

## **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 P-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 кетоназолом, 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 завершённой 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
<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>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

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

**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](#).