

Состав

действующее вещество: рупатадину фумарат;

1 мл содержит рупатадину фумарата 1,28 мг в пересчете на рупатадин 1 мг;

вспомогательные вещества: натрия фосфат безводный, кислота лимонная, метилпарагидроксибензоат (Е 218), пропиленгликоль, сахароза, сахарин натрия, ароматизатор банановый, вода очищенная.

Лекарственная форма

Раствор оральный.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная или желтоватая жидкость с запахом банана.

Фармакотерапевтическая группа

Другие антигистаминные препараты для системного применения. Код АТХ R06A X28.

Фармакодинамика

Рупатадин принадлежит ко второму поколению антигистаминных препаратов и является антагонистом гистамина длительного действия с избирательной периферической антагонистической активностью к H₁-рецепторам. Некоторые из его метаболитов (дезлоратадин и его гидроксилированных метаболитов) сохраняют антигистаминное действие и могут частично вносить свой вклад в общую эффективность препарата.

Исследование рупатадину *in vitro* в высокой концентрации показали торможения дегрануляции тучных клеток, вызванное иммунологическими и неиммунологической раздражителями, а также выход цитокинов, в частности TNF, с тучных клеток и моноцитов человека. Клиническое значение наблюдаемых экспериментальных данных еще только предстоит подтвердить.

Фармакодинамическая эффект (уменьшение площади с волдырями, антигистаминный эффект) наблюдался и через 4 недели после лечения.

Поскольку рупатадин обладает способностью блокировать высвобождение гистамина и других медиаторов воспаления, ожидается, что он будет эффективным при лечении симптомов других видов крапивницы, кроме

хронической спонтанной крапивницы.

Фармакокинетика

Дети

Рупатадин быстро всасывается после введения средней дозы 5 мг со средним значением T_{max} 0,5 часа после приема. Среднее значение C_{max} составил 2,5 нг/мл после однократного приема внутрь. Что касается экспозиции, средняя общая площадь под кривой (AUC) составила 8,86 нг • ч/мл. Все эти значения аналогичны тем, которые получены у взрослых и подростков.

Период полувыведения рупатадину у детей составлял 3,12 часа, это меньше, чем для таблеток, принимающих взрослые и подростки.

Эффект приема пищи

Исследование взаимодействия пищи с пероральным раствором рупатадину не проводили. Исследование влияния приема пищи проводили у взрослых и подростков, используя рупатадин в таблетках по 10 мг. Прием пищи усиливает системное влияние рупатадину на организм (AUC) приблизительно на 23%. Максимальная концентрация в плазме крови (t_{max}) в результате приема пищи не меняется. Эти различия не имеют клинического значения.

Метаболизм и выведение

При исследовании экскреции у взрослых 34,6% введенного рупатадину выводится с мочой, а 60,9% с фекалиями, собранными за 7 дней. Рупатадин подвергается значительному пресистемному метаболизму при пероральном пути введения. Изменена активная субстанция обнаруживается в моче и в кале лишь в незначительных количествах. Это означает, что рупатадин почти полностью метаболизируется. В общем, активные метаболиты дезлоратадина и других гидроксированных производных составляли соответственно 27% и 48% от общего системного воздействия активных веществ. Исследования метаболизма *in vitro* в микросомах печени человека показали, что рупатадин метаболизируется с участием цитохрома P450 (CYP 3A4).

Показания

Симптоматическое лечение аллергического ринита (включая персистирующий аллергический ринит) и крапивницы у детей в возрасте от 2 до 11 лет.

Противопоказания

Гиперчувствительность к рупатадину или к любому другому компоненту препарата.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Исследования взаимодействия рупатадину в виде орального раствора у детей не проводились.

Исследование взаимодействия были проведены только у взрослых и подростков (в возрасте от 12 лет) с применением рупатадину в виде таблеток 10 мг.

Влияние других лекарственных средств на рупатадин

Совместного назначения с мощными ингибиторами CYP3A4 (включая итраконазол, кетоконазол, вориконазол, позаконазол, ингибиторы ВИЧ-протеазы, кларитромицин, нефазодон) следует избегать. При совместном назначении с умеренными ингибиторами CYP3A4 (эритромицин, флуканозол, дилтиазем) следует проявлять осторожность.

Совместное назначение рупатадину в дозе 20 мг и кетоконазола или эритромицина усиливает системное влияние рупатадину в 10 раз и последних - в 2-3 раза. Эти комбинации не сопровождаются изменениями интервала QT или увеличением частоты побочных реакций по сравнению с отдельным применением указанных препаратов.

Взаимодействие с грейпфрутом

Одновременный прием рупатадину в таблетках по 10 мг и грейпфрутового сока в 3,5 раза усиливает общее действие рупатадину. Это происходит, потому что сок грейпфрута содержит один или более компонентов, которые ингибируют CYP3A4 и могут повысить концентрацию в плазме крови препаратов, метаболизм которых осуществляется с помощью CYP3A4, таких как рупатадин. Кроме того, было высказано предположение, что грейпфрут может влиять на кишечные транспортные системы лекарственных средств, такие как гликопротеин-P. Не следует употреблять грейпфрутовый сок одновременно с приемом препарата.

Влияние рупатадину на другие лекарственные средства

Следует соблюдать осторожность при одновременном назначении рупатадину с другими лекарственными средствами, которые метаболизируются и имеют узкий терапевтический индекс, поскольку данные о влиянии рупатадину на другие лекарственные средства ограничены.

Взаимодействие с алкоголем

После приема алкоголя доза рупатадину 10 мг незначительно влияет на результаты некоторых тестов на психомоторную работоспособность, значительно не отличается от влияния приема только одного алкоголя. Доза 20 мг усиливала изменения, вызванные приемом алкоголя.

Взаимодействие с депрессантами ЦНС

Как и в случае применения других антигистаминных препаратов, нельзя исключить взаимодействия с депрессантами ЦНС.

Взаимодействие со статинами

Бессимптомное повышение КФК иногда отмечали во время клинических исследований рупатадину. Риск при взаимодействии со статинами (некоторые из них также метаболизируются изоферментом CYP3A4 цитохрома P450) неизвестен. Поэтому рупатадин следует с осторожностью применять при одновременном назначении со статинами.

Особенности применения

Следует избегать комбинации рупатадину с мощными ингибиторами CYP3A4, и с осторожностью с умеренными ингибиторами CYP3A4.

Может потребоваться корректировка дозы чувствительных субстратов CYP3A4 (например, симвастатин, ловастатин) и субстратов CYP3A4 с узким терапевтическим индексом (например циклоспорин, такролимус, сиролимус, эверолимус, цизаприд), поскольку рупатадин может повышать концентрацию этих препаратов в плазме крови.

Влияние рупатадину в таблетках по 10 мг на функцию сердца оценивали в исследовании Thorough QT/QTc у взрослых, в котором рупатадин в дозе, превышающей терапевтическую в 10 раз, не влиял на ЭКГ и тем самым не вызывал настороженности по кардиологической безопасности. Однако рупатадин следует с осторожностью назначать пациентам с удлинением интервала QT, пациентам с нескорректированной гипокалиемией, пациентам с устойчивыми проаритмическими состояниями, такими как клинически значимая брадикардия, острая ишемия миокарда.

Сообщалось о повышении КФК, АлАТ, АсАТ, а также об изменении показателей функции печени как о редкие побочные явления рупатадину в таблетках по 10 мг у взрослых.

Не рекомендуется одновременный прием рупатадину с грейпфрутовым соком.

Пациенты с почечной или печеночной недостаточностью из-за отсутствия клинического опыта применения препарата пациентам с нарушениями функции почек или печени не рекомендуется.

Дети: была установлена безопасность и эффективность рупатадину в возрасте до 2 лет.

Это лекарственное средство содержит сахарин натрия, поэтому он может быть вреден для зубов. Пациентам с редкими наследственными формами фруктозной непереносимости, синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции или сахароз-изомальтазной недостаточности не следует принимать этот препарат.

Лекарственное средство содержит метилпарагидроксибензоат, что может вызвать аллергические реакции (возможно, замедленные).

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

Лекарственное средство применяется детям.

Рупатадин в дозе 10 мг не имел никакого влияния на способность управлять автомобилем и работать с другими механизмами в проведенных клинических исследованиях. Однако пациент должен сначала оценить собственную реакцию на лечение препаратом, прежде чем управлять автотранспортом или работать с механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность

Данные об ограниченном количестве (2) беременностей, при которых принимали рупатадин, указывают на отсутствие побочных эффектов рупатадину на беременность или здоровья плода/новорожденного. В настоящее время нет других соответствующих эпидемиологических данных. Исследования на животных не проявляют прямого или косвенного вредного влияния на беременность, развитие эмбриона/плода, на течение родов или на постнатальное развитие. В качестве меры пресечения рекомендуется избегать применения препарата в период беременности.

Кормление грудью

Рупатадин проникает в молоко животных. Неизвестно, проникает рупатадин в грудное молоко женщины. Решение о прекращении кормления грудью или прекращения/удержание от терапии рупатадином следует принимать, учитывая пользу от кормления грудью для ребенка и пользу от лечения для матери.

Фертильность

Отсутствуют клинические данные о влиянии препарата на фертильность. Исследования на животных показали значительное снижение фертильности при уровнях воздействия выше, чем у людей при максимальной терапевтической дозе.

Способ применения и дозы

Для обеспечения точного дозирования упаковка содержит шприц-дозатор.

В горловину флакона вставить шприц-дозатор и отмерить необходимое количество раствора с учетом возраста и массы тела ребенка.

Следует обратить внимание, если флакон адаптер, расположенный в горловине, в таком случае плотно вставить шприц-дозатор в шейку адаптера и перевернуть флакон вверх дном, осторожно потянуть поршень, втягивая жидкость в шприц-дозатор до нужной отметки. Набрав нужное количество раствора, перевернуть флакон в исходное положение и осторожно вынуть шприц-дозатор из флакона.

После использования промыть детали шприца-дозатора теплой водой.

Дозировка

Дети в возрасте от 2 до 11 лет

С массой тела от 10 кг, но менее 25 кг: 2,5 мл (2,5 мг рупатадину) орального раствора 1 раз в сутки независимо от приема пищи.

С массой тела от 25 кг 5 мл (5 мг рупатадину) орального раствора 1 раз в сутки независимо от приема пищи.

Дети

Лекарственное средство применять детям в возрасте от 2 до 11 лет.

Поскольку недостаточно данных о применении лекарственного средства детям до 2 лет, не рекомендуется применять его в этой возрастной категории.

Передозировка

Не сообщали о случаях передозировки препаратом у взрослых и детей. В ходе исследования клинической безопасности рупатадин хорошо переносился в суточной дозе 100 мг в течение 6 дней. Наиболее распространенной побочной реакцией была сонливость. При случайном проглатывании очень высоких доз следует провести симптоматическое лечение и принять необходимые поддерживающих мероприятий.

Побочные реакции

Частота нежелательных реакций определена следующим образом: часто ($\geq 1/100$ <1/10) нечасто ($\geq 1/1000$ <1/100).

Со стороны крови и лимфатической системы: нечасто - эозинофилия, нейтропения.

Со стороны нервной системы: часто - головная боль, сонливость нечасто - головокружение.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: редко - тошнота.

Со стороны кожи и соединительной ткани: нечасто - экзема, ночная потливость.

Инфекции и инвазии: нечасто - грипп, назофарингит, инфекции верхних дыхательных путей.

Общие нарушения: нечасто - утомляемость.

Срок годности

2 года.

Срок годности после вскрытия флакона - 12 месяцев.

Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 100 мл во флаконе без адаптера. По 1 флакону со шприцем-дозатором в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

АО «Фармак».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 04080, г. Киев, ул. Кирилловская, 74.

Источник инструкции

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