

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 мікрочастична.

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 H₁-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 H₂-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 незмінній активній формі – як лоратадин або дезлоратадин.

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 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 метаболіта 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 підтверджено 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. Даних про застосування лоратадину вагітним жінкам дуже мало. 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.

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 механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Спосіб застосування.

Перорально. Таблетки можна застосовувати незалежно від прийому 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 порушенням функції печінки.

Пацієнтам з порушеннями функцій 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 порушенням функції нирок.

Немає необхідності у корекції дози для пацієнтів з порушенням функції нирок.

Діти.

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

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 у ході постмаркетингового періоду, вказані нижче за класами систем органів. Частота визначена як: дуже часто ($\geq 1/10$),

часто (від $\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечасто (від $\geq 1/1\ 000$ до $< 1/100$), рідко (від $\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1\ 000$), дуже рідко ($< 1/10\ 000$) і невідомо (неможливо встановити за наявними даними).

У кожній групі частоти побічні реакції вказані у порядку зниження серйозності.

З боку імунної системи: дуже рідко – анафілаксія.

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 пов'язані зі способом застосування препарату: дуже рідко – підвищена втомлюваність.

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. АТ «Лекхім-Харків».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, Харківська обл., місто Харків, вулиця сімнадцятого Партз'їзду, будинок 36.

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению лекарственного средства

ЛОРАТАДИН
(LORATADINE)

Состав:

действующее вещество: loratadine;

1 таблетка содержит лоратадина 0,01 г (10 мг);

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал кукурузный, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный безводный, целлюлоза микрокристаллическая.

Лекарственная форма. Таблетки.

Основные физико-химические свойства: таблетки белого или почти белого цвета с разделительной риской и фаской.

Фармакотерапевтическая группа. Антигистаминные средства для системного применения.
Код АТХ R06A X13.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Лоратадин – трициклическое антигистаминное средство с селективной активностью относительно периферических H₁-рецепторов.

У большинства пациентов при применении в рекомендуемой дозе лоратадин не оказывает клинически значимого седативного и антихолинергического действия. На протяжении длительного лечения не наблюдалось клинически значимых изменений в показателях жизненно-важных функций организма, результатах лабораторных исследований, физикального обследования или электрокардиограммы. Лоратадин не имеет значимого влияния на H₂-гистаминовые рецепторы. Препарат не ингибирует поглощение норэпинефрина и фактически не влияет на функцию сердечно-сосудистой системы или на активность водителя ритма сердца.

Исследования с проведением кожных проб на гистамин после приема разовой дозы 10 мг показали, что антигистаминный эффект возникает через 1-3 часа, достигает пика через 8-12 часов и длится более 24 часов. Не отмечалось развития устойчивости к препарату после 28 дней применения лоратадина.

Фармакокинетика.

Всасывание. Лоратадин быстро и хорошо всасывается. Применение препарата во время еды может несколько задерживать всасывание лоратадина, однако это не влияет на клинический эффект. Показатели биодоступности лоратадина и его активного метаболита пропорциональны дозе.

Распределение. Лоратадин связывается активно (от 97 % до 99 %) с белками плазмы крови, а его активный метаболит – с умеренной активностью (от 73 % до 76 %).

У здоровых добровольцев период полураспределения лоратадина и его активного метаболита в плазме крови составляет приблизительно 1 и 2 часа соответственно.

Биотрансформация. После перорального применения лоратадин быстро и хорошо абсорбируется, а также экстенсивно метаболизируется при первом прохождении через печень, главным образом с помощью CYP3A4 и CYP2D6. Основным метаболит дезлоратадин является фармакологически активным и в большей степени отвечает за клинический эффект. Лоратадин и дезлоратадин достигают максимальной концентрации в плазме крови (T_{max}) через 1-1,5 часа и 1,5-3,7 часа соответственно после применения препарата.

Выведение. Примерно 40 % дозы выводится с мочой и 42 % с калом в течение 10 дней, в основном в форме конъюгированных метаболитов. Примерно 27 % дозы выводится с мочой в

течение первых 24 часов. Менее 1 % действующего вещества выводится в неизменной активной форме – как лоратадин или дезлоратадин.

Нарушение функции почек. У пациентов с хроническим нарушением функции почек повышались показатели AUC и максимальной концентрации в плазме крови (C_{max}) лоратадина и его активного метаболита по сравнению с такими показателями у пациентов с нормальной функцией почек. Средний период полувыведения лоратадина и его активного метаболита не отличался в значительной степени от показателей у здоровых добровольцев. У пациентов с хроническим нарушением функции печени гемодиализ не влияет на фармакокинетику лоратадина и его активного метаболита.

Нарушение функции печени. У пациентов с хроническим алкогольным поражением печени показатели AUC и C_{max} лоратадина были в два раза выше, а показатели их активного метаболита не изменялись существенно по сравнению с такими показателями у пациентов с нормальной функцией печени. Период полувыведения лоратадина и его активного метаболита составляет 24 и 37 часов соответственно и увеличивается в зависимости от тяжести заболевания печени.

Пациенты пожилого возраста. Показатели фармакокинетики лоратадина и его активного метаболита были аналогичными у здоровых взрослых добровольцев и здоровых добровольцев пожилого возраста.

Клинические характеристики.

Показания.

Симптоматическое лечение аллергического ринита и хронической идиопатической крапивницы.

Противопоказания.

Лоратадин противопоказан пациентам с повышенной чувствительностью к активным веществам или к любому другому компоненту препарата.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

При применении одновременно с алкоголем эффекты препарата не усиливаются, что подтверждается исследованиями психомоторной функции.

Потенциальное взаимодействие может иметь место при применении всех известных ингибиторов CYP3A4 или CYP2D6, что приводит к повышению уровня лоратадина, а это, в свою очередь, может быть причиной повышения частоты возникновения побочных реакций.

Во время контролируемых исследований сообщалось о повышении концентрации лоратадина в плазме крови после одновременного применения с кетоконазолом, эритромицином и циметидином, которое не сопровождалось клинически значимыми изменениями (в том числе на ЭКГ).

Дети. Исследования взаимодействий с другими препаратами проводили только с участием взрослых пациентов.

Особенности применения.

Лоратадин следует с осторожностью применять пациентам с тяжелой формой нарушения функции печени.

В состав препарата входит лактоза. По этой причине пациенты с такими редкими наследственными заболеваниями как непереносимость галактозы, дефицит лактазы Лаппа и мальабсорбция глюкозы-галактозы не должны применять этот препарат.

Применение препарата необходимо прекратить как минимум за 48 часов перед проведением кожных тестов, поскольку антигистамины могут нейтрализовать или иным образом ослаблять положительную реакцию при определении индекса реактивности кожи.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Беременность. Данных о применении лоратадина беременным женщинам очень мало. Исследования на животных не выявили прямых или косвенных негативных эффектов, касающихся репродуктивной токсичности. Желательно, в качестве меры безопасности, избегать применения препарата в период беременности.

Кормление грудью. Физико-химические данные свидетельствуют о выведении лоратадина/метаболитов из грудного молока. Поскольку риск для ребенка не может быть исключен, препарат не следует применять в период кормления грудью.

Фертильность. Данные о влиянии препарата на женскую или мужскую фертильность отсутствуют.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Лоратадин не влияет или влияет незначительно на способность управлять автотранспортом или другими механизмами. Однако пациента необходимо проинформировать, что очень редко сообщалось о сонливости, которая может влиять на способность управлять автотранспортом или другими механизмами.

Способ применения и дозы.

Способ применения.

Перорально. Таблетки можно принимать независимо от приема пищи.

Дозировка.

Взрослым и детям с 12 лет принимать по 1 таблетке (10 мг лоратадина) 1 раз в сутки.

Для детей в возрасте от 2 до 12 лет дозировка зависит от массы тела.

При массе тела более 30 кг: 10 мг (1 таблетка) 1 раз в сутки. Детям с массой тела менее 30 кг применяют препарат в виде сиропа.

Пациенты пожилого возраста.

Не требуется коррекции дозы пациентам пожилого возраста.

Пациенты с нарушением функции печени.

Пациентам с нарушениями функции печени тяжелой степени следует назначать препарат в более низкой начальной дозе, так как в них возможно снижение клиренса лоратадина. Для взрослых и детей с массой тела более 30 кг рекомендуемая начальная доза составляет 10 мг через день.

Пациенты с нарушением функции почек.

Нет необходимости в коррекции дозы для пациентов с нарушением функции почек.

Дети.

Эффективность и безопасность применения лоратадина детям до 2 лет не установлены.

Лоратадин, таблетки следует назначать детям с массой тела более 30 кг.

Передозировка.

Передозировка лоратадина повышает частоту возникновения антихолинергических симптомов. При передозировке сообщалось о сонливости, тахикардии и головной боли. В случае передозировки рекомендуется симптоматическое и поддерживающее лечение в течение необходимого периода времени. Возможно применение активированного угля в виде водной суспензии. Также можно провести промывание желудка. Лоратадин не выводится из организма при проведении гемодиализа; эффективность перитонеального диализа в выведении препарата неизвестна. После неотложной помощи пациент должен остаться под наблюдением.

Побочные реакции.

Краткая характеристика профиля безопасности. При применении лоратадина в рекомендованной дозе 10 мг в сутки при показаниях, включающих аллергический ринит и хроническую идиопатическую крапивницу, о побочных реакциях сообщалось в 2 %

пациентов (что превышает показатель у пациентов, получавших плацебо). Более частыми побочными реакциями, о которых сообщалось чаще, чем при применении плацебо, были: сонливость (1,2 %), головная боль (0,6 %), усиление аппетита (0,5 %) и бессонница (0,1 %). У детей от 2 до 12 лет отмечались такие нежелательные эффекты, как головная боль (2,7 %), нервозность (2,3 %) или повышенная утомляемость (1 %).

Перечень побочных реакций. Побочные реакции, о которых сообщалось в ходе постмаркетингового периода, указаны ниже по классам систем органов. Частота определена как: очень часто ($\geq 1/10$), часто (от $\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечасто (от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$), редко (от $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$) и неизвестно (невозможно установить по имеющимся данным).

В каждой группе частоты побочных реакций указаны в порядке убывания серьезности.

Со стороны иммунной системы: очень редко – анафилаксия.

Со стороны нервной системы: очень редко – головокружение, судороги.

Со стороны сердца: очень редко – тахикардия, пальпитация.

Со стороны пищеварительного тракта: очень редко – тошнота, сухость во рту, гастрит.

Со стороны гепатобилиарной системы: очень редко – патологические изменения функции печени.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: очень редко – сыпь, алопеция.

Нарушения общего состояния и связанные со способом применения препарата: очень редко – повышенная утомляемость.

Срок годности. 3 года.

Условия хранения.

Хранить в недоступном для детей месте.

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Упаковка. По 10 таблеток в блистере, по 1 или 2, или 50, или 100 блистеров в пачке.

Категория отпуска. Без рецепта – № 10, № 20. Для стационаров – № 500, № 1000.

Производитель. АО «Лекхим-Харьков».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.

Украина, Харьковская обл., город Харьков, улица семнадцатого Партсъезда, дом 36.