

# ІНСТРУКЦІЯ

## для медичного застосування препарату

### АЛЕРСІС ALERSIS

#### **Склад:**

*діюча речовина:*

1 мл розчину містить 0,5 мг дезлоратадину;

*допоміжні речовини:*

натрію бензоат (E211), сахарин натрію, сорбіт (E420), пропіленгліколь, кислота лимонна безводна, натрію цитрат безводний, гідроксіетилцелюлоза, ароматизатор апельсиновий, вода очищена.

**Лікарська форма.** Розчин оральний.

**Основні фізико-хімічні властивості.** Прозорий або злегка опалесцентний, практично безбарвний розчин із запахом апельсину.

**Фармакотерапевтична група.** Антигістамінні засоби для системного застосування.

Код АТХ. R06A X27.

#### **Фармакологічні властивості.**

*Фармакодинаміка.*

Дезлоратадин – це неседативний антигістамінний препарат тривалої дії, що має селективну антагоністичну дію на периферичні H<sub>1</sub>-рецептори. Запобігає розвитку алергічних реакцій і полегшує їх перебіг, зменшує проникність капілярів, запобігає розвитку набряку тканин, спазму гладкої мускулатури. Після перорального введення дезлоратадин селективно блокує периферичні гістамінові H<sub>1</sub>-рецептори. Препарат не проникає у центральну нервову систему.

Численні дослідження показали, що, крім антигістамінної активності, дезлоратадининить протиалергічну та протизапальну дію. Встановлено, що дезлоратадинпригнічує каскад різних реакцій, які лежать в основі розвитку алергічного запалення, а саме:

- виділення прозапальних цитокінів, включаючи ІЛ-4, ІЛ-6, ІЛ-8, ІЛ-13;
- виділення прозапальних хемокінів, таких як RANTES;
- продукцію супероксидного аніону активованими поліморфноядерними нейтрофілами;
- адгезію і хемотаксис еозинофілів;
- експресію молекул адгезії, таких як Р-селектин;
- IgE-залежне виділення гістаміну, простагландину D2 і лейкотрієну C4;
- гострий алергічний бронхоспазм.

Антиалергічні та протизапальні властивості обумовлюють високу ефективність дезлоратадину.

Дезлоратадин ефективно усуває як назальні симптоми алергічного риніту, так і неназальні (свербіж та почервоніння очей, сльозотеча, свербіж піднебіння, кашель тощо). Дезлоратадин ефективний також у випадку поєднання у пацієнта бронхіальної астми з алергічним ринітом. У таких хворих дія дезлоратадину розповсюджується не тільки на симптоми риніту, але й на клінічний перебіг астми, поліпшуючи показники функції зовнішнього дихання і зменшуючи потребу в $\beta$ 2-агоністах.

Безпека застосування дезлоратадину дітям була продемонстрована у 3 клінічних дослідженнях.

Дезлоратадин призначався дітям віком від 6 місяців до 11 років, яким було необхідне проведення антигістамінної терапії, у добовій дозі 1 мг (вікова група від 6 до 11 місяців), 1,25 мг (вікова група від 1 до 5 років) або 2,5 мг (від 6 до 11 років). Лікування переносилося добре, що було підтверджено результатами клінічних лабораторних досліджень, станом життєво важливих функцій організму та даними ЕКГ (включаючи довжину інтервалу QT).

Під час клінічних досліджень щоденне застосування дезлоратадину у дозі до 20 мг протягом 14 днів не супроводжувалося статистично клінічно значущими змінами з боку серцево-судинної системи. У ході клініко-фармакологічного дослідження застосування дезлоратадину у дозі 45 мг/добу (у 9 разів вище терапевтичної дози) протягом 10 днів не спричинило подовження інтервалу QT.

Дезлоратадин не проникає крізь гематоенцефалічний бар'єр, не чинить седативного ефекту При застосуванні рекомендованої дози 5 мг частота сонливості не перевищувала таку в групі плацебо. У ході клінічних досліджень дезлоратадин не впливав на психомоторну функцію при прийомі дози до 7,5 мг.

#### **Фармакокінетика.**

Дезлоратадин починає визначатися в плазмі протягом 30 хв після прийому. Дезлоратадин ефективно контролює симптоми упродовж 24 годин. Максимальна концентрація дезлоратадину в плазмі досягається у середньому через 3 год, період напіввиведення становить у середньому 27 год. Ступінь кумуляції дезлоратадину відповідає його періоду напіввиведення (приблизно 27 год) і кратності застосування (один раз на добу). Біодоступність дезлоратадину була пропорційна дозі в діапазоні від 5 до 20 мг.

Дезлоратадин помірно (83 – 87 %) зв'язується з білками плазми. При застосуванні дезлоратадину в дозі від 5 до 20 мг один раз на добу протягом 14 днів ознак клінічно значущої кумуляції препарату не виявлено.

При проведенні перехресних порівняльних досліджень з однаковою дозою препарату було виявлено біоеквівалентність препарату у формі таблеток і сиропу.

При проведенні фармакокінетичних досліджень у педіатричній практиці було виявлено, що показники AUC і  $C_{max}$  дезлоратадину (при застосуванні у рекомендованих дозах) можуть бути прирівняні до таких же показників у дорослих, які приймали дезлоратадин у формі сиропу в дозі 5 мг.

Результати досліджень показали, що дезлоратадин не пригнічує CYP3A4 чи CYP2D6 та не є ні субстратом, ні інгібітором Р-глікопротеїду.

Їжа (жирний висококалорійний сніданок) або грейпфрутовий сік не впливають на розподіл дезлоратадину.

### **Клінічні характеристики**

#### **Показання.**

Для усунення симптомів, пов'язаних з алергічним ринітом (чхання, виділення з носа, свербіж, набряк та закладеність носа, а також свербіж та почервоніння очей, слезотеча, свербіж піднебіння та кашель).

Для усунення симптомів, пов'язаних з кропив'янкою (свербіж, висипання).

#### **Протипоказання.**

Підвищена чутливість до дезлоратадину або будь-якого допоміжного компонента препарату.

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

Клінічно значущих змін у плазмовій концентрації дезлоратадину при неодноразовому сумісному застосуванні з кетоконазолом, еритроміцином, азитроміцином, флюоксетином, циметидином виявлено не було. У зв'язку з тим, що фермент, який відповідає за метаболізм дезлоратадину, не встановлений, взаємодію з іншими лікарськими засобами повністю виключити неможливо.

Дезлоратадин можна застосовувати у поєднанні з препаратами, що блокують цитохром P450, та алкоголем.

#### **Особливості застосування.**

У клініко-фармакологічних дослідженнях дезлоратадин не посилював такі ефекти алкоголю, як порушення психомоторної функції та сонливість. Результати психомоторних тестів істотно не відрізнялися у пацієнтів, які застосовували дезлоратадин і плацебо окремо чи разом з алкоголем.

Слід з особливою обережністю призначати препарат пацієнтам з тяжкою нирковою недостатністю.

Прийом дезлоратадину не чинить негативної дії на шлунково-кишковий тракт, тому препарат можна застосовувати незалежно від прийому їжі в будь-який зручний для пацієнта час.

Лікарський засіб містить сорбіт, тому його не слід застосовувати пацієнтам з вродженою непереносимістю фруктози.

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

Безпека застосування дезлоратадину вагітним не встановлена, тому не рекомендується застосовувати його під час вагітності.

Дезлоратадин проникає в грудне молоко, тому жінкам, які годують груддю, застосовувати дезлоратадин не рекомендується.

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

Пацієнтів слід поінформувати, що у поодиноких випадках можливе виникнення сонливості, що може вплинути на їх здатність керувати автомобілем та складною технікою

### **Спосіб застосування та дози.**

Для усунення симптомів, пов'язаних з алергічним ринітом (у тому числі інтермітуючим і персистувальним) і кропив'янкою, Алерсіс застосовують незалежно від прийому їжі у таких дозах:

- діти:*
- віком від 6 до 11 місяців: по 2 мл розчину орального (1 мг дезлоратадину) один раз на добу;
  - віком від 1 до 5 років: по 2,5 мл розчину орального (1,25 мг дезлоратадину) один раз на добу;
  - віком від 6 до 11 років: по 5 мл розчину орального (2,5 мг дезлоратадину) один раз на добу;

*дорослі та підлітки* (<sup>3</sup> 12 років): 10 мл розчину орального (5 мг дезлоратадину) один раз на добу.

Терапію інтермітуючого алергічного риніту (наявність симптомів менше 4 днів на тиждень або менше 4 тижнів) необхідно проводити з урахуванням даних анамнезу: припинити після зникнення симптомів та відновити після повторного їх виникнення. При персистувальному алергічному риніті (наявність симптомів більше 4 днів на тиждень або більше 4 тижнів) необхідно продовжувати лікування протягом усього періоду контакту з алергеном.

*Діти.* Ефективність і безпека застосування розчину орального Алерсіс дітям віком до 6 місяців не встановлені.

### **Передозування.**

У разі передозування вживають стандартних заходів, спрямованих на видалення неабсорбованої активної речовини, застосовують симптоматичне лікування.

При застосуванні дезлоратадину у дозах до 45 мг (що у 9 разів перевищує рекомендовані) у ході клінічних досліджень у дорослих і підлітків клінічно значущих ефектів не спостерігалось.

Дезлоратадин не видаляється шляхом гемодіалізу; можливість його видалення шляхом перитонеального діалізу не встановлена.

**Побічні реакції.** У ході клінічних досліджень застосування дезлоратадину за показаннями, включаючи алергічний риніт та хронічну ідіопатичну кропив'янку, про небажані ефекти у пацієнтів, які отримували дозу 5 мг на добу, повідомлялося на 3 % частіше, ніж про такі у пацієнтів, які отримували плацебо. Найчастіше, порівняно з плацебо, повідомлялося про такі побічні ефекти, як стомлюваність (1,2 %), сухість у роті (0,8 %) та головний біль (0,6 %). Під час клінічних досліджень застосування дезлоратадину у дітей віком від 2 до 11 років кількість випадків побічних реакцій була однаковою як в групі сиропу, так і в групі плацебо. У дітей віком від 6 до 23 місяців найбільш частими (порівняно з плацебо) небажаними явищами були діарея (3,7 %), пропасниця (2,3 %) і безсоння (2,3 %).

Інші побічні ефекти, про які дуже рідко повідомлялося під час постмаркетингового періоду, зазначено нижче.

*Психічні розлади:* галюцинації.

*З боку нервової системи:* запаморочення, сонливість, психомоторна гіперактивність, судоми.

*З боку серця:* тахікардія, відчуття серцебиття.

*З боку шлунково-кишкового тракту:* біль у животі, нудота, блювання, диспепсія.

*З боку гепатобіліарної системи:* підвищення рівня ферментів печінки, підвищений білірубін, гепатит.

*З боку скелетно-м'язової системи та сполучної тканини:* міалгія.

*Загальні порушення:* реакції гіперчутливості (такі як анафілаксія, набряк Квінке, задишка, свербіж, висипання та кропив'янка).

**Термін придатності.** 2 роки.

Термін придатності після першого розкриття флакону -48 днів.

**Умови зберігання.** Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці.

**Упаковка.** По 60 мл розчину у флаконі разом з мірним стаканчиком у картонній пачці.

**Категорія відпуску.** Без рецепта.

**Виробник** Лабораторіос Нормон С.А.

**Місцезнаходження.** Ронда де Вальдекаррісо, 6, Трес Кантос, 28760, Мадрид, Іспанія.