

**ІНСТРУКЦІЯ**  
**для медичного застосування препарату**  
**ЕРІУС**  
**(AERIUS )**

**Загальна характеристика:**

**міжнародна та хімічна назви:** desloratadine; 8-хлор-6,11-дигідро-11-(4-піперидиніліден)-5Н-бензо(5,6) циклогептал [1,2,-β]піридин;

**основні фізико-хімічні властивості:** прозора рідина оранжевого кольору;

**склад:** 1 мл сиропу містить 0,5 мг дезлоратадину;

**допоміжні речовини:** пропіленгліколь, сорбітол рідкий, кислота лимонна, натрію цитрату дигідрат, динатрію едетат, натрію бензоат, цукроза, віддушка (№ 15864), барвник жовтий № 6 (Е 110), вода очищена.

**Форма випуску.** Сироп.

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

Код АТС R 06 A X 27.

**Фармакологічні властивості.**

**Фармакодинаміка.** Дезлоратадин є селективним блокатором периферичних гістамінових H<sub>1</sub>-рецепторів, який не спричиняє седативного ефекту. Дезлоратадин – первинний активний метаболіт лоратадину. У доклінічних дослідженнях дезлоратадину і лоратадину якісних чи кількісних розходжень токсичності двох препаратів у порівнюваних дозах (з урахуванням концентрації дезлоратадину) не виявлено.

Після перорального прийому Еріус® селективно блокує периферичні H<sub>1</sub>-гістамінові рецептори і не проникає крізь гематоенцефалічний бар'єр.

Численні дослідження показали, що крім антигістамінної активності Еріус® чинить протиалергічну та протизапальну дію. Встановлено, що Еріус® пригнічує 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 D<sub>2</sub> і лейкотрієну С<sub>4</sub>;
- гострий алергічний бронхоспазм у дослідженнях на тваринах.

Безпека застосування препарату Еріус® у дітей була продемонстрована у 3-х клінічних дослідженнях. Препарат 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).

При клінічних дослідженнях щоденне застосування препарату Еріус® у дозі до 20 мг протягом 14 днів не супроводжувалося статистично клінічно значущими змінами з боку серцево-судинної системи. У клініко-фармакологічному дослідженні застосування Еріусу® по 45 мг/добу (у 9 разів вище терапевтичної дози) протягом 10 днів не спричинило подовження інтервалу QT.

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

**Фармакокінетика.** Дезлоратадин починає визначатися в плазмі протягом 30 хв після прийому. 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.

У дослідженні з одноразовим прийомом дезлоратадину в дозі 7,5 мг було показано, що їжа (жирний висококалорійний сніданок) або грейпфрутовий сік не впливають на розподіл дезлоратадину.

**Показання для застосування.** Для швидкого усунення алергічних симптомів, у тому числі полінозу та алергічного риніту (таких як чхання, виділення з носа, свербіж, набряк і закладеність носа, а також свербіж в очах, слезотеча і почервоніння очей, свербіж у ділянці піднебіння і кашель); для усунення симптомів, пов'язаних із хронічною ідіопатичною кропив'янкою, в тому числі послаблення свербіжу, зменшення розміру та кількості елементів кропив'янки.

**Спосіб застосування та дози.** Окрім загальноприйнятої класифікації алергічного риніту на сезонний та цілорічний його також поділяють на інтермітуючий та персистуючий алергічний риніт, залежно від тривалості симптомів хвороби. Інтермітуючий алергічний риніт – наявність симптомів захворювання протягом менше ніж 4 дні на тиждень або менше ніж 4 тижні. При персистуючому алергічному риніті симптоми спостерігаються протягом 4 або більше днів на тиждень та понад 4 тижні.

Для усунення симптомів, пов'язаних з алергічним ринітом (в тому числі інтермітуючим і персистуючим), та хронічною ідіопатичною кропив'янкою, Еріус® застосовують незалежно від прийому їжі у таких дозах:

*Діти:* - віком від 6 до 11 місяців: по 2,0 мл сиропу (1 мг дезлоратадину) один раз на добу;  
- віком від 1 до 5 років: по 2,5 мл сиропу (1,25 мг дезлоратадину) один раз на добу;  
- віком від 6 до 11 років: по 5,0 мл сиропу (2,5 мг дезлоратадину) один раз на добу.

*Дорослі та підлітки* (≥ 12 років): 10,0 мл сиропу (5,0 мг дезлоратадину) один раз на добу.

Лікування інтермітуючого алергічного риніту проводиться з урахуванням даних анамнезу хвороби пацієнта та може бути припинено після зникнення симптомів та поновлено при їх появі. Безперервне лікування може бути рекомендовано пацієнтам з персистуючим алергічним ринітом протягом періоду контакту з алергеном.

**Побічна дія.** У клінічних дослідженнях при застосуванні препарату Еріус® згідно показань для застосування, включаючи алергічний риніт та хронічну ідіопатичну кропив'янку, у рекомендованій дозі 5 мг/добу частота небажаних явищ була на 3 % вища, ніж у групі плацебо. Найбільш частими (у порівнянні з плацебо) небажаними явищами були підвищена стомлюваність (1,2 %), сухість у роті (0,8 %), головний біль (0,6 %).

Під час клінічних досліджень Еріусу® 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 (у порівнянні з плацебо) небажаними явищами були діарея (3,7 %), пропасниця (2,3 %) і безсоння (2,3 %).

Дуже рідко повідомлялось про реакції гіперчутливості (включаючи анафілаксію та висип), тахікардію, відчуття серцебиття, психомоторну гіперактивність, судоми, підвищення активності печінкових ферментів, підвищення рівня білірубину, розвиток гепатиту.

**Протипоказання.** Підвищена чутливість до активної речовини або будь-якого неактивного компонента препарату.

**Передозування.** У разі передозування застосовуються стандартні заходи, спрямовані на видалення неабсорбованої активної речовини, 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.

**Особливості застосування.** Ефективність і безпека застосування сиропу Еріус® у дітей віком до 6 місяців не встановлена.

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

*Вплив на здатність керувати автомобілем або працювати зі складними механізмами.* Впливу Еріусу® на керування автомобілем або роботу зі складними механізмами не відмічалось.

*Вагітність і годування груддю.* Безпека застосування Еріусу® у вагітних не встановлена, тому не рекомендується застосовувати його під час вагітності.

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

**Взаємодія з іншими лікарськими засобами.** 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.

**Умови та термін зберігання.** Зберігати у недоступному для дітей місці при температурі не вище 30°C. Термін придатності – 2 роки.

**Умови відпуску.** Без рецепта.

**Упаковка.** Флакони по 60 мл або 120 мл, закриті кришечкою із захистом від дітей, у комплекті з мірною ложечкою, у картонній коробці.

**Виробник.** Завод Шерінг-Плау Лабо Н.В., Хейст-оп-ден-Берг, Бельгія, власна філія Шерінг-Плау Корпорейшн, США.

**Адреса.** Шерінг-Плау Лабо Н.В., Індустріепарк 30 B2220, Хейст-оп-ден-Берг, Бельгія.  
Schering-Plough Labo N.V., Industriepark 30 B2220, Heist-op-den-Berg, Belgium (subsidiary of Schering-Plough Corporation, USA).

**Дистриб'ютор.** Шерінг-Плау Сентрал Іст АГ, Люцерн, Швейцарія.