

Состав

действующее вещество: desloratadine;

1 мл раствора содержит 0,5 мг дезлоратадина;

вспомогательные вещества: натрия эдетат; натрия; кислота лимонная моногидрат, сорбит (Е 420) сахаралоза; пропиленгликоль; гипромеллоза; ароматизатор «Слива»; вода очищенная.

Лекарственная форма

Раствор оральный.

Основные физико-химические свойства: прозрачная, бесцветная жидкость с характерным запахом.

Фармакотерапевтическая группа

Антигистаминные средства для системного применения. Код АТХ R06A X27.

Фармакодинамика

Дезлоратадин – это неседативный антигистаминный препарат длительного действия, который 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 противовоспалительных цитокинов, таких как IL-4, IL-6, IL-8, та IL-13, с мастоцитов/ базофилов человека, а также угнетения экспрессии молекул адгезии, таких как Р-селектин. Клиническая значимость этих наблюдений еще требует подтверждения.

В клинических исследованиях высоких доз, у которых дезлоратадин вводили ежедневно в дозе до 20 мг в течение 14 дней, статистически значимые изменения со стороны сердечно-сосудистой системы не наблюдались. В клиническо-фармакологическом исследовании при применении 45 мг в сутки (в 10 раз больше максимальной суточной клинической дозы) в течение 10 дней, удлинение интервала QT не наблюдалось.

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

Дезлоратадин почти не проникает в центральную нервную систему (ЦНС). В контролируемых клинических исследованиях при приеме в рекомендуемой дозе 5 мг в сутки частота возникновения сонливости не отличалась от группы плацебо. В клинических исследованиях одноразовый прием препарата дезлоратадин в суточной дозе 7,5 мг не оказывал влияния на психомоторную активность.

Дезлоратадин эффективно облегчает тяжесть течения сезонного аллергического ринита с учетом суммарного показателя опросника об оценке качества жизни при риноконъюнктивите. Максимальное улучшение отмечалось в пунктах опросника, связанных с практическими проблемами и ежедневной деятельностью, которую 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 будет эффективно облегчать симптомы при других формах крапивницы, кроме хронической идиопатической крапивницы.

В двух плацебо контролируемых 6-недельных исследованиях с участием пациентов с хронической идиопатической крапивницей дезлоратадин эффективно облегчал зуд и уменьшал количество и размер уртикарии до конца первого интервала дозирования. В каждом исследовании эффект длился в течение 24-часового интервала дозирования. Облегчение зуда на более чем 50 % отмечалось у 55 % пациентов, принимающих дезлоратадин, в сравнении с 19 % пациентов, принимающих плацебо.

Прием препарата не проявляет 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 приблизительно 27 часов. Степень кумуляции дезлоратадина отвечал

его периоду полувыведения (приблизительно 27 часов) и частоте приема 1 раз в сутки. Биодоступность дезлоратадина была пропорциональна к дозе в диапазоне от 5 до 20 мг.

В фармакокинетическом исследовании, в котором демографические данные пациентов можно было сравнить с общей популяцией с сезонным аллергическим ринитом, у 4% участников наблюдалась более высокая концентрация дезлоратадина. Это количество может варьировать в зависимости от этнической принадлежности. Максимальная концентрация дезлоратадина была приблизительно в 3 раза выше приблизительно через 7 часов, терминальный период полувыведения составлял приблизительно 89 часов. Профиль безопасности этих пациентов не отличался от профиля в общей популяции.

Распределение.

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

Биотрансформация

Фермент, отвечающий за метаболизм дезлоратадина, пока еще не обнаружен, поэтому невозможно полностью исключить некоторые взаимодействия с другими лекарственными препаратами. Дезлоратадин не угнетает CYP3A4 *in vivo*, исследования *in vitro* продемонстрировали, что лекарственный препарат не угнетает CYP2D6, субстрат или ингибитор Р-гликопротеина.

Выведение

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

Грейпфрутовый сок также не влияет на фармакокинетику дезлоратадина.

Пациенты с нарушением функции почек.

Фармакокинетика дезлоратадина сравнивалась у пациентов с хронической почечной недостаточностью (ХПН) и у здоровых добровольцев в одном исследовании с приемом однократной дозы и одном исследовании с приемом многократных доз. В исследовании однократной дозы содержание в плазме крови дезлоратадина был примерно в 2 раза больше у пациентов с легким и в 2,5 раза больше у пациентов с умеренным и выраженным ХПН по сравнению со

здоровыми добровольцами. В исследовании многократных доз равновесная концентрация была достигнута после 11-го дня, и по сравнению со здоровыми субъектами, содержание в плазме крови дезлоратадина у пациентов с легкой и умеренной ХПН был в ~ 1,5 раза больше, а у пациентов с тяжелой ХПН в ~ 2,5 раза больше. В обоих исследованиях изменение содержания в плазме крови (AUC и C_{max}) дезлоратадина и 3-гидроксидезлоратадину не были клинически значимыми.

Показания

Устранение симптомов, связанных с:

- аллергическим ринитом (чихание, выделения из носа, зуд, отек и заложенность носа, зуд и покраснение глаз, слезотечение, зуд в области 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

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

В данных клинико-фармакологических исследованиях при применении препарата вместе с алкоголем не отмечалось усиление негативного влияния этанола на психомоторную функцию. Однако в пострегистрационном периоде наблюдались случаи непереносимости алкоголя и алкогольная интоксикация во время применения дезлоратадина.

Влияние на результаты лабораторных исследований

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

Особенности применения

У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью прием препарата Элизиум следует осуществлять под контролем врача.

Дезлоратадин следует с осторожностью назначать больным, имели приступы судорог в анамнезе. Дети могут быть более склонными к развитию нового приступа судорог при лечении дезлоратадина. Врач должен принять решение об отмене дезлоратадина для пациентов, у которых при применении препарата возник приступ судорог.

Элизиум содержит сорбитол, поэтому если у пациента установлена непереносимость некоторых сахаров, следует проконсультироваться с врачом, прежде чем принимать этот препарат.

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

Согласно клиническим исследованиям, 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. Через индивидуальную реакцию организма ко всем лекарственным средств рекомендуется посоветовать пациентам не выполнять действий, требующих умственной концентрации, таких как управление транспортными средствами или работа с механизмами, до тех пор, пока не установлена своя собственная реакция к лекарственному средству.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность. Большой объем данных по применению препарата беременным женщинам (более 1000 случаев завершённой беременности) не показывают мальформативную или фетальную / неонатальную токсичность дезлоратадина. Исследования у животных не выявили прямого или косвенного действия, связанного с репродуктивной токсичностью. В качестве меры пресечения не следует применять дезлоратадин в период 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

Для устранения симптомов, связанных с аллергическим ринитом (в том числе интермиттирующей и персистирующим) и крапивницей, Элизиум применять перорально, независимо от приема пищи в следующих дозах:

Взрослые и дети старше 12 лет: 10 мл (5 мг дезлоратадина) 1 раз в сутки.

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

Дети в возрасте от 1 до 5 лет: 2,5 мл (1,25 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 возникновения. При персистирующем аллергическом рините (наличие симптомов более 4 дней в неделю или более 4 недель) необходимо продолжать лечение в течение всего период контакта с аллергеном.

Дети

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

Эффективность и безопасность применения лекарственного средства Элизиум, раствор оральный, для детей до 1 года не установлены.

Передозировка

В случае передозировки использовать стандартные меры, направленные на удаление неабсорбированного активного вещества, применять симптоматическое лечение.

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

Дезлоратадин не удаляется путем гемодиализа; возможность его удаления путем перитонеального диализа не установлена.

Побочные реакции

В клинических исследованиях по показаниям, включая аллергический ринит и хроническую идиопатическую крапивницу, о нежелательных эффектах у

пациентов, получавших дозу 5 мг в сутки, сообщалось на 3% чаще, чем у пациентов, получавших плацебо.

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

Дети. В клинических исследованиях с участием 578 подростков с 12 до 17 лет наиболее распространенным побочным эффектом была головная боль; он наблюдался в 5,9% пациентов, принимающих дезлоратадин, и у 6,9% пациентов, получающих плацебо.

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

В пострегистрационном периоде наблюдались (частота неизвестна): удлинение интервала QT, аритмии и брадикардии.

Суммарная таблица частоты побочных реакций.

Частота появления побочных реакций классифицируется следующим образом: 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.

<i>Классы/системы органов</i>	<i>Частота возникновения</i>	<i>Побочные реакции</i>
Нарушения психики	очень редко	галлюцинации
Со стороны нервной системы	часто	головная боль
	очень редко	головокружение, сонливость, бессонница, психомоторная гиперактивность, судороги
Со стороны сердца	очень редко	тахикардия, ускоренное сердцебиение
	частота неизвестна	удлинения интервала QT, суправентрикулярная тахиаритмия
Со стороны желудочно-кишечного тракта	часто	сухость во рту
	очень редко	боль в животе, тошнота, рвота, диспепсия, диарея

Со стороны печени и желчевыводящих путей	очень редко	увеличение уровня ферментов печени, повышенный билирубин, гепатит
	частота неизвестна	желтуха
Со стороны скелетно-мышечной системы и соединительной ткани	очень редко	миалгия
Со стороны кожи и подкожных тканей	частота неизвестна	фоточувствительность
Общие нарушения	часто	повышенная утомляемость
	очень редко	реакции гиперчувствительность (такие как анафилаксия, отек Квинке, отдышка, зуд, сыпь и крапивница)
	частота неизвестна	астения
Расстройства метаболизма и питания	частота неизвестна	повышение аппетита
Исследования	частота неизвестна	увеличение массы тела

Срок годности

2 года.

После вскрытия контейнера использовать в течение 6 месяцев.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 ° С. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 120 мл в контейнере из стекла, закрытом крышкой с контролем первого вскрытия с дозирующей ложкой и дозирующим шприцем в пачке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

Совместное украинско-испанское предприятие «Сперко Украина».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

21027, Украина, г. Винница, ул. 600-летия, 25.

Источник инструкции

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