ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ЛОРАТАДИН

(LORATADINE)

Склад:

діюча речовина: loratadine;

1 таблетка містить лоратадину (у перерахунку на 100 % речовину) 10 мг;

допоміжні речовини: лактоза, моногідрат; повідон; крохмаль картопляний; магнію стеарат.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого кольору, плоскоциліндричної форми зі скошеними краями, з рискою з одного боку.

Фармакотерапевтична група.

Антигістамінні засоби для системного застосування. Код АТХ R06A X13.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Лоратадин – трициклічний селективний блокатор периферичних H_1-гістамінових рецепторів. При застосуванні у рекомендованій дозі не чинить клінічно значущої седативної та антихолінергічної дії. Протягом тривалого лікування не виявлено жодних клінічно значущих змін показників життєво важливих функцій, лабораторних досліджень, даних фізикального обстеження хворого або електрокардіограми. Лоратадин не має значущого впливу на активність H_2-гістамінових рецепторів. Не блокує захоплення норепінефрину і фактично не впливає на серцево-судинну систему або на активність водія ритму.

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.

З учасників цих досліджень (віком 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 (віком 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 (віком 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 їди може дещо затримувати всмоктування лоратадину, проте це не впливає на клінічний ефект. Показники біодоступності лоратадину та його активного метаболіту є пропорційними дозі.

Розподіл. Лоратадин активно зв'язується (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 метаболіту в 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 годин 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 метаболіту – 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 метаболіту порівняно з такими показниками у пацієнтів із нормальною функцією нирок. Середній період напіввиведення лоратадину і його активного метаболіту не відрізнявся значною мірою від показників у здорових добровольців. У пацієнтів із хронічним порушенням функції печінки 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 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 і здорових добровольців літнього віку.

Клінічні характеристики.

Показання.

Симптоматичне лікування алергічного риніту та хронічної ідіопатичної кропив’янки.

Протипоказання.

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

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Циметидин, еритроміцин і кетоконазол підвищують концентрацію лоратадину у плазмі крові, але це підвищення ніяк не виявляється клінічно, у т. ч. за даними електрокардіограми.

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

Лоратадин не посилює пригнічувальну дію алкоголю на психомоторні реакції.

Діти. Дослідження щодо взаємодії з іншими препаратами проводили тільки з участю дорослих пацієнтів.

Особливості застосування.

Лоратадин слід застосовувати з обережністю пацієнтам із тяжким порушенням функції печінки.

Прийом препарату Лоратадин слід необхідно припинити як мінімум за 48 годин до проведення шкірних тестів, оскільки антигістаміни можуть нейтралізувати або іншим чином послабляти позитивну реакцію при визначенні індексу реактивності шкіри.

Препарат містить лактозу, тому його не слід застосовувати пацієнтам із рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, недостатністю лактази, синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції.

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 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, лоратадин не слід застосовувати у 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.

Не відзначалося впливу препарату на швидкість реакції пацієнта при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами. Проте пацієнт повинен бути проінформований про дуже рідкісні випадки сонливості або запаморочення, що можуть впливати на здатність до керування автотранспортом або роботи з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Застосовувати перорально. Таблетки можна застосовувати незалежно від прийому їжі.

Дорослі і діти віком від 12 років: 10 мг (1 таблетка) 1 раз на добу.

Для дітей віком від 2 до 12 років дозування залежить від маси тіла. Дітям з масою тіла більше 30 кг: 10 мг (1 таблетка) 1 раз на добу. Дітям з масою тіла менше 30 кг: застосовувати лоратадин у відповідній лікарській формі (сироп).

Пацієнти з порушенням функції печінки.

Пацієнтам з тяжкою формою порушення функції печінки слід призначати препарат в нижчій початковій дозі, оскільки у них можливе зниження кліренсу лоратадину. Для дорослих і дітей з 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.

Пацієнти літнього віку.

Немає необхідності в корекції дози для пацієнтів літнього віку.

Діти.

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

Лоратадин у вигляді таблеток застосовувати дітям з масою тіла більше 30 кг; дітям віком від 2 до 12 років з масою тіла менше 30 кг застосовувати лоратадин у відповідній лікарській формі (сироп).

Передозування.

Передозування лоратадину підвищує частоту виникнення антихолінергічних симптомів. При передозуванні повідомляли про сонливість, тахікардію і головний біль.

Лікування. У разі передозування рекомендоване 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 повідомляли у 2 % пацієнтів (що перевищує показник у пацієнтів, які отримували плацебо). Частішими побічними реакціями, про які повідомляли частіше, ніж при застосуванні 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 повідомляли у 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 ≥ 1/1000 до < 1/100), поодинокі випадки (від ≥ 1/10 000 до < 1/1000), рідкісні випадки (< 1/10 000), частота невідома (неможливо встановити за наявними даними).

У кожній групі частоти побічні реакції вказані у порядку зменшення проявів.

Клас системи органів	Частота	Побічні ефекти
Імунна система	Рідкісні випадки	Реакції підвищеної чутливості (в тому числі анафілаксія, ангіоедема)
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
Результати лабораторних та інших досліджень	Частота невідома	Збільшення маси тіла

Повідомлення про підозрювані побічні реакції

Повідомлення про побічні реакції після реєстрації лікарського засобу має важливе значення. Це дає змогу проводити моніторинг співвідношення користь/ризик при застосуванні цього лікарського засобу. Медичним та фармацевтичним працівникам, а також пацієнтам або їхнім законним представникам слід повідомляти про усі випадки підозрюваних побічних реакцій та відсутності ефективності лікарського засобу через Автоматизовану інформаційну систему з фармаконагляду за посиланням: https://aisf.dec.gov.ua.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

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

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері; по 1, 2, 9 або 10 блістерів у коробці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Виробник.

ТОВ «АСТРАФАРМ».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

08132, Україна, Київська обл., Бучанський р-н, м. Вишневе, вул. Київська, 6.