ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ЛОРИЗАН[â]

(LORIZAN)

Склад:

діюча речовина: лоратадин;

1 таблетка містить лоратадину 10 мг;

допоміжні речовини: лактоза, моногідрат; крохмаль картопляний; кальцію стеарат.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого кольору з плоскою поверхнею, з фаскою.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні засоби для системного застосування.

Код АТХ R06A X13.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Лоратадин – трициклічний антигістамінний засіб із селективною активністю відносно периферичних H_1-рецепторів.

У більшості пацієнтів при застосуванні в рекомендованій дозі лоратадин не чинить клінічно значущої седативної та антихолінергічної дії. Упродовж тривалого лікування не спостерігалось клінічно значущих змін у показниках життєво важливих функцій організму, результатах лабораторних досліджень, фізикального обстеження або електрокардіограми. Лоратадин не має значущого впливу на H_2-гістамінові рецептори. Лікарський засіб не інгібує поглинання норепінефрину та фактично не впливає на функцію серцево-судинної системи або на активність водія ритму серця.

Дослідження з проведенням шкірних проб на гістамін після застосування разової дози 10 мг показали, що антигістамінний ефект виникає через 1–3 години, досягає піку через 8–12 годин і триває більше 24 годин. Не відзначалося розвитку стійкості до дії препарату після 28 днів застосування лоратадину.

Клінічна ефективність і безпека.

Більше 10000 чоловік (у віці від 12 років) отримували лікування лоратадином (таблетки по 10 мг) у контрольованих клінічних дослідженнях. Лоратадин (таблетки) в дозі 10 мг 1 раз на добу був ефективнішим, ніж плацебо, і таким же ефективним, як клемастин, відносно покращення стану при симптомах (назальних і не назальних) алергічного риніту. У цих дослідженнях сонливість виникала з меншою частотою при застосуванні лоратадину, ніж клемастину, і практично з такою ж частотою, як і при застосуванні терфенадину та плацебо.

Із учасників цих досліджень (у віці від 12 років) 1000 пацієнтів із хронічною ідіопатичною кропив'янкою були зареєстровані у плацебо-контрольованих дослідженнях. Лоратадин у дозі 10 мг 1 раз на добу був ефективнішим за плацебо у лікуванні хронічної ідіопатичної кропив'янки, що підтверджується послабленням свербежу, еритеми та алергічного висипання. У цих дослідженнях частота сонливості була подібною при застосуванні лоратадину та плацебо.

Діти.

Близько 200 дітей (у віці від 6 до 12 років) із сезонним алергічним ринітом отримували лоратидин (сироп) у дозах до 10 мг 1 раз на добу в контрольованих клінічних дослідженнях. В іншому дослідженні 60 дітей (у віці від 2 до 5 років) отримували лоратадин (сироп) у дозі 5 мг 1 раз на добу. Непередбачені побічні реакції не спостерігались.

Ефективність у дітей була подібною ефективності у дорослих.

Фармакокінетика.

Всмоктування. Лоратадин швидко і добре всмоктується. Застосування препарату під час їжі може дещо затримувати всмоктування лоратадину, проте це не впливає на клінічний ефект. Показники біодоступності лоратадину та його активного метаболіта пропорційні до дози.

Розподіл. Лоратадин зв'язується активно (від 97 % до 99 %) з білками плазми крові, а його активний метаболіт – з помірною активністю (від 73 % до 76 %).

У здорових добровольців період напіврозподілу лоратадину та його активного метаболіта у плазмі крові становить приблизно 1 та 2 години відповідно.

Біотрансформація. Після перорального застосування лоратадин швидко і добре абсорбується, а також екстенсивно метаболізується при першому проходженні через печінку, головним чином за допомогою CYP3A4 і CYP2D6. Основний метаболіт дезлоратадин є фармакологічно активним і більшою мірою відповідає за клінічний ефект. Лоратадин і дезлоратадин досягають максимальної концентрації у плазмі крові (T_{max}) через 1-1,5 години і 1,5-3,7 години відповідно після застосування препарату.

Виведення. Приблизно 40 % дози виводиться із сечею і 42 % з калом упродовж 10 днів, в основному у формі кон'югованих метаболітів. Приблизно 27 % дози виводиться із сечею упродовж перших 24 годин. Менше 1 % діючої речовини виводиться у незміненій активній формі – як лоратадин або дезлоратадин.

У дорослих здорових добровольців середній період напіввиведення лоратадину становив 8,4 години (діапазон від 3 до 20 годин), а основного активного метаболіта – 28 годин (діапазон від 8,8 до 92 годин).

Порушення функції нирок. У пацієнтів із хронічним порушенням функції нирок підвищувалися показники AUC і максимальної концентрації у плазмі крові (C_{max}) лоратадину і його активного метаболіта порівняно з такими показниками у пацієнтів із нормальною функцією нирок. Середній період напіввиведення лоратадину і його активного метаболіта не відрізнявся значною мірою від показників у здорових людей. У пацієнтів із хронічним порушенням функції печінки гемодіаліз не впливає на фармакокінетику лоратадину і його активного метаболіта.

Порушення функції печінки. У пацієнтів із хронічним алкогольним ураженням печінки показники AUC і C_{max} лоратадину були в два рази вищими, а їх активного метаболіту не змінювалися істотно при порівнянні з такими показниками у пацієнтів із нормальною функцією печінки. Період напіввиведення лоратадину і його активного метаболіта становить 24 і 37 годин відповідно і збільшується залежно від тяжкості захворювання печінки.

Пацієнти літнього віку. Показники фармакокінетики лоратадину і його активного метаболіту були аналогічними у здорових дорослих добровольців і здорових добровольців літнього віку.

Клінічні характеристики.

Показання.

Симптоматичне лікування алергічного риніту та хронічної ідіопатичної кропив’янки.

Протипоказання.

Лоризан® протипоказаний пацієнтам із підвищеною чутливістю до активної речовини або до будь-якого іншого компонента препарату.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

При застосуванні одночасно з алкоголем ефекти препарату не посилюються, що підтверджено дослідженнями психомоторної функції.

Потенційна взаємодія може мати місце при застосуванні всіх відомих інгібіторів CYP3A4 або CYP2D6, що призводить до підвищення рівнів лоратадину, а це у свою чергу може бути причиною підвищення частоти виникнення побічних реакцій.

Відомо про підвищення концентрацій лоратадину у плазмі крові після одночасного застосування з кетоконазолом, еритроміцином і циметидином, що не супроводжувалося клінічно значущими змінами (у тому числі на ЕКГ).

Діти. Дослідження взаємодій з іншими препаратами проводили тільки з участю дорослих пацієнтів.

Особливості застосування.

Лоризан® слід з обережністю застосовувати пацієнтам із тяжкою формою порушення функції

печінки.

До складу препарату входить лактоза. З цієї причини пацієнтам з такими рідкісними спадковими захворюваннями як непереносимість галактози, дефіцит лактази Лаппа і мальабсорбція глюкози-галактози не слід застосовувати даний препарат.

Застосування препарату Лоризан® необхідно припинити як мінімум за 48 годин перед проведенням шкірних тестів, оскільки антигістамінні засоби можуть нейтралізувати або іншим чином послабляти позитивну реакцію при визначенні індексу реактивності шкіри.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність. Значна кількість даних застосування протягом вагітності (більше 1000 результатів) свідчать, що лоратадин не спричиняє вад розвитку та нетоксичний для плода і новонародженого. Дослідження на тваринах не виявили прямих або непрямих негативних ефектів, що стосуються репродуктивної токсичності. Бажано, як захід безпеки, уникати застосування препарату лоратадину у період вагітності.

Годування груддю. Фізико-хімічні дані свідчать про виведення лоратадину/метаболітів із грудним молоком. Оскільки ризик для дитини не може бути виключений, препарат лоратадину не слід застосовувати в період годування груддю.

Фертильність. Дані щодо впливу лікарського засобу на жіночу або чоловічу фертильність відсутні.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

В клінічних дослідженнях, що вивчали здатність керувати автомобілем, у хворих, що застосовували лоратадин, жодних змін не спостерігалося. Лоратадин не впливає або впливає незначним чином на здатність керувати автотранспортом або іншими механізмами. Проте пацієнта необхідно попередити, що дуже рідко повідомлялося про сонливість, що може впливати на здатність керувати автотранспортом або іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Спосіб застосування.

Перорально. Таблетки можна застосовувати незалежно від прийому їжі.

Дозування.

Дорослі та діти віком від 12 років слід приймати по 1 таблетці (10 мг лоратадину) 1 раз на добу.

Для дітей віком від 2 до 12 років дозування залежить від маси тіла. При масі тіла більше 30 кг: 10 мг (1 таблетка) 1 раз на добу. Дітям з масою тіла менше 30 кг застосовувати препарат у вигляді сиропу.

Пацієнти літнього віку.

Не вимагається корекції дозування людям літнього віку.

Пацієнти з порушенням функції печінки.

Пацієнтам з порушеннями функцій печінки тяжкого ступеню слід призначати препарат у нижчій початковій дозі, оскільки в них можливе зниження кліренсу лоратадину. Для дорослих і дітей із масою тіла більше 30 кг рекомендована початкова доза становить 10 мг через день.

Пацієнти з порушенням функції нирок.

Немає необхідності в корекції дози для пацієнтів з порушенням функції нирок.

Діти. Ефективність та безпека застосування лоратадину дітям віком до 2 років не встановлені. Препарат у вигляді таблеток призначати дітям з масою тіла більше 30 кг.

Передозування.

Передозування лоратадину підвищує частоту виникнення антихолінергічних симптомів. При передозуванні повідомляли про сонливість, тахікардію і головний біль. У разі передозування рекомендовано симптоматичне та підтримуюче лікування упродовж необхідного періоду часу. Можливе застосування активованого вугілля у вигляді водної суспензії. Також можна провести промивання шлунка. Лоратадин не виводиться з організму при проведенні гемодіалізу; ефективність перитонеального діалізу у виведенні препарату невідома. Після невідкладної допомоги пацієнт має залишитися під медичним наглядом.

Побічні реакції.

Коротка характеристика профілю безпеки. У клінічних дослідженнях з участю дорослих і підлітків при застосуванні лоратадину в рекомендованій дозі 10 мг на добу при показаннях, що включають алергічний риніт і хронічну ідіопатичну кропив’янку, про побічні реакції повідомлялося у 2 % пацієнтів (що перевищує показник у пацієнтів, які отримували плацебо). Частішими побічними реакціями у порівнянні з групою плацебо були: сонливість (1,2 %), головний біль (0,6 %), посилення апетиту (0,5 %) і безсоння (0,1 %). У клінічних дослідженнях у дітей віком від 2 до 12 років відзначалися такі небажані явища, як головний біль (2,7 %), нервозність (2,3 %) або втома (1 %).

Перелік побічних реакцій. Побічні реакції, про які повідомлялося в ході постмаркетингового періоду, вказані нижче за класами систем органів. Частота визначена як: дуже часті (≥1/10), часті (від ≥1/100 до <1/10), нечасті (від ≥1/1 000 до <1/100), поодинокі випадки (від ≥1/10 000 до <1/1 000), рідкісні випадки (<1/10 000) і частота невідома (неможливо встановити за наявними даними).

У кожній групі частоти побічні реакції вказані в порядку зниження серйозності.

З боку імунної системи: рідкісні випадки – реакції гіперчутливості, включаючи анафілаксію та

ангіоневротичний набряк.

З боку нервової системи: рідкісні випадки – запаморочення, судоми.

З боку серця: рідкісні випадки – тахікардія, пальпітація.

З боку ШКТ: рідкісні випадки – нудота, сухість у роті, гастрит.

З боку гепатобіліарної системи: рідкісні випадки – патологічні зміни функції печінки.

З боку шкіри і підшкірної клітковини: рідкісні випадки – висипання, алопеція.

Загальні розлади: рідкісні випадки – втома.

Дослідження: частота невідома – збільшення маси тіла.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 ºС у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері, 1 блістер у пачці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Виробник. ПАТ «Київмедпрепарат».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

01032, Україна, м. Київ, вул. Саксаганського, 139.

Дата останнього перегляду.