

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ФРІБРІС
FREEBRIS

Загальна характеристика:

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

основні фізико-хімічні властивості: світло-голубі, круглі, двоопуклі, вкриті оболонкою таблетки;

склад: 1 таблетка, вкрита оболонкою містить дезлоратадину 5 мг;

допоміжні речовини: крохмаль, целюлоза мікрокристалічна, магнію стеарат, тальк очищений, кремнію діоксид колоїдний безводний, гідроксиметилпропілцелюлоза, титану діоксид, поліетиленгліколь 6000, барвник „Блискуче синє озеро”.

Форма випуску.

Таблетки, вкриті оболонкою.

Фармакотерапевтична група.

Антигістамінні препарати для системного застосування. Код АТС R06AX27

Фармакологічні властивості.

Дезлоратадин є селективним блокатором периферичних гістамінових H₁-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 небезпечних клітин.

Фармакодинаміка. Після прийому внутрішньо препарат селективно блокує периферичні H₁-гістамінові рецептори і не проникає через гематоенцефалічний бар'єр, що встановлено згідно з результатами дослідження розповсюдження радіоактивних тканин у щурів та зв'язку радіолігандного H₁-рецептору у морських свинок. Завдяки можливості дезлоратадину вступати у зв'язок з гістамінним рецептором вже при концентрації 2-3 нг/мл (7 нмол), він має високу тропність до H₁ рецепторів людини.

Препарат пригнічує ряд цитотоксичних реакцій, що лежать в основі розвитку алергічного запалення, а саме виділення прозапальних цитокинів, у тому числі інтерлейкіна-4 (ІЛ-4), інтерлейкіну-6 (ІЛ-6), інтерлейкіну-8 (ІЛ-8), інтерлейкіну-13 (ІЛ-13), хемокінів типу RANTES, продукцію супероксидного аніону активованого поліморфноядерними нейтрофілами, адгезію і хемотаксис еозинофілів, експресію молекул адгезії, в тому числі Р-селектина, ІgЕ-залежне виділення гістаміну, простагландину D₂ (ПГD₂) і лейкотрієну C₄ (ЛТС₄).

Дослідження на тваринах виявили здатність дезлоратадину усувати гострий алергічний бронхоспазм. У 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 застосування 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 прийому. 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 однократного 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 й гідроксилування 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.

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.

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

Симптоматичне лікування із хронічної ідіопатичної кропив'янки.

Спосіб застосування та дози.

Фрібрис рекомендовано приймати дорослим і підліткам (від 12 років): одна таблетка (5 мг) один раз на добу, незалежно від прийому їжі, запиваючи незначною кількістю води. Таблетку треба ковтати цілою, не розжовуючи. Тривалість лікування не повинна перевищувати 14 діб.

Побічна дія.

За результатами клінічних досліджень, що вивчали призначення препарату при сезонному алергічному риніті і хронічній ідіопатичній кропив'янці, при застосуванні рекомендованої дози 5 мг на день, небажаний ефект при застосуванні дезлоратадину в таблетках спостерігався у 3 % пацієнтів у порівнянні з пацієнтами, які лікувались плацебо. Найбільш поширені побічні ефекти у порівнянні із застосуванням плацебо: втомленість (1,2 %), сухість у роті (0,8 %) і головний біль (0,6 %).

Під час проведення контрольованих і неконтрольованих клінічних досліджень дезлоратадину дуже рідко спостерігались випадки появи реакцій підвищеної чутливості, в тому числі алергічні реакції і висипання на шкірі.

Також дуже рідко спостерігались: тахікардія, серцебиття, збільшення рівня ферментів у печінці, гепатит, збільшення рівня білірубину.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до препарату або до його компонентів. Дитячий вік до 12 років.

Передозування.

У разі передозування слід вжити стандартних заходів для виведення активної речовини що не засвоїлась. Рекомендується проводити симптоматичне та 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 безпе́чність 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. Застосування для дітей: безпе́чність і ефективність застосування дезлоратадину в таблетках для дітей віком до 12 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 °С), у захищеному від світла та недоступному для дітей місці.

Термін придатності-3 роки.

Не рекомендується вживати після закінчення терміну придатності.

Умови відпуску.

Без рецепта.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері у картонній коробці.

Виробник. Unimax Laboratories, India

Заявник. Мілі Хелскере Лімітед, Великобританія.

Хай Пойнт

Томас Стріт

Тонтон

Сомерсет TA2 6NB