облегчения таких симптомов, как чихание, зуд и выделения из носа, зуд и покраснение глаз, слезотечение, зуд нёба. Дезлоратадин эффективно контролирует симптомы на протяжении 24 часов. Эффективность дезлоратадина, таблетки, не показана категорически в клинических испытаниях при участии пациентов от 12 до 17 лет.

Помимо утвержденной классификации аллергического ринита, разделяющего его на сезонный и круглогодичный, в зависимости от длительности проявления симптомов его можно классифицировать как интермиттирующий аллергический ринит и как персистирующий аллергический ринит. Интермиттирующий аллергический ринит определяется как наличие симптомов на протяжении менее 4 дней в неделю или на протяжении менее 4 недель. Персистирующий аллергический ринит определяется как наличие симптомов на протяжении 4 или более дней в неделю и на протяжении более 4 недель.

Дезлоратадин, таблетки, эффективно облегчает симптомы сезонного аллергического ринита, как это видно из общего сбора в опроснике о качестве жизни при риноконъюнктивите. Самое значительное улучшение наблюдается в разделах с практическими проблемами и повседневной деятельностью, ограниченной симптомами.

Хроническая идиопатическая уртикария была исследована как клиническая модель уртикарных состояний, так как независимо от этиологии патофизиологические механизмы являются схожими и включение хронически больных пациентов в проспективные исследования проще. Так как причинным фактором для всех уртикарных заболеваний является высвобождение гистамина, ожидается, что дезлоратадин будет эффективным в отношении облегчения симптомов и других связанных с уртикарией состояний, кроме хронической идиопатической уртикарии, как рекомендуется в клинических руководствах.

В двух плацебо контролируемых 6-недельных испытаниях у пациентов с хронической идиопатической уртикарией дезлоратадин был эффективен при облегчении зуда и уменьшении размера и количества волдырей еще в конце первого дозового интервала. В любом из испытаний эффект поддерживался на протяжении всего 24-часового дозового интервала. Как и при других испытаниях антигистаминных препаратов, при хронической идиопатической уртикарии меньшее количество пациентов, идентифицированных как не отвечающие на лечение антигистаминными препаратами, было исключено. Облегчение зуда на более чем 50 % наблюдалось у 55 % пациентов, леченных дезлоратадином, в сравнении с 19 % пациентов, получавших плацебо. Лечение дезлоратадином значительно снизило нарушение ритма сна и бодрствования, измеренное по четырехбалльной шкале, использованной для оценки этих переменных.

Фармакокинетика

Всасывание. Концентрацию дезлоратадина в плазме крови можно определить через 30 минут после приема препарата. Дезлоратадин хорошо абсорбируется, максимальная концентрация в плазме крови достигается приблизительно через 3 часа; период полувыведения ($T_{1/2}$) составляет около 27 часов. Степень кумуляции дезлоратадина отвечал его $T_{1/2}$ (примерно 27 часов) и частоте приема 1 раз в сутки. Биодоступность дезлоратадина была пропорциональна дозе в диапазоне от 5 до 20 мг.

В фармакокинетических и клинических испытаниях у 6 % пациентов достигнута более высокая концентрация дезлоратадина в плазме. Процент пациентов с фенотипом медленных метаболизаторов был сравним у взрослых (6 %) и у детей от 2 до 11 лет (6 %), причем у лиц негроидной расы был установлен более высокий процент (18 % у взрослых и 16 % у детей), чем у лиц европейской расы

(2 % у взрослых и 3 % у детей).

При фармакокинетическом испытании с многократными дозами дезлоратадина в форме таблеток у здоровых взрослых добровольцев четыре участника были медленными метаболиторами дезлоратадина. У них установлена в 3 раза более высокая максимальная плазменная концентрация (C_{max}) на 7-м часе с $T_{1/2}$ терминальной фазы приблизительно 89 часов.

Подобные фармакокинетические параметры наблюдались при фармакокинетическом испытании с многократными дозами, проведенном с сиропом, у детей медленных метаболиторов от 2 до 11 лет с аллергическим ринитом. Площадь под фармакокинетической кривой концентрация-время (AUC) дезлоратадина была приблизительно в 6 раз выше, а C_{max} – в 3-4 раза выше на 3-6 часов при $T_{1/2}$ приблизительно 120 часов. AUC была одинаковой у взрослых и детей медленных метаболиторов при приеме соответствующей возрасту дозы. Целостный профиль безопасности у этих лиц не отличался от такового у общей популяции. Эффекты дезлоратадина у медленных метаболиторов до 2 лет не исследованы.

В отдельных испытаниях однократных доз дезлоратадина в рекомендуемой дозе у детей установлены AUC и C_{max} , сравнимые с таковыми у взрослых, принимавших дозу 5 мг дезлоратадина (сироп).

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

Для устранения симптомов, связанных с:

- аллергическим ринитом (чихание, выделения из носа, зуд, отек и заложенность носа, зуд и покраснение глаз, слезотечение, зуд неба и кашель);
- крапивницей (зуд, сыпь).

Противопоказания

Повышенная чувствительность к активному веществу или к любому вспомогательному веществу препарата или к лоратадину.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Клинически значимых изменений концентраций дезлоратадина в плазме крови при неоднократном одновременном применении с кетоконазолом, эритромицином, азитромицином, флюоксетином, циметидином установлено не было. В связи с тем, что фермент, отвечающий за метаболизм дезлоратадина, не установлен, взаимодействие с другими лекарственными средствами полностью исключить невозможно.

Еда (жирный высококалорийный завтрак) или грейпфрутовый сок не влияют на распределение дезлоратадина.

Влияние на результаты лабораторных исследований

Применение препарата следует прекратить приблизительно за 48 часов до проведения кожных проб, поскольку антигистаминные препараты могут предупреждать появление или уменьшать проявления положительных дерматологических реакций на раздражители.

Особенности применения

При тяжелой почечной недостаточности дезлоратадин следует применять с особой осторожностью под контролем доктора.

Если у Вас установлена непереносимость некоторых сахаров, проконсультируйтесь с врачом перед тем, как принимать это лекарственное средство.

Дезлоратадин следует с осторожностью назначать пациентам, имеющим судороги в анамнезе. Дети могут быть более чувствительными к развитию нового приступа судорог во время лечения дезлоратадином. Врач должен принять решение о прекращении лечения дезлоратадином больных, у которых во время применения препарата наблюдался приступ судорог.

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

Согласно клиническим испытаниям, дезлоратадин не влияет или влияет очень мало на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами. Пациентов следует проинформировать, что в очень редких случаях возможно возникновение сонливости. Из-за индивидуальной реакции организма ко всем лекарственным средствам, рекомендуется посоветовать пациентам не выполнять действий, требующих умственной концентрации, таких как управление транспортными средствами или работа с механизмами до тех пор, пока они не установят свою собственную реакцию к лекарственному препарату.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность. Большой объем данных о применении дезлоратадина у беременных женщин (более 1000 случаев завершенной беременности) не показывает мальформативную или фетальную/неонатальную токсичность дезлоратадина. Исследования у животных не выявили прямого или косвенного неблагоприятного действия, связанного с репродуктивной токсичностью. В качестве меры предосторожности не следует применять дезлоратадин во время беременности.

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

Фертильность. Нет данных о влиянии препарата на фертильность мужчин и женщин.

Способ применения и дозы

Применять перорально, независимо от приема пищи.

Взрослым и детям старше 12 лет: по 10 мл раствора (5 мг дезлоратадина) 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 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

Большинство случаев ринита у детей до 2-летнего возраста являются инфекционными и нет данных, подкрепляющих лечение инфекционных ринитов дезлоратадином.

Эффективность и безопасность применения сиропа детям в возрасте до 1 года не установлены.

Для лечения применяется следующий режим дозирования:

- дети в возрасте от 6 до 11 лет: 5 мл раствора (2,5 мг дезлоратадина) 1 раз в сутки.
- дети в возрасте от 1 года до 5 лет: 2,5 мл раствора (1,25 мг дезлоратадина) 1 раз в сутки.

Передозировка

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

В случае передозировки применяют стандартные меры для удаления неадсорбированного активного вещества, применяют симптоматическое лечение.

При применении дезлоратадина в дозах до 45 мг (что в 9 раз превышали рекомендуемые) в ходе клинических исследований у взрослых и подростков клинически значимых эффектов не наблюдалось.

Дезлоратадин не удаляется путем гемодиализа; возможность его удаления при перитонеальном диализе не установлена.

Побочные реакции

В клинических исследованиях по показаниям, 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, сообщали о таких побочных реакциях: повышенная утомляемость (1,2 %), сухость во рту (0,8 %) и головная боль (0,6 %).

Педиатрическая популяция

При клинических испытаниях у педиатрической популяции дезлоратадин в форме сиропа давали 246 детям от 6 месяцев до 11 лет. Общая частота нежелательных явлений у детей от 2 до 11 лет была схожей у группы, принимавшей дезлоратадин, и группой, принимавшей плацебо. У грудных детей и детей младшего возраста (от 6 до 23 месяцев), самыми частыми побочными реакциями, о которых сообщается с более высокой частотой в сравнении с плацебо, являются: диарея (3,7 %), повышение температуры тела (2,3 %) и

бессоница (2,3 %). При другом испытании после приема однократной дозы дезлоратадина 2,5 мг в форме раствора перорального у детей от 6 до 11 лет побочные действия не наблюдались.

При клиническом испытании с 578 пациентами в подростковом возрасте, от 12 до 17 лет, самой частой побочной реакцией является головная боль. Она наблюдалась у 5,9 % пациентов, принимавших дезлоратадин, и у 6,9 % пациентов, получавших плацебо.

Существует риск психомоторной гиперактивности (аномального поведения), связанной с применением дезлоратадина (что может проявляться в виде злости и агрессии, а также возбуждение).

Дезлоратадин почти не проникает в центральную нервную систему. При применении в рекомендуемой дозе для взрослых, составляет 5 мг, не отмечалось повышение показателя частоты сонливости по сравнению с группой плацебо.

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 (на основании существующих данных нельзя определить).

Классы/системы органов	Частота возникновения	Побочные реакции
Психические расстройства	<i>очень редко</i>	галлюцинации
	<i>частота неизвестна</i>	аномальное поведение, агрессия

<i>Со стороны нервной системы</i>	<i>часто</i>	головная боль
	<i>часто (дети до 2 лет)</i>	бессонница
	<i>очень редко</i>	головокружение, сонливость, бессонница, психомоторная гиперактивность, судороги
<i>Со стороны сердца</i>	<i>очень редко</i>	тахикардия, учащенное сердцебиение
	<i>частота неизвестна</i>	удлинение интервала QT, аритмия, брадикардия, суправентрикулярная тахиаритмия
<i>Со стороны желудочно-кишечного тракта</i>	<i>часто</i>	сухость во рту
	<i>часто (дети до 2 лет)</i>	диарея
	<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 уровня билирубина, гепатит
	<i>частота неизвестна</i>	желтуха
<i>Со стороны кожи и подкожных тканей</i>	<i>частота неизвестна</i>	фоточувствительность

Со стороны костно-мышечной системы и соединительной ткани	очень редко	миалгия
Общие нарушения	часто	повышенная утомляемость
	часто (дети до 2 лет)	лихорадка
	очень редко	реакции гиперчувствительности (анафилаксия, ангионевротический отек, одышка, зуд, сыпь, крапивница)
	частота неизвестна	астения

Срок годности

2 года.

Срок годности после вскрытия бутылки – 3 месяца.

Условия хранения

Хранить в недоступном для детей месте.

Хранить в оригинальной упаковке для защиты от света.

Это лекарственное средство не требует специальных температурных условий хранения.

Упаковка

По 120 мл раствора в стеклянной или ПЭТ бутылке.

По 1 бутылке с мерным стаканчиком и дозирующим шприцом 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](#).