ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування|вживанню| лікарського засобу

ЛОРАТАДИН-ЗДОРОВ'Я

(LORATADINE-ZDOROVYE)

Склад:

діюча речовина: loratadine;

1 таблетка містить лоратадину 10 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, крохмаль кукурудзяний, кремнію діоксид колоїдний безводний, повідон, магнію стеарат|, натрію кроскармелоза.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого або білого з жовтуватим відтінком кольору плоскоциліндричної форми з рискою.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні засоби для системного застосування.

Код АТХ R06A X13.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Лоратадин (діюча речовина препарату) – трициклічний антигістамінний засіб із селективною активністю відносно периферичних H_1-рецепторів.

У більшості пацієнтів при застосуванні у 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. Препарат не інгібує поглинання норепінефрину і 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 і 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 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 – із помірною активністю (від 73 % до 76 %). У здорових добровольців період напіврозподілу лоратадину та його активного метаболіту 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 активний 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 становить 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 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 і здорових добровольців літнього віку.

Клінічні характеристики.

Показання.

Симптоматичне лікування алергічного риніту і хронічної ідіопатичної кропив’янки.

Протипоказання.

Лікарський засіб 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 можлива при застосуванні всіх відомих інгібіторів CYP3A4 або CYP2D6, що призводить до підвищення рівнів лоратадину, а це в свою чергу може бути причиною підвищення частоти виникнення побічних реакцій.

У контрольованих дослідженнях повідомлялося про підвищення концентрації лоратадину у плазмі крові після одночасного застосування з кетоконазолом, еритроміцином і циметидином, що не супроводжувалося клінічно значущими змінами (у т. ч. на ЕКГ).

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

Особливості застосування.

Препарат слід з обережністю застосовувати пацієнтам із тяжкою формою порушення функції печінки.

Застосування препарату 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, якщо у пацієнта встановлена непереносимість деяких цукрів, треба проконсультуватися з лікарем, перш ніж приймати цей лікарський засіб.

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 у період вагітності.

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

Фертильність. Дані щодо впливу лоратадину 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. Препарат не впливає або впливає незначним чином на здатність керувати автотранспортом або іншими механізмами. Проте пацієнту необхідно повідомити, 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 вживання їжі.

Дозування. Дорослим та дітям 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 із порушеннями функції печінки. Пацієнтам із порушеннями функції печінки тяжкого ступеня слід призначати препарат у 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 із порушеннями функції нирок. Немає необхідності в корекції дози для пацієнтів із порушеннями функції нирок.

Діти.

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

Препарат у вигляді таблеток застосовувати дітям з масою тіла більше 30 кг.

Передозування.

Передозування лоратадину підвищує частоту виникнення антихолінергічних симптомів. При передозуванні повідомлялося 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 із організму при проведенні гемодіалізу; ефективність перитонеального діалізу у виведенні препарату невідома. Після невідкладної допомоги пацієнт має залишатися 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 нервової системи: рідкісні випадки – запаморочення, судоми.

З боку серця: рідкісні випадки – пальпітація, тахікардія.

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

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

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

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

Загальні розлади: рідкісні випадки – втома.

Дослідження: частота невідома – збільшення маси тіла.

Термін придатності. 4 роки.

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

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. Таблетки № 10, № 10×2 у блістерах у коробці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Виробник. ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ «КОРПОРАЦІЯ «ЗДОРОВ’Я».

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