

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ФРІБРІС
FREEBRIS

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: дезлоратадин – 8-хлоро-6,11-дигідро-11-(4-піперидиніліден)-5Н-бензо[5,6]циклогепта[1,2-b]піридин.

основні фізико-хімічні властивості: прозора сиропоподібна рідина жовто-оранжевого кольору, з фруктовим запахом;

склад: 5 мл сиропу містять дезлоратадину 2.5 мг;

допоміжні речовини: цукроза, динатрію ЕДТА, натрію бензоат, пропіленгліколь, гліцерин, кислоти лимонної моногідрат, натрію цитрат, барвник „сенсет жовтий”, есенція змішаних фруктів, вода очищена.

Форма випуску.

Сироп.

Фармакотерапевтична група.

Антигістамінні препарати для системного застосування. Код АТХ R06AX27

Фармакологічні властивості.

Дезлоратадин є селективним блокатором периферичних гістамінових H_1 -рецепторів, що не спричиняє седативного ефекту. Дезлоратадин є первинним активним метаболітом лоратадину. Дезлоратадин також виявляє протиалергічну та протизапальну дію за рахунок блокування виведення гістаміну з опасистих клітин.

Фармакокінетика. Після прийому внутрішньо препарат селективно блокує периферійні H_1 -гістамінові рецептори і не проникає через гематоенцефалічний бар'єр, що встановлено згідно з результатами дослідження розповсюдження радіоактивних тканин у щурів та зв'язку радіолігандного H_1 -рецептору у морських свинок. Завдяки можливості дезлоратадину вступати у зв'язок з гістаміновим рецептором вже при концентрації 2–3 нг/мл (7 нмол), він має високу тропність до H_1 рецепторів людини.

Препарат пригнічує ряд цитотоксичних реакцій, що лежать в основі розвитку алергічного запалення, а саме виділення про запальних цитокінів, в тому числі інтерлейкіна-4 (ІЛ-4), інтерлейкіну-6 (ІЛ-6), інтерлейкіну-8 (ІЛ-8), інтерлейкіну-13 (ІЛ-13), хемокинів типу RANTES, продукцію су пероксидного аніону активованого поліморфно ядерними нейтрофілами, адгезію і хемотаксис еозинофілів, експресію молекул адгезії, в тому числі Р-селектину, ІgЕ-залежне виділення гістаміну, простагландину D_2 (ПГ D_2) і лейкотрієну C_4 (ЛТС C_4).

Дослідження на тваринах виявили здатність дезлоратадину усувати гострий алергічний бронхоспазм.

В ході клінічних досліджень щоденний прийом у дорослих і підлітків дезлоратадину у дозі до 20 мг протягом 14 діб не супроводжувався значними (статистичними або клінічними) змінами з боку серцево-судинної системи.

У клінічно-фармакологічному дослідженні використання дезлоратадину у дозі 45 мг на добу (в 9 разів вище терапевтичної) протягом 10 днів не викликало подовження інтервалу QT і не супроводжувалось появою серйозної побічної дії. Використання дезлоратадину у дозі 7,5 мг не супроводжувалось порушенням психомоторних функцій, а у дозі 5 мг — збільшенням частоти виникнення сонливості, у порівнянні з групою плацебо.

Фармакокінетика: дезлоратадин добре поглинається після перорального введення. Біодоступність дезлоратадину пропорційна дозі (у діапазоні від 5 до 20 мг). Дезлоратадин починає визначатися в плазмі протягом 30 хв після прийому. Час досягнення C_{max} (максимальної концентрації) в плазмі після одноразового прийому 5 або 7,5 мг — 2–6 год (в середньому 3 год). Дезлоратадин помірно зв'язується з білками плазми на 83–87 %. Період напіввиведення ($T_{1/2}$) — 20–30 год (у середньому 27 год).

Не проникає через гематоенцифалічний бар'єр, проникає через плацентарний бар'єр та в грудне молоко. Екстенсивно метаболізується шляхом глюкурування і гідроксилірування з утворенням 3-ОН-дезлоратадину. Виводиться з сечею (менш ніж 2 % у незмінному вигляді) та з фекаліями (не менш ніж 7 % у незмінному вигляді). При прийомі в дозах 5–20 мг/добу протягом 2 тижнів кумуляції не спостерігається. При проведенні перехрест них порівняльних досліджень з однаковою дозою препарату було виявлено біоеквівалентність препарату у формі таблеток та сиропу. При проведенні фармакокінетичних досліджень у педіатричній практиці було виявлено, що показники AUC та максимальна концентрація (C_{max}) дезлоратадину при застосуванні у рекомендованих дозах можуть бути прирівняні до аналогічних показників у дорослих, які отримували дезлоратадин у формі сиропу у дозі 5 мг. Проведені дослідження показали, що дезлоратадин не пригнічує CYP3A4 та не впливає на P-глікопротеїд. У дослідженні з одноразовим прийомом дезлоратадину дозою 7,5 мг було показано, що їжа не впливає на розподіл дезлоратадину.

Показання для застосування.

Усунення симптомів алергії, в тому числі пов'язаних із сезонним і постійним алергічним ринітом: чхання, виділень з носа й свербіж, закладеність носа, свербіж в області очей, слезовиділення, почервоніння, свербіж у ділянці піднебіння і кашлю.

Симптоматичне лікування хронічної ідіопатичної кропив'янки.

Спосіб застосування та дози.

Дітям від 2 до 5 років: 2,5 мл (1,25 мг – $\frac{1}{2}$ мірної ложечки) сиропу один раз на день, незалежно від прийому їжі.

Дітям від 6 до 11 років: 5 мл (2,5 мг – 1 мірна ложечка) сиропу один раз на день, незалежно від прийому їжі.

Дорослим і дітям (від 12 років): 10 мл (5 мг – 2 мірні ложечки) сиропу один раз на день, незалежно від прийому їжі.

Тривалість лікування не повинна перевищувати 14 днів.

Побічна дія.

При застосуванні рекомендованої дози 5 мг на день, небажаний ефект при застосуванні дезлоратадину в таблетках спостерігався у 3 %. Найбільш поширені побічні ефекти у порівнянні із застосуванням плацебо: втомленість (1,2 %), сухість у роті (0,8 %) і головний біль (0,6 %). Дуже рідко спостерігались випадки появи реакцій підвищеної чутливості, в тому числі алергічні реакції і висипання на шкірі.

Також дуже рідко спостерігались тахікардія, відчуття серцебиття, збільшення рівня ферментів у печінці, гепатит, збільшення рівня білірубіну.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до препарату або до його компонентів. Діти до 2 років.

Передозування.

У разі передозування слід прийняти стандартних заходів для виведення активної речовини, що не засвоїлась. Рекомендується проводити симптоматичне і підтримуюче лікування.

Згідно з результатами клінічного дослідження, в межах якого призначалась доза до 45 мг дезлоратадину (що у дев'ять разів перевищувала рекомендовані), значні клінічні ефекти не спостерігались. Дезлоратадин не виводиться при гемодіалізі, можливість його виведення при перитонеальному діалізі не встановлена.

Особливості застосування.

Вагітність і лактація. Фрібрис не рекомендований для прийому під час вагітності, тому що відповідні клінічні дослідження не проводилися і його безпечність для вагітних не встановлена. Дезлоратадин потрапляє в грудне молоко, тому, беручи до уваги важливість препарату для матері, слід вирішити: або припинити

годування груддю, або відмовитись від дезлоратадину. Безпечність і ефективність застосування дезлоратадину сиропу для дітей віком до 2 років не досліджувались.

При застосуванні дезлоратадину не спостерігалось жодного впливу на можливість керувати автомобілем чи роботу зі складними технічними приладами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Не відома.

Умови та термін зберігання.

Зберігати при кімнатній температурі (15 – 25 °C), у захищеному від світла та недоступному для дітей місці.

Термін придатності - 2 роки.

Не рекомендується вживати після закінчення терміну придатності.

Умови відпуску.

Без рецепта.

Упаковка.

По 100 мл у флаконі з пластиковою мірною ложечкою на 5 мл в картонній коробці.

Виробник.

Мадрас Фармасьютікалс, Індія

Хайтек Фармасьютікалз Приват Лімітед, Індія

Заявник. Мілі Хелскере Лімітед, Великобританія.

Хай Пойнт

Томас Стріт

Тонтон

Сомерсет TA 2 6NB