

## **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 (E 171), макрогол 3350, триацетин, индигокармин алюминиевый лак (E 132), хинолиновый желтый алюминиевый лак (E 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 H<sub>1</sub>-рецепторы. После перорального применения дезлоратадин селективно блокирует периферические гистаминовые H<sub>1</sub>-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).

| <b>Классы/системы органов</b>                                    | <b>Частота возникновения</b> | <b>Побочные реакции</b>  |
|--|------------------------------|--|
| <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<br>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](#).