ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ЛОРАТАДИН-ЗДОРОВ'Я

(LORATADINE-ZDOROVYE)

Склад:

діюча речовина: loratadine;

5 мл сиропу містять лоратадину 5 мг;

допоміжні речовини: цукор-рафінад, кислота лимонна безводна, натрію бензоат (Е 211), пропіленгліколь, гліцерин, вода очищена; ароматизатор «Абрикос 696», що містить пропіленгліколь.

Лікарська форма. Сироп.

Основні фізико-хімічні властивості: безбарвна або злегка жовтувата, або злегка зеленувато-жовтувата рідина зі специфічним запахом.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні засоби для системного застосування.

Код АТХ R06A X13.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Лоратадин — трициклічний антигістамінний засіб із селективною активністю відносно периферичних Н1-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, лабораторних дослідженнях, даних фізикального обстеження хворого або в електрокардіограмі. Препарат не має значущого впливу на активність Н2-гістамінових рецепторів. Не блокує захоплення норепінефрину та фактично не має впливу 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.

Клінічна ефективність та безпека

Понад 10000 пацієнтів (віком від 12 років) в рамках контрольованого клінічного дослідження проходили лікування таблетками лоратадину 10 мг. Лоратадин у дозі 10 мг 1 раз на добу був

ефективнішим за плацебо та мав подібний до клемастину ефект при лікуванні назальних та неназальних симптомів алергічного риніту. У цих дослідженнях, частота сонливості в порівнянні з клемастином була нижчою при застосуванні лоратадину та подібною у порівнянні з терфенадином та плацебо.

Діти

Під час педіатричних досліджень близько 200 дітей (у віці від 6 до 12 років) із сезонним алергічним ринітом застосовували лоратадин у вигляді сиропу у дозах до 10 мг 1 раз на добу. В іншому дослідженні 60 дітей (у віці від 2 до 5 років) застосовували лоратадин у вигляді сиропу у дозі 5 мг 1 раз на добу. Не спостерігалися жодні непередбачувані побічні реакції. Ефективність у дітей була подібною ефективності, яка спостерігалася у дорослих.

Фармакокінетика.

Всмоктування. Лоратадин швидко та добре всмоктується. Вживання їжі незначно подовжує час всмоктування лоратадину, але не впливає на клінічний ефект. Біодоступність лоратадину та його активного метаболіту прямопропорційна дозі.

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 (T½) лоратадину та його активного метаболіту з плазми крові 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 в плазмі крові становить 1-1,5 години та 1,5-3,7 години відповідно.

Виведення. Приблизно 40 % введеної дози виводяться 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 незміненій активній формі – як лоратадин або дезлоратадин.

Середній кінцевий $T_{½}$ 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 $T_{½}$ 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 пацієнтів із хронічним алкогольним ураженням печінки показники AUC і C_{max} лоратадину були в два рази вищими, а відповідні показники їх активного метаболіту не змінювалися істотно порівняно з такими показниками у пацієнтів із нормальною функцією печінки. $T_{½}$ 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 у дорослих та дітей віком від 2 років.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до активної речовини або до будь-якого іншого компонента препарату.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Препарат не посилює пригнічувальну дію алкоголю на психомоторні реакції.

Одночасне застосування лоратадину з інгібіторами CYP3A4 або CYP2D6 може призводити до підвищення рівня лоратадину, що, в свою чергу, посилює побічні ефекти.

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

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

Особливості застосування.

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

Препарат містить цукор, тому якщо у пацієнта встановлена непереносимість деяких цукрів, необхідно проконсультуватися з лікарем, перш ніж приймати цей лікарський засіб. Може бути шкідливим для зубів.

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

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність. Велика кількість даних (понад 1000 експонованих результатів) щодо вагітних жінок свідчить про те, що лоратадин не спричиняє аномалій розвитку та не є токсичним для

плода чи новонароджених. Дослідження на тваринах не виявили прямих або непрямих негативних ефектів на репродуктивну функцію. Бажано, як захід безпеки, уникати застосування препарату у період вагітності.

Період годування груддю. Фізико-хімічні дані свідчать про виведення лоратадину/метаболітів у грудне молоко. Оскільки ризик для дитини не може бути виключений, препарат не слід застосовувати в період годування груддю.

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

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

Препарат не впливає або впливає незначним чином на здатність керувати автотранспортом або іншими механізмами. Проте пацієнту необхідно повідомити, що дуже рідко може виникати сонливість, що впливає на здатність керувати автотранспортом або працювати з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Спосіб застосування.

Застосовувати перорально. Сироп можна застосовувати незалежно від прийому їжі.

Дозування.

Дорослим і дітям віком від 12 років приймати по 10 мл сиропу (10 мг лоратадину) (2 мірні ложки або 1 саше по 10 мл, або 2 саше по 5 мл) 1 раз на добу.

1 мірна ложка відповідає 5 мл сиропу (5 мг лоратадину).

Дітям віком від 2 до 12 років з масою тіла більше 30 кг – 10 мл сиропу (10 мг лоратадину) (2 мірні ложки або 1 саше по 10 мл, або 2 саше по 5 мл) 1 раз на добу.

Дітям з масою тіла менше 30 кг – 5 мл сиропу (5 мг лоратадину) (1 мірна ложка) або 1 саше по 5 мл 1 раз на добу.

Пацієнти літнього віку.

Не вимагається корекції дозування людям літнього віку.

Пацієнти з порушеннями функцій печінки.

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

Пацієнти з порушеннями функцій нирок.

Немає необхідності в корекції дози для пацієнтів з порушеннями функцій 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 рекомендовано 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 надання невідкладної допомоги пацієнт повинен перебувати під медичним наглядом.

Побічні реакції.

У клінічних дослідженнях з участю дорослих і підлітків при застосуванні лоратадину в рекомендованій дозі 10 мг на добу за показаннями, що включають алергічний риніт (АР) і хронічну ідіопатичну кропив'янку (ХІК), про побічні реакції повідомлялося у 2 % пацієнтів (що перевищує показники у пацієнтів, які отримували плацебо). Найчастішими побічними реакціями, про які повідомлялося частіше, ніж при застосуванні плацебо, були: сонливість (1,2 %), головний біль (0,6 %), підвищений апетит (0,5 %) та 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 %).

Побічні реакції, про які повідомлялося в ході постмаркетингового періоду, вказані нижче за класами систем органів. Частота побічних реакцій визначалася таким чином: дуже часті (≥ 1/10), часті (від ≥ 1/100 до < 1/10), нечасті (від ≥ 1/1000 до < 1/100), поодинокі випадки (від ≥ 1/10 000 до < 1/1000), рідкісні випадки (< 1/10 000) і частота невідома (неможливо встановити за наявними даними).

У кожній групі побічні реакції вказані в порядку зниження серйозності.

З боку імунної системи: рідкісні випадки - реакції підвищеної чутливості (в тому числі анафілаксія, ангіоедема).

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

З боку серцево-судинної системи: рідкісні випадки - тахікардія, відчуття серцебиття.

З боку шлунково-кишкового тракту: рідкісні випадки - нудота, сухість у роті, гастрит.

З боку гепатобіліарної системи: рідкісні випадки - порушення печінкових функцій.

З боку шкіри та підшкірної тканини: рідкісні випадки - висипання, алопеція.

Загальні розлади: рідкісні випадки - підвищена втомлюваність.

Результати лабораторних та інших досліджень: частота невідома — збільшення маси тіла.

Термін придатності. 3 **роки.**

Умови зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 100 мл у флаконі з мірною ложкою у коробці; по 5 мл або 10 мл у саше № 20 у коробці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Виробник. Товариство з обмеженою відповідальністю «Фармацевтична компанія «Здоров'я».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.
Україна, 61013, Харківська обл., місто Харків, вулиця Шевченка, будинок 22.