

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

ЛОРАТАДИН
(LORATADIN)

Склад:

діюча речовина: лоратадин;

1 мл сиропу містить лоратадину 1 мг;

допоміжні речовини: пропіленгліколь; сахарин натрію; гліцерин; кислота лимонна, моногідрат; сорбіту розчин, що не кристалізується (містить Е 420); метилпарагідроксибензоат (Е 218); пропілпарагідроксибензоат (Е 216); ароматизатор «Суниця лісова» (містить: понсо 4 R (Е 124), азорубін Е 122)); вода очищена.

Лікарська форма. Сироп.

Основні фізико-хімічні властивості: прозора сиропоподібна рідина яскраво-червоного кольору з характерним запахом, кисло-солодкого смаку.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні засоби для системного застосування.

Код АТХ R06A X13.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

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

При застосуванні у рекомендованій дозі не чинить клінічно значущої седативної та антихолінергічної дії. Протягом тривалого лікування не було виявлено жодних клінічно значущих змін у показниках життєво важливих функцій, у лабораторних дослідженнях, у даних фізикального обстеження хворого або в електрокардіограмі. Лоратадин не має значущого впливу на активність H_2 -гістамінових рецепторів. Не блокує захоплення норепінефрину та фактично не впливає на серцево-судинну систему або на активність водія ритму.

Після разового прийому препарату (10 мг) на підставі проведених шкірних проб на гістамін з'ясовано, що антигістамінна дія клінічно помітна через 1-3 години, досягає пікового значення

в інтервалі від 8 до 12 годин з моменту початку дії і триває 24 години. Не відзначалося розвитку стійкості при прийомі препарату протягом 28 днів.

Фармакокінетика.

Всмоктування. Після перорального прийому лоратадин швидко та добре всмоктується. Вживання їжі незначно подовжує період всмоктування лоратадину, але не впливає на клінічний ефект. Біодоступність лоратадину та дезлоратадину прямопропорційна 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 %). Період напіввиведення лоратадину та його активного метаболіту з плазми у здорових добровольців становить приблизно 1 та 2 години після застосування відповідно.

Біотрансформація. Після перорального прийому лоратадин швидко і добре всмоктується та метаболізується під впливом CYP3A4 та CYP2D6, головним чином у дезлоратадин. Основний метаболіт дезлоратадин є фармакологічно активним і більшою мірою відповідає за клінічний ефект. Час досягнення максимальної концентрації лоратадину та дезлоратадину у плазмі крові становить 1-1,5 години та 1,5-3,7 години відповідно.

Виведення. Приблизно 40 % введеної дози виводиться із сечею і 42 % – з калом впродовж 10 днів, головним чином, у формі кон'югованих метаболітів. Приблизно 27 % введеної дози виводиться із сечею за перші 24 години. Менше 1 % діючої речовини виводиться у незмінній активній формі – як лоратадин, так і дезлоратадин.

Середній кінцевий період напіввиведення у здорових дорослих добровольців – 8,4 години (діапазон – від 3 до 20 годин) для лоратадину і 28 годин (діапазон – від 8,8 до 92 годин) – для його основного активного метаболіту.

Порушення функції нирок. У хворих із порушеннями функції нирок площа під кривою «концентрація-час» (AUC) і максимальна концентрація у плазмі крові (C_{max}) лоратадину та його активного метаболіту були вищими, ніж відповідні показники у пацієнтів з нормальною функцією нирок. Середній період напіввиведення лоратадину і його активного метаболіту не відрізнявся значною мірою від показників у здорових добровольців. У пацієнтів із хронічними порушеннями функції нирок гемодіаліз не впливає на фармакокінетику лоратадину і його активного метаболіту.

Порушення функції печінки. У хворих із хронічним алкогольним ураженням печінки показники AUC і C_{max} лоратадину були у два рази вищими, а відповідні показники їх активного метаболіту не змінювалися істотно при порівнянні з такими показниками у пацієнтів із нормальною функцією печінки. Період напіввиведення лоратадину і його активного метаболіту 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, у т.ч. і літнього віку.

Клінічні характеристики.

Показання.

Симптоматичне лікування алергічного риніту та хронічної ідіопатичної кропив'янки.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до лоратадину або до інших компонентів препарату.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Лоратадин не посилює пригнічувальну дію алкоголю на психомоторні реакції.

Одночасне застосування лоратадину з інгібіторами CYP3A4 або CYP2D6 може призводити до підвищення рівня лоратадину, що, зі свого боку, посилює побічні ефекти.

При одночасному застосуванні препарату з кетоконазолом, еритроміцином, циметидином відзначалося підвищення концентрації лоратадину у плазмі крові, але це підвищення ніяк не проявлялося клінічно, у тому числі за даними електрокардіограми.

Діти.

Дослідження взаємодії з іншими лікарськими засобами проводилися тільки з участю дорослих пацієнтів.

Особливості застосування.

Лоратадин слід з обережністю застосовувати пацієнтам із тяжкими порушеннями функції печінки.

Якщо встановлена непереносимість деяких цукрів, необхідно проконсультуватися з лікарем, перш ніж приймати цей лікарський засіб.

Прийом препарату необхідно припинити не пізніше ніж за 48 годин до проведення шкірних діагностичних алергопроб для запобігання хибним результатам.

Лоратадин містить азобарвник (азорубін та понсо 4 R) та метилпарагідроксибензоат, пропілпарагідроксибензоат, які можуть спричинити алергічні реакції (можливо, уповільнені).

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність. Даних про застосування лоратадину вагітними жінками дуже мало. Бажано, як захід безпеки, уникати застосування препарату Лоратадин 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 Лоратадин не слід застосовувати у період годування груддю.

Фертильність. Дані щодо впливу препарату на жіночу або чоловічу фертильність відсутні.

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

Лоратадин не впливає або впливає незначним чином на здатність керувати автотранспортом або іншими механізмами. Проте пацієнтові необхідно повідомити, що дуже рідко повідомляли про сонливість, що може впливати на здатність керувати автотранспортом або працювати з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Спосіб застосування.

Застосовувати перорально. Сироп можна застосовувати незалежно від вживання їжі.

Дозування.

Дорослим та дітям віком від 12 років приймати по 10 мл сиропу (10 мг лоратадину) 1 раз на добу.

Дози для дітей віком від 2 до 12 років залежать від їх маси тіла.

Дітям з масою тіла більше 30 кг – 10 мл сиропу (10 мг лоратадину) 1 раз на добу.

Дітям з масою тіла до 30 кг – 5 мл сиропу (5 мг лоратадину) 1 раз на добу.

Пацієнти літнього віку.

Не вимагає корекції дозування людям літнього віку.

Пацієнти із порушеннями функції печінки.

Пацієнтам із порушенням функції печінки тяжкого ступеня слід призначати препарат у нижчій початковій дозі, оскільки можливе зменшення кліренсу лоратадину. Для дорослих і дітей з масою тіла більше 30 кг рекомендована початкова доза становить 10 мг через день, а для дітей з масою тіла до 30 кг – 5 мг через день.

Пацієнти із порушеннями функції нирок.

Немає необхідності в корекції дози для пацієнтів із порушеннями функції нирок.

Діти.

Ефективність та безпека застосування препарату дітям віком до 2 років не встановлені.

Передозування.

При передозуванні відзначалися антихолінергічні симптоми: сонливість, тахікардія та головний біль. При передозуванні рекомендоване симптоматичне та підтримуюче лікування

упродовж необхідного періоду часу. Рекомендуються стандартні заходи щодо видалення препарату, який не всмоктався зі шлунка: промивання шлунка, застосування подрібненого активованого вугілля з водою.

Лоратадин не виводиться шляхом гемодіалізу, також невідомо, чи виводиться лоратадин шляхом перитонеального діалізу.

Після невідкладної допомоги пацієнт повинен залишатися під медичним наглядом.

Побічні реакції.

У дітей віком від 2 до 12 років відзначалися такі небажані явища як головний біль, нервозність або підвищена втомлюваність.

У дорослих та дітей віком від 12 років відзначалися сонливість, головний біль, підвищений апетит та безсоння.

Частота побічних реакцій визначалася таким чином: дуже часті ($\geq 1/10$), часті (від $\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечасті (від $\geq 1/1000$ до $< 1/100$), поодинокі випадки ($\geq 1/10000$ до $< 1/1000$), рідкісні випадки ($< 1/10000$) і частота невідома (неможливо встановити за наявними даними).

У кожній групі побічні реакції вказані у порядку зниження серйозності.

Класи/системи органів	Частота	Побічні ефекти
Імунна система	рідкісні випадки	анафілаксія, включаючи ангіоедему
Нервова система	рідкісні випадки	запаморочення, судоми
Серцево-судинна система	рідкісні випадки	тахікардія, відчуття серцебиття
Шлунково-кишковий тракт	рідкісні випадки	нудота, сухість у роті, гастрит
Гепатобіліарна система	рідкісні випадки	порушення печінкових функцій
Шкіра та підшкірна тканина	рідкісні випадки	висипання, алопеція
Загальні розлади	рідкісні випадки	підвищена втомлюваність
Дослідження	частота невідома	збільшення маси тіла

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. Зберігати при температурі не вище 25 °C у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 90 мл у флаконі або банці з дозуючою скляночкою в пачці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Виробник.

ТОВ «ДКП «Фармацевтична фабрика».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Україна, 12430, Житомирська обл., Житомирський р-н, с. Станишівка, вул. Корольова, б. 4.