

LORDES 2,5 mq/5 ml şərbət
LORDES

Beynəlxalq patentləşdirilməmiş adı: Desloratadine

Tərkibi

Təsiredici maddə: 5 ml Lordes şərbətin tərkibində 2,5 mq dezloratadin vardır.

Köməkçi maddələr: «günəş qürubu» sarısı (E110), natrium benzoat (E211), sorbitol (70 %), saxaroza (rafinə olunmuş şəkər), tutti frutti, propilenglikol (monopropilenglikol), susuz limon turşusu, sodium sitrat (trisodium sitrate dihidrat), natrium edetat (dinatrium EDTA), təmizlənmiş su.

Təsviri

Narıncıl rəngli, xarakterik qoxulu şərbət.

Farmakoterapevtik qrupu

Sistem təsirli antihistaminlər. H1-histamin reseptorlarının antaqonistləri.

ATC kodu: R06AX27

Farmakoloji xüsusiyyətləri

Farmakodinamikası

Təsir mexanizmi

Dezloratadin qeyri-sedativ, uzunmüddətli təsirə malik, selektiv, periferik H1-histamin reseptorlarının antaqonistidir. Dezloratadin peroral qəbuldan sonra mərkəzi sinir sisteminə daxil olmadığından periferik H1-histamin reseptorlarını selektiv olaraq blokada edir.

Dezloratadin *in vitro* tədqiqatlar zamanı antiallergik xüsusiyyətlər nümayiş etdirmişdir. Bura, insan orqanizminin tosqun hüceyrələrindən və bazofillərdən interleykin-4 (IL-4), interleykin-6 (IL-6), interleykin-8 (IL-8) və interleykin-13 (IL-13) kimi iltihab sitokinlərinin inhibə edilməsi və endotel hüceyrələrdə adgeziya molekulu P-selektinin azad olmasını inhibə edilməsi daxildir. Bu tədqiqatların kliniki əhəmiyyəti təsdiq edilmişdir.

Kliniki effektivliyi və təhlükəsizliyi

Pediatrik populyasiya

Dezloratadin şərbətinin effektivliyi ayrıca pediatrik sınaqlarla tədqiq edilməyib. Dezloratadin şərbətinin təhlükəsizliyi üç pediatrik sınaqla nümayiş etdirilmişdir. Antihistamin terapiya üçün namizəd olan 1-11 yaş arası uşaqlara gündəlik 1,25 mq (1-5 yaş arası) və 2,5 mq (6-11 yaş arası) dozada dezloratadinin təyin edilmişdir. Müalicə, klinik laborator testlər, həyat göstəriciləri və QT göstəricisi daxil olan EKQ nəticələrində əks olunduğu kimi, xəstələr tərəfindən yaxşı qəbul edilmişdir. Məsləhət olunan dozada təyin edildikdə, dezloratadinin plazma konsentrasiyası uşaqlarda və böyüklərdə müqayisə olunandır. Bələliklə, allergik rinit/xroniki idiopatik övrə xəstəliyinin müalicə kursu və dezloratadinin təhlükəsizlik profili uşaqlarda və böyüklərdə oxşar olduğu üçün, dezloratadinin böyüklərdə göstərdiyi effektivlik uşaqlara da şamil edilə bilər.

Böyüklər və yeniyetmələr

Dezloratadinin təkrar qəbulu ilə aparılan kliniki tədqiqatlar zamanı, dezloratadini böyüklərə və yeniyetmələrə 14 gün ərzində gündəlik 20 mq dozaya qədər təyin etdikdə statistik və ya klinik əhəmiyyətli kardiovaskulyar təsir müşahidə edilməmişdir. Böyüklər və yeniyetmələr arası aparılan kliniki farmakoloji tədqiqat zamanı dezloratadini 10 gün ərzində gündəlik 45 mq dozada (klinik dozadan 9 dəfə artıq) təyin etdikdə QT intervalının uzanması müşahidə edilməmişdir.

Dezloratadin mərkəzi sinir sisteminə ləng nüfuz edir. Nəzarət edilən kliniki tədqiqatlarda böyüklərə və yeniyetmələrə gündəlik 5 mq dozada təyin edildikdə plasebo ilə müqayisədə yuxululuğun əhəmiyyətli artımı müşahidə edilməmişdir. Kliniki sınaqlar zamanı dezloratadin

tabletini böyüklərə və yeniyetmələrə gündəlik birdəfəyə 7,5 mq dozada təyin edilməsi psixomotor aktivliyə təsir etməmişdir. Böyüklərdə birdəfəlik doza tətqiqatları zamanı, dezloratadinin 5 mq dozada təyini uçuşla əlaqədar fəaliyyətlərə və yuxululuğun şiddətlənməsi kimi halların standart göstəricilərinə təsir etməmişdir.

Allergik riniti olan böyüklər və yeniyetmələrdə dezloratadin asqırma, burun axması və qaşınması, həmçinin, göz qaşınması, yaşarması və qızarması, damağın qaşınması kimi simptomları aradan qaldıraraq 24 saat müddətində effektiv nəzarət edir.

Allergik rinit, qəbul olunmuş klassifikasiyaya uyğun olaraq, simptomların davam etmə müddətinə görə, mövsümi və il boyu davam edən, fasiləli və davamlı allergik rinit kimi əlavə olaraq təsnif oluna bilər. Fasiləli allergik rinitin simptomları həftədə 4 gündən az və ya 4 həftədən az davam edir. Davamlı allergik rinitdə isə simptomlar həftədə 4 gün ərzində və ya ondan çox və 4 həftədən çox davam edir.

Həyat keyfiyyətini qiymətləndirən sorğuda rino-konyuktivitlər zamanı ümumi topladığı nəticə göstərir ki, dezloratadin mövsümi allergik rinitin simptomlarının yüngülləşdirir. Bu simptomlarla əlaqəli gündəlik həyat fəaliyyətinin məhdudlaşması kimi praktik problemin həllində böyük yaxşılaşma nümayiş etdirmişdir.

Xroniki idiopatik övrə klinik model kimi tədqiq edilmişdir, çünki övrə hallarında etiologiyasından asılı olmayaraq xəstəliyin əsasında duran patofiziologiya oxşardır və xroniki xəstələri daha asanlıqla cəlb etmək olar. Klinik protokollar məsləhət verdiyi kimi, övrə xəstəliklərinin baş verməsində əsas faktoru histaminin azad olması durduğundan, dezloratadin xroniki idiopatik övrə də daxil olmaqla bütün övrə hallarında simptomların yüngülləşməsində effektivdir.

İki plasebo nəzarətli, 6 həftəlik tədqiqatlarda xroniki idiopatik övrəli xəstələrdə dezloratadin, müalicənin ilk doza intervalın sonundan etibarən, qaşınmaların yüngülləşməsində, dəridəki qabarıqlıq və qızarıqlıqların ölçülərinin və sayının azalmasında effektiv olmuşdur. Hər iki sınaqda effekt 24 saatdan çox davam etmişdir. Digər antihistamin tədqiqatlarında olduğu kimi xroniki idiopatik övrə xəstəliyində antihistaminlərə cavab verməyən xəstələrin kiçik bir qrupu istisna edilmişdir. Qaşınmaların 50 %-dən çox azalması, dezloratadin qəbul edən xəstələrin 55 %-də, müqayisədə plasebo qəbul edənlərin 19 %-də müşahidə edilmişdir. Dezloratadinlə müalicə yuxunun gündəlik aktivliyinə mənfi təsirini əhəmiyyətli dərəcədə azaldır.

Farmakokinetikası

Sorulma

Böyüklərdə və yeniyetmələrdə dezloratadinin plazma konsentrasiyası qəbuldan 30 dəqiqə ərzində təyin edilə biləcək səviyyəyə gəlir. Dezloratadin yaxşı sorulur, maksimum plazma konsentrasiyası təqribən 3 saat sonra əldə edilir, yarımparçalanmanın terminal fazası 27 saatdır. Dezloratadinin kumulyasiya dərəcəsi yarımparçalanma vaxtına (təqribən 27 saat) və təkrar dozalanma tezliyinə müvafiqdir. Biomənimsənilməsi 5-20 mq doza diapazonuna mütənasibdir.

Bir sıra farmakokinetik və klinik tədqiqatlarda, xəstələrin 6 %-də dezloratadin daha yüksək konsentrasiyasına çatmışdır.

Bu faiz etnik mənsubiyyətindən asılı olaraq dəyişə bilər.

Sağlam könüllülər üzərində təkrar dozalı tədqiqatda tablet formasının istifadəsi zamanı, dörd şəxsə dezloratadinin ləng metabolizm olduğu nümayiş etdirilmişdir. Bu şəxslərdə maksimum dezloratadinin konsentrasiyası C_{max} təqribən 3 dəfə yüksək olmuş və təqribən 7 saatda əldə edilmiş, yarımparçalanmanın terminal fazası isə təqribən 89 saat olmuşdur.

Şərbət formasının istifadəsi ilə keçirilən çox dozalı farmakokinetik tədqiqatlarda allergik rinit diaqnozu qoyulmuş ləng metabolizm olan 2-11 yaş arası pediatrik xəstələrdə eyni farmakokinetik parametrlər müşahidə olunmuşdur. Dezloratadinin AUC göstəricisi 6 dəfə yüksək və C_{max} göstəricisi isə 3-4 dəfə artıq olmuşdur və 3-6 saata əldə edilmişdir, yarımparçalanmanın terminal fazası isə 120 saat olmuşdur. Yaşa uyğun dozalarla müalicə alındıqda təsiri ləng metabolizm olunan uşaqlarda və böyüklərdə eyni olmuşdur. Bu xəstələrin ümumi təhlükəsizlik profili əsas populyasiyada olan göstəricilərdən fərqli olmamışdır.

Dezloratadin şərbət 2 yaştan aşağı ləng metabolizmi olan xəstələrdə tədqiq olunmamışdır.

Paylanma

Plazma zülalları ilə orta dərəcədə birləşir (83 - 87 %). 14 gün ərzində gündəlik birdəfəlik (5-20 mq) doza təyin etdikdə kliniki əhəmiyyətli kumulyasiya halı müşahidə edilməmişdir.

Biotransformasiya

Dezloratadin metabolizmini həyata keçirən ferment hələ müəyyən edilmədiyindən, digər dərman maddələri ilə qarşılıqlı təsiri istisna edilməməlidir. *In vivo* tədqiqatlar zamanı CYP3A4 fermentini, *in vitro* tədqiqatlar zamanı isə CYP2D6-nı inhibə etmədiyi müşahidə edilmişdir, eyni zamanda, P-qlükoprotein substratı və ya blokatoru deyildir.

Eliminasiya

Birdəfəlik doza tədqiqatı zamanı dezloratadin 7,5 mq dozada təyin edildikdə qida qəbulu (yağlı və yüksək kalorili səhər yeməkləri) dezloratadinin paylanmasına təsir etməyib. Başqa bir tədqiqatda isə qreypprut şirəsi dezloratadinin paylanmasına təsir etməmişdir.

Böyrək çatışmazlığı olan xəstələr

Xroniki böyrək çatışmazlığı olan xəstələrdə (XBÇ) dezloratadinin farmakokinetikası sağlam şəxslər ilə tək dozalı və təkrarlanan doza ilə aparılmış tədqiqatda müqayisə olunmuşdur. Tək doza ilə aparılmış tədqiqatda, dezloratadinin konsentrasiyası zəif, orta və ağır dərəcə ilə xroniki böyrək çatışmazlığı olan xəstələrdə təqribən 2-2,5 dəfə artıq olmuşdur, sağlam şəxslərdən müvafiq fərqli olaraq. Təkrarlanan doza ilə aparılmış tədqiqatda, tarazlıq vəziyyəti 11-ci gündə nail olunmuşdur və sağlam şəxslərlə müqayisədə dezloratadinin konsentrasiyası zəif və orta dərəcəli xroniki böyrək çatışmazlığı (XBÇ) olan xəstələrdə 1,5 dəfə və ağır dərəcəli xroniki böyrək çatışmazlığı (XBÇ) olan xəstələrdə 2,5 dəfə artıq olmuşdur. Hər iki tədqiqatda desloratadin və 3-hidroksidesloratadinin ifşa olunmasında (AUC və Cmax) dəyişikliklər klinik cəhətdən müvafiq deyildir.

İstifadəsinə göstərişlər

Lordes böyüklərdə, yeniyetmələrdə və 1 yaşdan yuxarı uşaqlarda

- allergik rinit
- xroniki idiopatik övrə

xəstəliklərin simptomlarını yüngülləşdirməsi üçün təyin edilir.

Əks göstərişlər

Təsiredici maddəyə, tərkibindəki hər hansı köməkçi maddəyə və loratadinə qarşı yüksək həssaslığı olan xəstələrə əks göstərişdir.

Xüsusi göstərişlər və ehtiyat tədbirləri

2 yaşdan kiçik uşaqlarda allergik rinitin digər formalarla differensiasiya aparılması çətinlik törədir. Yuxarı tənəffüs yollarının infeksiyasının və ya struktur dəyişikliklərin olmaması, bununla yanaşı pasiyentin anamnezi və fiziki müayinə, laborator və dəri testlərinin nəticələri nəzərə alınmalıdır.

1 yaşdan kiçik uşaqlarda Lordes şərbətin istifadəsinin təhlükəsizliyi və effektivliyi barədə məlumat yoxdur.

Yaşlılar

Klinik təcrübələr zamanı yaşlılarda və gənclərdə fərqlər qeydə alınmamışdır, bu səbəbdən, doza uyğunlaşdırılmasına ehtiyac yoxdur. Ümumilikdə isə, yaşlılarda qaraciyər, böyrək, ürək funksiyasının zəifliyinə, yanaşı gedən xəstəliklərə və digər dərman müalicəsinə daha tez-tez rast gəlinəndən, doza seçimi zamanı ehtiyatlı olmaq lazımdır.

Böyrək və qaraciyər çatışmazlığı

Böyrək və qaraciyər çatışmazlığı olan xəstələrdə doza uyğunlaşdırılması məsləhətdir.

Saxaroza

Preparatın tərkibində saxaroza və sorbitol var: irsi fruktozaya dözümsüzlüyü, qlükoza-qalaktoza malabsorbsiyası və ya saxaraza-izomaltaza çatışmazlığı olan xəstələr bu preparatı qəbul etməməlidirlər.

Preparatın tərkibində rəngləyici vasitə kimi E110 var ki, bu da allergik reaksiyaya səbəb ola bilər.

Digər dərman vasitələri ilə qarşılıqlı təsiri

Klinik sınaqlar zamanı dezloratadin tabletini eritromisin və ketokonazol ilə birlikdə təyin etdikdə qarşılıqlı klinik əhəmiyyətli təsir müşahidə edilməmişdir.

Klinik farmakoloji tədqiqat zamanı dezloratadin tableti alkoqolla birlikdə təyin edildikdə, alkoqolun zərərli (tormozlayıcı) təsirlərini gücləndirməmişdir. Lakin post-marketing istifadə zamanı alkoqola dözümsüzlük və intoksikasiya halları qeyd olunmuşdur. Buna görə də alkoqolla birlikdə qəbul etdikdə ehtiyatlı olmaq məsləhətdir.

Hamiləlik və laktasiya dövründə istifadəsi

Hamiləlik

Hamiləlik zamanı təhlükəsiz istifadəsi öyrənilmədiyindən, bu dövrdə istifadəsi məsləhət görülmür.

Laktasiya

Müalicə olunan qadınların ana südü ilə qidalandırılan yenidoğulmuş və körpələrdə dezloratadin təyin olunmuşdur. Dezloratadinin yenidoğulmuş/körpələrə təsiri məlum deyil. Ana südü ilə qidalandırmanın dayandırılması və ya dezloratadin ilə müalicənin dayandırılması və ya müalicədən imtina olunması haqqında qərar körpəyə ana südünün faydası və ya anaya müalicənin faydası nəzərdən keçirilərək qərar verilməlidir.

Nəqliyyat vasitələrini və digər potensial təhlükəli mexanizmləri idarəetmə qabiliyyətinə təsiri

Klinik sınaqlar zamanı dezloratadin qəbul edən xəstələrdə sürücülük bacarığına təsiri qeydə alınmamışdır. Buna baxmayaraq, xəstələr, nadir halda olsa da mürgüləməyə səbəb ola biləcəyi, bunun da sürücülük və maşın idarəetmə bacarığına mənfi təsir edə biləcəyi haqqında xəbərdar edilməlidirlər.

Nəzərə alaraq ki, bütün dərman vasitələrinə qarşı individual fərqli cavab müşahidə olunur, xəstələrin dərman vasitəsinə qarşı individual cavabı təyin olunana qədər tövsiyə olunur ki, bütün əqli müdaxilə tələb edən, nəqliyyatın idarə olunması və ya mexanizmlərin istifadəsi kimi işlərlə məşğul olmasınlar.

İstifadə qaydası və dozası

1-5 yaşlı uşaqlar: gündə bir dəfə 2,5 ml (1,25 mq) Lores şərbəti.

6-11 yaşlı uşaqlar: gündə bir dəfə 5 ml (2,5 mq) Lores şərbəti.

Yeniyetmələr və böyüklər (12 yaş və ondan yuxarı): gündə bir dəfə 10 ml (5 mq) Lores şərbəti.

Fasiləli allergik rinit (simptomların mövcudluğu həftədə 4 gündən az və ya 4 həftədən az olduqda) xəstəlik anamnezi dəyərləndirilməsinə uyğun olaraq müalicə olunmalıdır və simptomlar keçdikdən sonra müalicə dayandırılmalıdır və yenidən simptomlar əmələ gəldikdə davam etdirilməlidir.

Davamlı allergik rinit (simptomların həftədə 4 gün və ya daha artıq olması və 4 həftədən artıq olması) allergenin təsiri olan dövrdə müalicə olunması məsləhət görülür.

Əlavə təsirləri

Uşaqlar üzərində aparılan klinik sınaqlar zamanı dezloratadin şərbəti 6 aylıq və 11 yaş arası 246 uşağa təyin edilmişdir. 2-11 yaş arası uşaqlarda əlavə təsirlərin baş verməsi dezloratadin şərbəti və plasebo qruplarında oxşardır. 6-23 aylıq körpələrdə plasebo qrupuna nisbətən daha tez-tez rast gəlinən əlavə təsirlər, diareya (3,7 %), hərarət (2,3 %) və yuxusuzluq (2,3 %) olmuşdur.

12-17 yaş arası olan 578 nəfər yeniyetmə xəstədə aparılan klinik sınaqda ən çox baş verən əlavə təsir baş ağrısı idi: o, desloratadin ilə müalicə edilən xəstələrin 5,9 % -ində və plasebo qəbul edən xəstələrin 6,9 % -ində müşahidə olunmuşdur.

Böyükklər və yeniyetmələrin cəlb olunduğu klinik sınaqlarda, allergik rinit və xroniki idiopatik övrə hallarında məsləhət olunan dozada təyin edildikdə, arzuolunmaz təsirlər plasebo qruplarına nisbətən 3 % daha çox xəstədə qeydə alınmışdır.

Plasebo qrupuna nisbətən daha çox rast gəlinən əlavə təsirlər yorğunluq (1,2 %), ağızda quruluq (0,8 %) və baş ağrısı (0,6 %) olmuşdur.

Post-marketing dövründə nadir hallarda rast gələn arzuolunmaz təsirlər aşağıdakı cədvəldə göstərilmişdir.

Əlavə təsirlərin rastgəlmə tezliyi aşağıdakı kimi təsnif edilmişdir: çox geniş yayılmış ($\geq 1/10$); geniş yayılmış ($\geq 1/100$ -dən $< 1/10$ -a qədər); geniş yayılmamış ($\geq 1/1000$ -dən $< 1/100$ -ə qədər); nadir ($\geq 1/10000$ -dən $< 1/1000$ -ə qədər); çox nadir ($< 1/10000$) və məlum olmayan (mövcud olan məlumatlar əsasında qiymətləndirə bilməz).

Orqanlar sistemi	Baş vermə tezliyi	Əlavə təsirlər
Psixi pozulmalar	Çox nadir hallarda	Hallüsinasiya
Sinir sistemin pozulmaları	Geniş yayılmış Geniş yayılmış (2 yaşdan kiçik uşaqlar) Çox nadir hallarda	Baş ağrısı Yuxusuzluq Başgicəlmə, yuxululuq, yuxusuzluq, psixomotor hiperaktivlik, tutmalar
Kardioloji pozulmaları	Çox nadir hallarda Məlum olmayan	Taxikardiya, ürəkdöymə QT intervalının uzanması
Mədə-bağırsaq pozulmaları	Geniş yayılmış Geniş yayılmış (2 yaşdan kiçik uşaqlar) Çox nadir hallarda	Ağızda quruluq Diareya Qarın ağrısı, ürəkbulanma, qusma, dispepsiya, diareya
Qaraciyər-öd pozulmaları	Çox nadir hallarda Məlum olmayan	Qaraciyər fermentlərinin səviyyəsinin artması, bilirubin səviyyəsinin artması, hepatit Sarılıq
Dəri və dərialtı toxuma pozulmaları	Məlum olmayan	İşığa həssaslıq
Sümük-əzələ və oynaq toxumaları pozulmaları	Çox nadir hallarda	Mialgiya
Ümumi sistem pozulmaları	Geniş yayılmış Geniş yayılmış (2 yaşdan kiçik uşaqlar) Çox nadir hallarda Məlum olmayan	Yorğunluq Hərərət Allergik reaksiyalar(anafilaksiya, angioödem, dispnoye, qaşınma, səpmə və örə kimi) Asteniya

DƏRMAN QƏBULU ZAMANI GÖZLƏNİLMƏZ ƏLAVƏ TƏSİRLƏR YARANDIQDA HƏKİMİNİZƏ MÜRACİƏT EDİN!

Doza həddinin aşılması

Post-marketing istifadə zamanı doza həddini aşanda yaranan əlavə təsirlər profili terapeutik dozalarda olduğu kimi eynidir, lakin ağırlıq dərəcəsi daha yüksək ola bilər.

Müalicə

Yüksək dozalanma zamanı aktiv substansiyanın sorulmayan hissəsi orqanizmdən kənarlaşdırılır. Simptomatik və köməkçi müalicə təyin edilməsi məsləhətdir.

Dezloratadin hemodializ vasitəsilə eliminasiya edilmir; peritoneal dializ vasitəsilə eliminasiya edilməsi haqda məlumat yoxdur.

Simptomlar

Təkrar dozalanmaya əsaslanan kliniki sınaqlar zamanı dezloratadin 45 mq dozada (klinik doza 9 dəfə təyin edilir) təyin edildikdə klinik əhəmiyyətli effektlər müşahidə edilməmişdir.

Buraxılış forması

Lordes 2,5 mq/5 ml şərbət plastik qapaqlı kəhrəba rəngli 150 ml-lik şüşə flakonda, 5 ml plastik qaşığı və içlik vərəqə ilə birlikdə karton qutuya qablaşdırılır.

Digər buraxılış forması

Lordes 5 mq örtüklü tablet: şəffaf PVX/PE/PV DX - alüminium folqalı blisterlərdə 20 və ya 30 tablet yerləşdirilir.

Saxlanma şəraiti

25 °C-dən aşağı temperaturda qaranlıq və uşaqların əli çatmayan yerdə öz qutusunda saxlamaq lazımdır.

Yararlılıq müddəti

2 il.

Yararlılıq müddəti bitdikdən sonra istifadə etmək olmaz.

Aptekdən buraxılma şərti

Resept ilə buraxılır.

İstehsalçı

NOBEL İLAÇ SANAYİİ VE TİCARET A.Ş.
Sancaklar 81100 Düzce/Türkiye

Lisənziya sahibi

NOBEL İLAÇ SANAYİİ VE TİCARET A.Ş.
Ümraniye 34768 İstanbul/Türkiye