

УТВЕРЖДЕНО
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
23.10.2020 № 2417
Регистрационное удостоверение
№ UA/18399/01/01

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного средства

ЭЛЕГИУС
(ELENIUS)

Состав:

действующее вещество: дезлоратадин;

1 мл сиропа содержит 0,5 мг дезлоратадина;

вспомогательные вещества: пропиленгликоль; сорбит (Е 420); кислота лимонная, моногидрат; натрия; натрия бензоат (Е 211); натрия эдетат; сахароза; краситель «Желтый закат FCF»; вода очищенная.

Лекарственная форма. Сироп.

Основные физико-химические свойства: прозрачная жидкость оранжевого цвета.

Фармакотерапевтическая группа. Антигистаминные средства для системного применения.
Код АТХ R06A X27.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Дезлоратадин является мощным селективным блокатором периферических гистаминовых H₁-рецепторов, который не оказывает седативного эффекта. Дезлоратадин - первичный активный метаболит лоратадина.

После перорального приема дезлоратадин селективно блокирует периферические H₁-гистаминовые рецепторы, поскольку препарат почти не проникает через гематоэнцефалический барьер.

Многочисленные исследования показали, что кроме антигистаминной активности дезлоратадин продемонстрировал свои противоаллергические и противовоспалительные свойства. Установлено, что дезлоратадин подавляет каскад различных реакций, лежащих в основе аллергического воспаления, а именно:

- выделение провоспалительных цитокинов, включая ИЛ-4, ИЛ-6, ИЛ-8, ИЛ-13;
- выделение провоспалительных хемокинов, таких как RANTES;
- продуцирование супероксидного аниона активированными полиморфноядерными нейтрофилами;
- адгезию и хемотаксис эозинофилов;
- экспрессию молекул адгезии, таких как Р-селектин;
- IgE-зависимое выделение гистамина, простагландина D₂ и лейкотриена C₄;
- острый аллергический бронхоспазм и аллергический кашель в ходе исследований на животных.

Безопасность применения дезлоратадина детям была продемонстрирована в трех клинических исследованиях. Препарат назначали детям в возрасте от 6 месяцев до 11 лет, которым было необходимо проведение антигистаминной терапии, в суточной дозе 1 мг (возрастная группа от 6 до 11 месяцев), 1,25 мг (возрастная группа от 1 до 5 лет) или 2,5 мг (возрастная группа от 6 до 11 лет). Лечение переносилось хорошо, что было подтверждено

результатами клинических лабораторных исследований, состоянием жизненно важных функций организма и данными ЭКГ (включая длину интервала QT).

Во время клинических исследований ежедневное применение дезлоратадина в дозе до 20 мг в течение 14 дней не сопровождалось статистически клинически значимыми изменениями со стороны сердечно-сосудистой системы. В ходе клинико-фармакологического исследования применения дезлоратадина 45 мг/сут (в 9 раз выше терапевтической дозы) в течение 10 дней не вызвало удлинения интервала QT.

Дезлоратадин почти не проникает через гематоэнцефалический барьер. При применении рекомендуемой дозы 5 мг частота сонливости не превышала таковую в группе плацебо. В ходе клинических исследований дезлоратадин не влиял на психомоторные функции при приеме дозы до 7,5 мг.

Кроме принятого разделения аллергического ринита на сезонный и круглогодичный, по продолжительности симптомов аллергической ринит можно альтернативно классифицировать на интермиттирующий и персистирующий. Интермиттирующий аллергический ринит определяется как наличие симптомов в течение менее 4 дней в неделю или менее 4 недель. В случае персистирующего аллергического ринита симптомы наблюдаются в течение 4 дней или более в неделю или в течение периода, превышающего 4 недели.

Клиническая эффективность дезлоратадина при лечении сезонного аллергического ринита была продемонстрирована в четырех плацебо-контролируемых клинических исследованиях с применением многократных доз.

У пациентов с аллергическим ринитом дезлоратадин эффективно устранял такие симптомы: чихание, выделения из носа и зуд, а также раздражение глаз, слезотечение и покраснение, зуд нёба.

Фармакокинетика.

Дезлоратадин начинает определяться в плазме крови в течение 30 мин после приема препарата. Дезлоратадин эффективно контролирует симптомы в течение 24 часов. Дезлоратадин хорошо всасывается. Максимальная концентрация дезлоратадина в плазме крови достигается в среднем через 3 часа, период полувыведения составляет в среднем 27 часов. Степень кумуляции дезлоратадина соответствует его периоду полувыведения (примерно 27 часов) и кратности применения (1 раз в сутки). Биодоступность дезлоратадина была пропорциональна к дозе в диапазоне от 5 до 20 мг.

Дезлоратадин умеренно (83-87 %) связывается с белками плазмы крови. При применении дезлоратадина в дозе от 5 до 20 мг 1 раз в сутки в течение 14 дней признаков клинически значимой кумуляции препарата не выявлено.

Низкая скорость метаболизма дезлоратадина отмечена в около 8 % субъектов, в которых наблюдалось значительное повышение уровня препарата в плазме крови и удлинение периода полувыведения. Распространенность случаев замедления метаболизма может быть обусловлена расовой принадлежностью. Этот факт считается пока клинически нерелевантным.

При проведении перекрестных сравнительных исследований с одинаковой дозой препарата было обнаружено биоэквивалентность препарата в форме таблеток и сиропа.

При проведении фармакокинетических исследований в педиатрической практике было выявлено, что показатели AUC и C_{max} дезлоратадина (при применении в рекомендованных дозах) могут быть приравнены к таким же показателям у взрослых, принимавших дезлоратадин в форме сиропа в дозе 5 мг.

Результаты исследований показали, что дезлоратадин не угнетает CYP3A4 или CYP2D6 и не является ни субстратом, ни ингибитором P-гликопротеида.

Клинические характеристики.

Показания.

Для устранения симптомов, связанных с аллергическим ринитом, таких как чихание, выделения из носа, зуд, отек и заложенность носа, а также зуд и покраснение глаз, слезотечение, зуд нёба и кашель.

Для устранения симптомов, связанных с крапивницей таких как зуд и высыпание.

Противопоказания.

Повышенная чувствительность к дезлоратадину, к любому вспомогательному компоненту препарата или к лоратадину.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Клинически значимых изменений в плазменной концентрации дезлоратадина при неоднократном совместном применении с кетоконазолом, эритромицином, азитромицином, флюоксетином, циметидином обнаружено 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 дезлоратадина необходимо прекратить примерно за 48 часов до проведения кожных проб, поскольку антигистаминные препараты могут предупреждать возникновение или уменьшать проявления положительных дерматологических реакций на раздражители.

Особенности применения.

В ходе клинико-фармакологических исследований дезлоратадин не усиливал такие эффекты алкоголя: нарушение психомоторной функции и сонливость. Результаты психомоторных тестов существенно не отличались у пациентов, получавших дезлоратадин, и пациентов, принимавших плацебо, отдельно или вместе с алкоголем.

В пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени прием дезлоратадина следует осуществлять под контролем врача. Дезлоратадин следует назначать с осторожностью больным, которые имели приступ судорог в анамнезе. Дети могут быть более чувствительными к развитию нового приступа судорог во время лечения дезлоратадином. Врач должен принять решение о прекращении лечения дезлоратадином пациентов, у которых во время применения препарата наблюдался приступ судорог.

Лекарственное средство содержит сорбит, поэтому его не следует применять пациентам с врожденной непереносимостью фруктозы.

Препарат содержит пропиленгликоль, поэтому может вызвать симптомы, схожие с возникающими при употреблении алкоголя.

В состав лекарственного средства входит сахароза, что может быть вредным для зубов.

Также препарат содержит краситель «Желтый закат FCF», который может вызвать аллергические реакции.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Немало данных применения дезлоратадина в течение беременности (более 1000 случаев) свидетельствуют об отсутствии тератогенного, фетотоксического действия и неблагоприятного воздействия на новорожденного. В ходе исследований на животных не выявлено прямого или косвенного неблагоприятного влияния на репродуктивную функцию. В качестве меры пресечения, желательно избегать применения лекарственного средства Элегиус в течение беременности.

Дезлоратадин проникает в грудное молоко, поэтому женщинам, кормящим грудью, рекомендуется определить, есть ли необходимо прекращения грудного кормления или избежать применения препарата, учитывая преимущества грудного вскармливания для ребенка и пользу от применения лекарственного средства для матери.

Фертильность. Данные о влиянии на фертильность отсутствуют.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Данные клинических исследований свидетельствуют, что дезлоратадин не влияет или оказывает незначительное влияние на способность управлять автотранспортом или другими механизмами. Пациентов следует информировать, что большинство людей не испытывают сонливости. Следует принимать во внимание, что индивидуальная реакция на лекарственные средства может отличаться. Пациентам рекомендуется не заниматься деятельностью, требующей концентрации внимания, такой как управление автомобилем или использования других механизмов, пока они не определили свою реакцию на лекарственное средство.

Способ применения и дозы.

Для устранения симптомов, связанных с аллергическим ринитом (в том числе интермиттирующим и персистирующим) и крапивницей Элегиус принимать независимо от приема пищи в следующих дозах:

взрослые и подростки (≥ 12 лет): 10 мл сиропа (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 возникновения. 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.

Эффективность и безопасность применения дезлоратадина детям до 6 месяцев не установлены. Препарат не рекомендуется назначать детям до 6 месяцев для лечения хронической идиопатической крапивницы и детям до 12 месяцев для лечения аллергического ринита. Для лечения применяется следующий режим дозирования:

- детям в возрасте от 6 до 11 месяцев: по 2 мл сиропа (1 мг дезлоратадина) 1 раз в сутки;
- в возрасте от 1 до 5 лет: по 2,5 мл сиропа (1,25 мг дезлоратадина) 1 раз в сутки;
- в возрасте от 6 до 11 лет: по 5 мл сиропа (2,5 мг дезлоратадина) 1 раз в сутки.

Передозировки.

В случае передозировки следует применять стандартные меры, направленные на удаление неадсорбированного активного вещества, применяется симптоматическое лечение.

При применении дезлоратадина в дозе до 45 мг (что в 9 раз превышает рекомендуемые) в ходе клинических исследований у взрослых и подростков клинически значимых эффектов не наблюдалось.

Дезлоратадин не удаляется путем гемодиализа, возможность его удаления путем перитонеального диализа не установлена.

Побочные реакции.

В ходе клинических исследований по показаниям, включая аллергический ринит и хроническую идиопатическую крапивницу, о нежелательных эффектах у пациентов, получавших дозу 5 мг в сутки, сообщали на 3 % чаще, чем у пациентов, получавших плацебо. Чаще всего, по сравнению с плацебо, сообщали о таких побочных эффектах: утомляемость (1,2 %), сухость во рту (0,8 %) и головная боль (0,6 %). Во время клинических исследований дезлоратадина у детей в возрасте от 2 до 11 лет количество случаев побочных реакций была одинакова как в группе применения сиропа, так и в группе плацебо. У детей возрастом от 6 до 23 месяцев наиболее частыми (по сравнению с плацебо) нежелательными явлениями были диарея (3,7 %), повышение температуры (2,3 %) и бессонница (2,3 %).

Существует риск психомоторной гиперактивности (аномального поведения), связанной с применением дезлоратадина (что может проявляться в виде злости и агрессии, а также возбуждение).

В пострегистрационном периоде наблюдались (частота неизвестна): удлинение интервала QT, аритмии и брадикардии.

Другие побочные эффекты, о которых очень редко сообщали во время постмаркетингового периода, приведены в таблице ниже. Частота появления побочных реакций классифицируется следующим образом: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечастые ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), редкие ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$), редкие ($< 1/10000$) и частота неизвестна.

Классы/системы органов	Частота возникновения	Побочные реакции
Со стороны метаболизма и питания	Частота неизвестна	Повышение аппетита
Со стороны психики	Редкие Частота неизвестна	Галлюцинации Аномальное поведение, агрессия
Со стороны нервной системы	Частые Частые (для детей до 2 лет) Редкие	Головная боль Бессонница Головокружение, сонливость, бессонница, психомоторная гиперактивность, судороги
Со стороны сердца	Редкие	Тахикардия, сердцебиение, удлинение интервала QT, суправентрикулярная тахикардия
Со стороны желудочно-кишечного тракта	Частые Частые (для детей до 2 лет) Редкие	Сухость во рту Диарея Боль в животе, тошнота, рвота, диспепсия, диарея
Со стороны пищеварительной системы	Редкие Частота неизвестна	Увеличение уровня ферментов печени, повышенный билирубин, гепатит Желтуха
Со стороны опорно-мышечной системы и соединительной ткани	Редкие	Миалгия
Со стороны кожи и подкожных тканей	Частота неизвестна	Фоточувствительность
Общие нарушения	Частые Часто (для детей до 2 лет) Редкие Частота неизвестна	Утомляемость Повышение температуры Реакции гиперчувствительности (анафилаксия, отек Квинке, одышка, зуд, сыпь, крапивница) Астения
Исследование	Частота неизвестна	Увеличение массы тела

Дезлоратадин почти не проникает в центральную нервную систему. При применении в рекомендуемой дозе для взрослых, что составляет 5 мг, не отмечали повышение показателя частоты сонливости по сравнению с группой плацебо. В клинических исследованиях дезлоратадин в однократной суточной дозе 7,5 мг не проявлял влияния на психомоторную активность.

Срок годности. 2 года.

Срок годности после вскрытия флакона - 90 суток.

Условия хранения.

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка.

По 60 мл или по 100 мл во флаконах с мерной ложкой, в пачке из картона.

Категория отпуска. Без рецепта.

Производитель / заявитель.

ООО «Тернофарм».

**Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности/
местонахождение заявителя.**

Украина, 46010, г. Тернополь, ул. Фабричная, 4.

Тел./факс: (0352) 521-444, www.ternopharm.com.ua

Дата последнего пересмотра. 23.10.20