

LORDES 5 mq örtüklü tabletlər
LORDES

Beynəlxalq patentləşdirilməmiş adı: Desloratadine

Tərkibi

Təsiredici maddə: 1 örtüklü tabletin tərkibində 5 mq dezloratadin vardır.

Köməkçi maddələr: kalsium hidrogen fosfat dihidrat (dikalsium fosfat dihidrat), mikrokristallik sellüloza PH 102, qarğıdalı nişastasası, talk.

Örtük: № 14 Opadry II Blue 85F20578 (polivinil spirti, polietilenqlikol, titan dioksidi (E171), talk (E553b), indiqokarmin alüminium lakı (E132), sarı dəmir oksidi (E172)).

Təsviri

Dairəvi, göy rəngli, bir tərəfində Nobel emblemi həkk olunmuş örtüklü tabletlərdir.

Farmakoterapevtik qrupu

Antihistaminlər. H1-histamin reseptorlarının antaqonisti.

ATC kodu: R06AX27.

Farmakoloji xüsusiyyətləri

Farmakodinamikası

Təsir mexanizmi

Dezloratadin qeyri-sedativ, uzunmüddətli təsirə malik, periferik H1-histamin reseptorlarının selektiv blokatorudur. Peroral qəbuldan sonra mərkəzi sinir sisteminə daxil olmadığından periferik H1-histamin reseptorlarını selektiv olaraq blokadaya alır.

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

Klinik effektivliyi və təhlükəsizliyi

Dezloratadinin təkrar qəbulu ilə aparılan klinik tədqiqatlar zamanı, dezloratadini 14 gün ərzində gündəlik 20 mq dozaya qədər təyin etdikdə statistik və ya klinik əhəmiyyətli kardiovaskulyar təsir müşahidə edilməmişdir. Klinik farmakoloji tədqiqatlar zamanı dezloratadini böyüklərə 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 klinik tədqiqatlarda gündəlik 5 mq dozada təyin edildikdə plasebo ilə müqayisədə yuxululuğun əhəmiyyətli artımı müşahidə edilməmişdir. Klinik sınaqlar zamanı dezloratadin tabletini gündəlik birdəfəyə 7,5 mq dozada təyin edilməsi psixomotor aktivliyə təsir etməmişdir. Böyüklərdə birdəfəlik doza tədqiqatları zamanı, dezloratadinin 5 mq dozada təyini uçuşla əlaqədar fəaliyyətlərə və yuxululuğun şiddətlənməsi kimi halların standart göstəricilərinə təsir etməmişdir.

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

Pediatrik populyasiya

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 simptomlarını 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 xəstələrin antihistaminlərə cavab verməyən kiçik bir qrup istisna edilmişdir. Qaşınmaların 50 %-dən çox azalması, dezloratadin qəbul edən xəstələrin 55 %-də, plasebo qəbul edənlərin 19 %-də müşahidə edilmişdir. Dezloratadinlə müalicə yuxunun gündəlik aktivliyinə mənfi təsirini əhəmiyyətli dərəcədə azaldır.

Farmakokinetikası

Sorulması

Böyüklərdə və yeniyetmələrdə dezloratadinin plazma konsentrasiyası qəbuldan sonrakı 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.

Ümumi mövsümi allergik riniti olan əhalidə demoqrafik olaraq müqayisəli farmakokinetik tədqiqatı zamanı xəstələrin 4 %-də dezloratadinin yüksək konsentrasiyası yaranmışdır. Bu faiz etnik mənsubiyyətindən asılı olaraq dəyişə bilər. Maksimum dezloratadin konsentrasiyası təqribən 7 saatda əldə edilmiş və 3 dəfə yüksək olmuş, yarımparçalanmanın terminal fazası isə təqribən 89 saat olmuşdur. Təhlükəsizlik profili ümumi əhalidən fərqli deyil.

Paylanması

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

Biotransformasiyası

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 blokada etmədiyi müşahidə edilmişdir, eyni zamanda, P-qlükoprotein substratı və ya blokatoru deyildir.

Eliminasiyası

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

Böyrək çatışmazlığı olan xəstələr

Xroniki böyrək çatışmazlığı (XBC) olan xəstələrdə dezloratadinin farmakokinetikası sağlam şəxslər ilə birdəfəlik və təkrarlanan dozalar ilə aparılmış tədqiqatda müqayisə olunmuşdur. Birdəfəlik doza ilə aparılmış tədqiqatda, dezloratadinin konsentrasiyası zəif, orta və ağır dərəcə xroniki böyrək çatışmazlığı olan xəstələrdə təxminən sağlam şəxslərdən müvafiq olaraq 2-2,5 dəfə artıq olmuşdur. Təkrarlanan doza ilə aparılmış tədqiqatda, tarazlıq vəziyyətinə 11-ci gündən sonra nail olunmuşdur və sağlam şəxslərlə müqayisədə dezloratadinin konsentrasiyası zəif və orta dərəcəli xroniki böyrək çatışmazlığı (XBC) olan xəstələrdə 1,5 dəfə və ağır dərəcəli xroniki

böyrək çatışmazlığı (XBC) olan xəstələrdə isə 2,5 dəfə artıq olmuşdur. Hər iki tədqiqatda dezloratadin və 3-hidroksidezloratadinin ifşa olunmasında (AUC və C_{max}) dəyişiklər klinik cəhətdən müvafiq deyildir.

İstifadəsinə göstərişlər

Lordes böyüklərdə, yeniyetmələrdə və 1 yaşdan yuxarı uşaqlarda

- allergik rinit

- xroniki idiopatik övrə

xəstəliklərin simptomlarını yüngülləşdirmək 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

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 gəlindiyindən, doza seçimi zamanı ehtiyatlı olmaq lazımdır.

Böyrək və qaraciyər çatışmazlığı

Böyrək və qaraciyər çatışmazlığı olan xəstələrdə doza uyğunlaşdırılması məsləhətdir.

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 körpələrə dezloratadin təyin olunmuşdur. Dezloratadinin yenidoğulmuşlara/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 maşınları idarə və istifadə etmək qabiliyyətinə heç bir əhəmiyyətli təsiri qeydə alınmamışdır. Xəstələrə məlumat verilməlidir ki, insanların əksəriyyətində yuxululuq müşahidə olunmur.

Nəzərə alaraq ki, bütün dərman vasitələrinə qarşı individual fərqli cavab müşahidə olunur, dərman vasitəsinə qarşı individual cavabı təyin olunana qədər əqli müdaxilə tələb edən nəqliyyatın idarə etməsi və ya digər potensial təhlükəli mexanizmlərin istifadəsi tövsiyə olunmur.

İstifadə qaydası və dozası

Yeniyyətələr və böyükklər (12 yaş və ondan yuxarı)

Gündə 1 dəfə 1 tablet qida qəbulundan asılı olmayaraq məsləhət olunur, allergik rinit (mövsümi və davamlı allergik rinit daxil olmaqla) və övrə simptomların yüngülləşməsi üçün.

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.

Böyrək və qaraciyər çatışmazlığı olan xəstələr

Böyrək və qaraciyər çatışmazlığı olan böyük xəstələrdə başlanğıc doza 5 mq sonrakı günlərdə farmakokinetik göstəricilərə əsaslanaraq uyğunlaşdırılır.

Əlavə təsirləri

Klinik sınaqlar zamanı, allergik rinit və xroniki idiopatik övrə hallarında gündəlik 5 mq dozada təyin edildikdə, arzuolunmaz təsirlər dezloratadin qrupunda plasebo qruplarına nisbətən 3 %-dən 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.

Pediatrik populyasiya

12-17 yaş arası, 578 yeniyyətənin cəlb olunduğu klinik sınaqlar zamanı ən çox rast gəlinən əlavə təsiri baş ağrısı olmuşdur; dezloratadin müalicəsi alan xəstələrin 5,9 %-də və plasebo qəbul edənlərin 6,9 %-də baş vermişdir.

Post-marketing dövründə nadir hallarda rast gəlinən digər 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 qiymətləndirmək mümkün deyil).

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 İshal Qarın ağrısı, ürəkbulanma, qusma, dispepsiya, ishal
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 təsirlərin profili terapevtik dozalarda olduğu kimi eynidir, lakin ağırlıq dərəcəsi daha yüksək ola bilər.

Müalicə

Doza həddinin aşılması 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 klinik sınaqlar zamanı dezloratadin 45 mq dozada (klinik dozadan 9 dəfə artıq) təyin edildikdə klinik əhəmiyyətli effektlər müşahidə edilməmişdir.

Buraxılış forması

Lordes 5 mq örtüklü tabletlər, 10 tablet şəffaf PVX/PE/PV DX - alüminium folqa blisterdə; 2 blister (20 tablet) və ya 3 blister (30 tablet) içlik vərəqə ilə birlikdə karton qutuya qablaşdırılır.

Digər buraxılış forması

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

Saxlanma şəraiti

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

Yararlılıq müddəti

2 il.

Yararlılıq müddəti bitdikdən sonra istifadə etmək olmaz.

Aptekdən buraxılma şərti

Resepsiz 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.