

**ЗАТВЕРДЖЕНО**  
**Наказ Міністерства охорони**  
**здоров'я України**  
**24.01.2019 № 192**  
**Реєстраційне посвідчення**  
**№ UA/17179/01/01**

**ЗМІНИ ВНЕСЕНО**  
**Наказ Міністерства охорони**  
**здоров'я України**  
**№ \_\_\_\_\_**

**ІНСТРУКЦІЯ**  
**для медичного застосування лікарського засобу**

**АЛЕРГОЗАН®**  
**(ALLERGOSAN®)**

**Склад:**

*діюча речовина:* дезлоратадин;

1 таблетка містить дезлоратадину 5 мг;

*допоміжні речовини:* целюлоза мікрокристалічна, кальцію гідрофосфат дигідрат, крохмаль кукурудзяний, гіпромелоза, тальк, натрію стеарилфумарат, кремнію діоксид колоїдний безводний;

*плівкове покриття:* Опадрай П 33F 205000 синій (гіпромелоза, лактози моногідрат, титану діоксид (E 171), макрогол 3350, індигокармін алюмінієвий лак (E 132), хіноліновий жовтий алюмінієвий лак (E 104)).

**Лікарська форма.** Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

*Основні фізико-хімічні властивості:* світло-синього кольору, круглі, двоопуклі таблетки, вкриті плівковою оболонкою, діаметром 6 мм ± 0,2 мм.

**Фармакотерапевтична група.**

Інші антигістамінні засоби для системного застосування.

Код АТХ R06A X27.

**Фармакологічні властивості.**

*Фармакодинаміка.*

Дезлоратадин – це неседативний антигістамінний препарат тривалої дії, що чинить селективну антагоністичну дію на периферичні H<sub>1</sub>-рецептори. Після перорального застосування дезлоратадин селективно блокує периферичні гістамінові H<sub>1</sub>-рецептори.

У дослідженнях *in vitro* дезлоратадин продемонстрував на клітинах ендотелію свої антиалергічні та протизапальні властивості. Це проявлялося пригніченням виділення прозапальних цитокінів, таких як IL-4, IL-6, IL-8 та IL-13 із мастоцитів/базофілів людини, а також пригніченням експресії молекул клітинної адгезії Р-селектину на ендотеліальних клітинах. Клінічна значущість цих спостережень ще потребує підтвердження.

У клінічних дослідженнях високих доз, у яких дезлоратадин щоденно застосовували у дозі до 20 мг протягом 14 днів, ніяких статистично чи клінічно значущих змін з боку серцево-судинної системи не спостерігалось. У клініко-фармакологічному дослідженні, в якому застосовувався дезлоратадин у дозі 45 мг на добу (у 9 разів більше клінічної дози) протягом 10 днів, подовження інтервалу QT не спостерігалось.

Дезлоратадин майже не проникає у центральну нервову систему. У контрольованих клінічних дослідженнях, при прийомі в рекомендованій дозі по 5 мг на добу, надмірної частоти виникнення сонливості порівняно з плацебо не спостерігалось. У клінічних дослідженнях при одноразовому прийомі дезлоратадин у добовій дозі 7,5 мг не чинив впливу на психомоторну активність.

У клініко-фармакологічних дослідженнях при одночасному застосуванні з алкоголем порушення, пов'язані з алкоголем, такі як погіршення продуктивності або підвищення сонливості, не прогресували. Не було виявлено суттєвих відмінностей у результатах психомоторного тестування між групами з дезлоратадином та плацебо, як при самостійному застосуванні, так і при одночасному застосуванні з алкоголем.

У пацієнтів з алергічним ринітом дезлоратадин ефективно усував такі симптоми, як чхання, виділення з носа та свербіж, а також подразнення очей, сльозотечу та почервоніння, свербіж піднебіння. Дезлоратадин ефективно контролював симптоми упродовж 24 годин.

Дезлоратадин ефективно полегшує тяжкість перебігу сезонного алергічного риніту, як видно із сумарного показника опитувальника з оцінки якості життя при ринокон'юнктивіті. Максимальне покращення відзначалося у пунктах, пов'язаних із практичними проблемами і щоденною діяльністю, які обмежували симптоми.

Хронічну ідіопатичну кропив'янку вивчали у клінічній моделі з умовами кропив'янки. Оскільки викид гістаміну є причинним фактором при всіх формах кропив'янки, очікується, що дезлоратадин, окрім хронічної ідіопатичної кропив'янки, буде ефективно полегшувати симптоми при інших формах кропив'янки, як рекомендовано у клінічних настановах.

У двох плацебо-контрольованих 6-тижневих дослідженнях з участю пацієнтів із хронічною ідіопатичною кропив'янкою дезлоратадин ефективно полегшував свербіж і зменшував кількість та розмір висипань до кінця першого інтервалу дозування. У кожному дослідженні ефект тривав протягом 24-годинного інтервалу дозування. Полегшення свербіжу на більш ніж 50 % відзначалося у 55 % пацієнтів, які приймали дезлоратадин, порівняно з 19 % пацієнтів, які приймали плацебо. Прийом препарату не виявляє істотного впливу на сон та денну активність.

*Фармакокінетика.*

*Всмоктування.* Концентрації дезлоратадину у плазмі крові можна визначити через 30 хвилин після прийому препарату. Дезлоратадин добре абсорбується, максимальна концентрація досягається приблизно через 3 години; період напіввиведення становить приблизно 27 годин. Ступінь кумуляції дезлоратадину відповідав його періоду напіввиведення (приблизно 27 годин) та частоті прийому 1 раз на добу. Біодоступність дезлоратадину була пропорційна до дози у діапазоні від 5 до 20 мг.

У фармакокінетичному дослідженні, в якому демографічні дані пацієнтів були порівняні із загальною популяцією із сезонним алергічним ринітом, 4 % учасників досягли вищої концентрації дезлоратадину. Цей відсоток може варіюватися залежно від етнічної приналежності. Максимальна концентрація дезлоратадину була приблизно у 3 рази вища через приблизно 7 годин, із термінальним періодом напіввиведення приблизно 89 годин. Профіль безпеки цих пацієнтів не відрізнявся від профілю у загальній популяції.

*Розподіл.* Дезлоратадин помірно зв'язується з білками плазми крові (83-87 %). При застосуванні дози дезлоратадину (від 5 до 20 мг) 1 раз на добу протягом 14 днів ознак клінічно значущої кумуляції активної речовини не виявлено.

*Метаболізм.* Фермент, який відповідає за метаболізм дезлоратадину, дотепер не виявлено, тому неможливо повністю виключити деякі взаємодії з іншими лікарськими засобами. Дезлоратадин не пригнічує CYP3A4 *in vivo*, дослідження *in vitro* продемонстрували, що лікарський засіб не пригнічує CYP2D6 і не є ні субстратом, ні інгібітором Р-глікопротеїну.

*Виведення.* У дослідженні одноразового прийому дезлоратадину в дозі 7,5 мг вживання їжі (жирний висококалорійний сніданок) не впливає на фармакокінетику дезлоратадину. Також встановлено, що грейпфрутовий сік також не впливає на фармакокінетику дезлоратадину.

## **Клінічні характеристики.**

### **Показання.**

Дезлоратадин призначається дорослим та дітям старше 12 років для полегшення симптомів, пов'язаних з:

- алергічним ринітом (див. розділ «Фармакологічні властивості»);
- кропив'янкою (див. розділ «Фармакологічні властивості»).

### **Протипоказання.**

Підвищена чутливість до активної речовини або до будь-якої з допоміжних речовин препарату або до лоратадину.

### **Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.**

У клінічних дослідженнях таблеток дезлоратадину при одночасному застосуванні еритроміцину або кетоконазолу жодних клінічно значущих взаємодій не спостерігалось.

За даними клініко-фармакологічних досліджень, при одночасному застосуванні препарату з алкоголем не відзначалося посилення негативного впливу етанолу на психомоторну функцію. Однак у постреєстраційному періоді спостерігалися випадки непереносимості алкоголю та алкогольна інтоксикація під час застосування препарату. Тому необхідно бути обережними при одночасному застосуванні алкоголю у період лікування дезлоратадином.

### **Особливості застосування.**

У хворих з нирковою недостатністю високого ступеня прийом дезлоратадину слід здійснювати під контролем лікаря.

Дезлоратадин слід з обережністю застосовувати пацієнтам із нападами судом у медичному або сімейному анамнезі, головним чином маленьким дітям, які більш схильні до розвитку нових судом при лікуванні дезлоратадином. Лікар може розглянути питання про припинення застосування дезлоратадину у пацієнтів, у яких спостерігаються напади судом під час лікування.

Дезлоратадин містить лактозу. Пацієнти із рідкісними спадковими проявами непереносимості галактози, дефіциту лактози Лаппа чи глюкозо-галактозної мальабсорбції не повинні приймати цей лікарський засіб.

### **Застосування у період вагітності або годування груддю.**

**Вагітність.** Дезлоратадин не продемонстрував тератогенність у дослідженнях на тваринах. Безпека застосування препарату у період вагітності не встановлена, тому застосування дезлоратадину у цей період не рекомендується.

**Годування груддю.** Дезлоратадин проникає у грудне молоко, тому його застосування жінкам, які годують груддю, не рекомендується.

### **Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.**

У клінічних дослідженнях, під час яких оцінювали здатність керувати автотранспортом, жодних погіршень у пацієнтів, які приймали дезлоратадин, не виявлено. Однак пацієнтів слід проінформувати, що дуже рідко деякі люди відчують сонливість, що може вплинути на їх здатність керувати автомобілем та складною технікою.

### **Спосіб застосування та дози.**

Застосовувати перорально, незалежно від прийому їжі.

**Дорослим та дітям віком від 12 років:** рекомендовано по 1 таблетці 1 раз на добу, незалежно від прийому їжі, для усунення симптомів, асоційованих з алергічним ринітом (включаючи інтермітуючий та персистуючий алергічний риніт) та кропив'янкою.

Терапію інтермітуючого алергічного риніту (наявність симптомів менше 4 днів на тиждень або менше 4 тижні) необхідно проводити з урахуванням даних анамнезу: припинити після зникнення симптомів та відновити після повторного їх виникнення.

При персистуючому алергічному риніті (наявність симптомів більше 4 днів на тиждень або більше 4 тижнів) необхідно продовжувати лікування протягом усього періоду контакту з алергеном.

#### *Діти.*

Існують обмежені дані клінічних досліджень ефективності застосування дезлоратадину у підлітків від 12 до 17 років (див. розділ «Побічні реакції»).

Немає встановлених даних щодо ефективності та безпечності застосування дезлоратадину у дітей віком до 12 років.

#### **Передозування.**

При передозуванні побічні реакції аналогічні тим, що спостерігались у терапевтичних дозах, але прояви можуть бути сильнішими.

*Симптоми.* У клінічних дослідженнях, у яких дезлоратадин вводили у дозах до 45 мг (що у 9 разів перевищували рекомендовані), клінічно значущі небажані реакції не спостерігалися.

*Лікування.* У разі передозування слід застосовувати стандартні заходи для видалення неабсорбованої активної речовини. Рекомендується симптоматичне та підтримуюче лікування. Дезлоратадин не видаляється шляхом гемодіалізу; можливість його видалення при перитонеальному діалізі не встановлена.

#### **Побічні реакції.**

У клінічних дослідженнях щодо показань, включаючи алергічний риніт та хронічну ідіопатичну кропив'янку, про небажані ефекти на дезлоратадин у пацієнтів, які отримували рекомендовану дозу 5 мг на добу, повідомлялося на 3 % частіше, ніж у пацієнтів, які отримували плацебо.

Найчастіше, порівняно з плацебо, повідомлялося про такі побічні реакції, як підвищена стомлюваність (1,2 %), сухість у роті (0,8 %) та головний біль (0,6 %).

*Діти.* У клінічних дослідженнях за участю 578 підлітків віком від 12 до 17 років найбільш розповсюдженим побічним ефектом був головний біль, він спостерігався у 5,9 % пацієнтів, які приймали дезлоратадин, та у 6,9 % пацієнтів, які отримували плацебо.

Інші побічні реакції, що спостерігалися у післяреєстраційному періоді з невідомою частотою: подовження інтервалу QT, аритмія та брадикардія.

Сумарна таблиця частоти побічних реакцій.

Частота визначається як дуже часто ( $\geq 1/10$ ), часто ( $\geq 1/100$ ,  $< 1/10$ ), нечасто ( $\geq 1/1000$ ,  $< 1/100$ ), рідко ( $\geq 1/10000$ ,  $< 1/1000$ ), дуже рідко ( $< 1/10000$ ) та частота невідома (не може бути оцінена, виходячи з наявних даних).

<b>Класи/системи органів</b>	<b>Частота виникнення</b>	<b>Побічні реакції</b>
<i>Психічні розлади</i>	<i>дуже рідко</i>	галюцинації
	<i>частота невідома</i>	аномальна поведінка, агресія
<i>З боку нервової системи</i>	<i>часто</i>	головний біль
	<i>дуже рідко</i>	запаморочення, сонливість, безсоння, психомоторна гіперактивність, судоми
<i>З боку серця</i>	<i>дуже рідко</i>	тахікардія, прискорене серцебиття
	<i>частота невідома</i>	подовження інтервалу QT
<i>З боку шлунково-кишкового тракту</i>	<i>часто</i>	сухість у роті
	<i>дуже рідко</i>	біль у животі, нудота, блювання, диспепсія, діарея
<i>З боку гепатобіліарної системи</i>	<i>дуже рідко</i>	підвищення рівня ферментів печінки, підвищення білірубіну, гепатит
	<i>частота невідома</i>	жовтяниця

<i>З боку шкіри та підшкірних тканин</i>	<i>частота невідома</i>	фоточутливість
<i>З боку скелетно-м'язової системи та сполучної тканини</i>	<i>дуже рідко</i>	міалгія
<i>Загальні порушення</i>	<i>часто</i>	підвищена стомлюваність
	<i>дуже рідко</i>	реакції підвищеної чутливості (анафілаксія, ангіоневротичний набряк, задишка, свербіж, висипання та кропив'янка)
	<i>частота невідома</i>	астенія
<i>Розлади метаболізму та харчування</i>	<i>частота невідома</i>	підвищення апетиту
<i>Дослідження</i>	<i>частота невідома</i>	збільшення ваги

**Термін придатності.** 3 роки.

**Умови зберігання.**

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Зберігати при температурі не вище 25 °С.

**Упаковка.**

По 10 таблеток у блістері. По 1 або 3 блістери в картонній пачці.

**Категорія відпуску.** Без рецепта.

**Виробник.**

АТ «Софарма».

**Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.**

вул. Ілієнське шосе, 16, Софія, 1220, Болгарія.