ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ЛОРАТАДИН

(Loratadine)

Склад:

діюча речовина: loratadine;

1 таблетка містить лоратадину 0,01 г (10 мг);

допоміжні речовини: лактози моногідрат, крохмаль кукурудзяний, магнію стеарат, кремнію діоксид колоїдний безводний, целюлоза мікрокристалічна.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого або майже білого кольору з розподільною рискою та 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. 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 піка через 8-12 годин і триває більше 24 годин. Не відзначалося розвитку стійкості до дії препарату після 28 днів

застосування лоратадину.

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 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 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 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.

Порушення функції нирок. У пацієнтів із хронічним порушенням функції нирок підвищувалися показники AUC та максимальної концентрації у плазмі крові (C_{max}) лоратадину і його активного метаболіту порівняно з такими показниками в 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 показники їх активного метаболіту не змінювалися істотно при порівнянні з такими показниками в 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.

Лоратадин 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 підтверджується дослідженнями психомоторної функції.

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

Повідомлялося про підвищення концентрацій лоратадину в 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.

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

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

Застосування препарату необхідно припинити як мінімум за 48 годин перед проведенням шкірних тестів, оскільки антигістаміни 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 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 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.

У клінічних дослідженнях, що вивчали здатність керувати автомобілем, у хворих, які застосовували лоратадин, жодних змін не спостерігалося. Лоратадин не впливає або впливає незначним чином на здатність керувати автотранспортом або іншими механізмами. Проте пацієнтів необхідно проінформувати, 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 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 корекція дозування пацієнтам літнього віку.

Пацієнти з порушеннями функції печінки.

Пацієнтам із порушеннями функції печінки тяжкого ступеня 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 порушеннями функції нирок.

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

Діти.

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

Лоратадин, таблетки, слід призначати 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 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. При застосуванні лоратадину у 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, про які повідомлялося частіше, ніж при застосуванні плацебо, були: сонливість (1,2 %), головний біль (0,6 %), посилення апетиту (0,5 %) і безсоння (0,1 %). У дітей віком від 2 до 12 років відзначалися такі небажані явища, як головний біль (2,7 %), нервозність (2,3 %) або підвищена втомлюваність (1 %).

Перелік побічних реакцій. Побічні реакції, про які повідомлялося в процесі постмаркетингового періоду, вказані нижче за класами систем органів. Частота визначена як: дуже часто (≥1/10), часто (від ≥1/100 до <1/10), нечасто (від ≥1/1 000 до <1/100), рідко (від ≥1/10 000 до <1/1 000), дуже рідко (<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: дуже рідко – реакції гіперчутливості, включаючи анафілаксію та ангіоневротичний набряк.

З боку нервової системи: дуже рідко – запаморочення, судоми.

З боку серця: дуже рідко – тахікардія, пальпітація.

З боку травного тракту: дуже рідко – нудота, сухість у роті, гастрит.

З боку гепатобіліарної системи: дуже рідко – патологічні зміни функції печінки.

З боку шкіри і підшкірної клітковини: дуже рідко – висипання, алопеція.

Порушення загального стану і порушення, пов'язані зі способом застосування препарату: дуже рідко – підвищена втомлюваність.

Дослідження: частота невідома – збільшення маси тіла.

Термін придатності.

3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в недоступному для дітей місці. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Упаковка. По 10 таблеток у блістері, по 1 або 2, або 50, або 100 блістерів у пачці.

Категорія відпуску.

Без рецепта – № 10, № 20. Для стаціонарів – № 500, № 1000.

Виробник.

Приватне акціонерне товариство «Лекхім-Харків». ПрАТ «Технолог».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Україна, 61115, Харківська обл., місто Харків, вулиця Северина Потоцького, будинок 36.

Україна, 20300, Черкаська обл., місто Умань, вулиця Стара прорізна, будинок 8.