

ИНСТРУКЦИЯ

(информация для специалистов)

по медицинскому применению лекарственного средства

ЛОРАТАДИН

Торговое название: Лоратадин.

Международное непатентованное название: Loratadine.

Форма выпуска: таблетки.

Описание: таблетки белого или почти белого цвета, плоскоцилиндрические, с риской и фаской.

Состав: одна таблетка содержит: *действующего вещества* – лоратадина - 10 мг; *вспомогательные вещества* – лактозы моногидрат, крахмал картофельный, целлюлоза микрокристаллическая, стеариновая кислота.

Фармакотерапевтическая группа: антигистаминное средство для системного применения.

Код АТХ – R06AX13.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Механизм действия

Лоратадин является селективным трициклическим антигистаминным средством, который действует на периферические H_1 - рецепторов.

Фармакологические эффекты

Лоратадин при использовании в рекомендуемой дозе не оказывает существенного седативного или антихолинергического действия у большинства пациентов.

Во время длительного лечения не наблюдалось ~~клинически значи-~~
мых изменений жизненных функций, лабораторных показателей, данных
клинического обследования и ЭКГ.

Лоратадин не имеет существенного действия на H₂- рецепторы.

Лекарственное средство не ингибирует захват норадреналина и
практически не влияет на функции сердечно-сосудистой системы или ак-
тивности водителя ритма сердца.

Исследования с проведением кожных проб на гистамин, после вве-
дения дозы 10 мг показали, что антигистаминный эффект возникает через
1- 3 ч, достигая максимума через 8-12 ч и длится более 24 ч. Не отмеча-
лось развития устойчивости к действию лекарственного средства после 28
дней применения.

Фармакокинетика

Всасывание

Лоратадин быстро и хорошо всасывается. Сопутствующий прием
пищи может несколько задерживать всасывание лоратадина, но это не
оказывает никакого влияния на клинический эффект. Показатели биодос-
тупности лоратадина и его активного метаболита пропорциональны дозе.

Распределение

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

У здоровых добровольцев период полувыведения лоратадина и его
активного метаболита из плазмы крови составляет приблизительно 1 ч и
2 ч соответственно.

После перорального применения лоратадин быстро и хорошо вса-
сывается.

Лоратадин метаболизируется в печени с образованием активного
метаболита дезкарбоэтоксилоратадина при участии изоферментов цито-
хрома CYP3A4 и в меньшей степени CYP2D6. Время достижения макси-

мальной концентрации лоратадина и дезкарбоэтокси-лоратадина в плазме крови (T_{max}) через 1-1,5 ч и 1,5-3,7 ч соответственно (прием пищи замедляет T_{max} на 1 ч).

Выведение

Примерно 40 % дозы выводиться с мочой и 42 % с калом на протяжении 10 дней в основном в форме конъюгированных метаболитов. Примерно 27 % дозы выводится с мочой в течение первых 24 ч. Менее 1 % активного вещества выводится из организма без изменений, как лоратадин, так и дезкарбоэтокси-лоратадин.

Средний период полувыведения у здоровых добровольцев лоратадина был 8,4 ч (диапазон от 3 до 20 ч), а основного метаболита - 28 ч (диапазон от 8,8 до 92 ч).

Почечная недостаточность

Максимальная плазменная концентрация (C_{max}) и AUC лоратадина и его метаболитов увеличивается у пациентов с хронической почечной недостаточностью по сравнению со здоровыми пациентами. У таких пациентов период полувыведения лоратадина и его метаболитов в незначительной степени отличался от здоровых пациентов. Проведение гемодиализа не оказывало влияния на фармакокинетику лоратадина и его активного метаболита.

Печеночная недостаточность

При хроническом алкогольном поражении печени значения C_{max} и AUC лоратадина увеличивались в два раза, хотя в целом фармакокинетический профиль у данных пациентов незначительно отличался от профиля у здоровых пациентов. Период полувыведения лоратадина и его метаболитов составляет 24 ч и 37 ч соответственно и увеличивается с увеличением степени тяжести поражения печени.

Пожилые пациенты

Клиническое исследование выявило, что фармакокинетический профиль лоратадина и его метаболитов сравним у молодых и пожилых добровольцев.

Показания к применению

Симптоматическое лечение аллергического ринита и хронической идиопатической крапивницы у взрослых и детей старше 2 лет с массой тела более 30 кг.

Противопоказания

Гиперчувствительность к активному веществу или к любому из вспомогательных компонентов лекарственного средства, период лактации.

Способ применения и дозы

Внутрь. Таблетки можно принимать независимо от приема пищи.

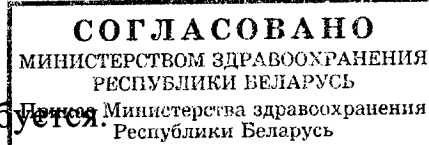
Взрослым и детям старше 12 лет: по 10 мг (1 таблетка) один раз в день.

Детям 2-12 лет: доза устанавливается в зависимости от массы тела. Детям с массой тела более 30 кг: 10 мг один раз в день (одна таблетка один раз в день); детям с массой тела 30 кг или менее: лекарственное средство в форме таблетки 10 мг не подходит для детей с массой тела менее 30 кг. Есть другие, более подходящие формы для детей от 2 до 12 лет с массой тела 30 кг или меньше.

Данные по безопасности и эффективности применения лоратадина у детей в возрасте до 2 лет отсутствуют.

Пациенты с нарушением функции печени: пациентам с тяжелыми нарушениями функции печени должна быть назначена меньшая начальная доза из-за возможности уменьшения клиренса лоратадина. Рекомендуется начальная доза 10 мг через день для взрослых и детей с массой тела более 30 кг.

Пациенты с почечной недостаточностью: коррекция дозы не требуется.



Пожилые пациенты: коррекция дозы не требуется.

Побочное действие

В клинических исследованиях, проведенных с участием взрослых и подростков, при применении лоратадина в рекомендованной дозе 10 мг в сутки с показаниями: ринит и хроническая идиопатическая крапивница, о побочных реакциях сообщалось у 2 % пациентов, что превышало показатель среди пациентов, получавших плацебо. Наиболее частыми побочными реакциями, о которых сообщалось чаще, чем при применении плацебо, были: сонливость (1,2 %), головная боль (0,6 %), повышение аппетита (0,5 %) и бессонница (0,1 %).

Для описания побочных действий использованы следующие категории частоты их появления в зависимости от общего числа случаев применения: 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 ($< 1/10000$); частота неизвестна (на основании имеющихся данных установить частоту невозможно).

Со стороны иммунной системы: очень редко – анафилаксия, ангионевротический отек, крапивница, зуд, фотосенсибилизация.

Со стороны нервной системы: очень редко – головокружение.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень редко – тахикардия, сердцебиение.

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

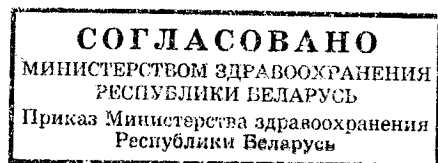
Со стороны пищеварительной системы: очень редко – тошнота, сухость во рту, гастрит.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: очень редко: нарушение функций печени.

Нарушения общего состояния: очень редко – усталость.

Лабораторные и инструментальные данные: частота неизвестна –
повышение веса.

Дети



В клинических исследованиях с участием детей в возрасте от 2 до 12 лет наиболее часто встречались следующие побочные реакции: головная боль (2,7 %), нервозность (2,3 %) и повышенная утомляемость (1 %).

Сообщение о нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного средства с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения польза/риск лекарственного средства.

Медицинским работникам рекомендуется направлять информацию о любых подозреваемых нежелательных реакциях и неэффективности лекарственного средства по адресу: Республиканское унитарное предприятие «Центр экспертиз испытаний в здравоохранении», Товарищеский пер., 2а, 220037, Республика Беларусь, e-mail: rcpl@rceth.by.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами.

При одновременном применении лекарственного средства с кетоназолом, эритромицином, циметидином отмечается повышение концентрации лоратадина в плазме крови, однако без каких-либо клинических проявлений.

Не установлено потенцирующего влияния лоратадина на психомоторные функции при одновременном применении с алкоголем.

При совместном применении с ингибиторами CYP3A4 или CYP2D6 отмечается увеличение уровня лоратадина, что может сопровождаться повышением риска возникновения побочных реакций.

Дети: взаимодействие лоратадина с другими лекарственными средствами исследованы только у взрослых.

Меры предосторожности

Лоратадин следует применять с осторожностью у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Следует соблюдать осторожность в случае применения лоратадина совместно с другими лекарственными средствами, в метаболизме которых участвуют ферменты печени цитохрома P450 3A4 и 2D6 (см. также раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»).

У пациентов пожилого возраста имеется риск появления сонливости.

Лекарственное средство содержит лактозу, поэтому его не следует применять пациентам с редкими наследственными заболеваниями непереносимости галактозы, лактазной недостаточности или глюкозо-галактозной мальабсорбции.

Прием Лоратадина необходимо прекратить не позже, чем за 48 ч до проведения кожных диагностических аллергопроб для предотвращения ошибочных результатов.

Не вызывает привыкания.

Беременность и лактация

Безопасность применения лоратадина в период беременности не установлена, поэтому не рекомендуется применять данное лекарственное средство в период беременности. Лоратадин выделяется с грудным молоком, поэтому не рекомендуется применение во время кормления грудью.

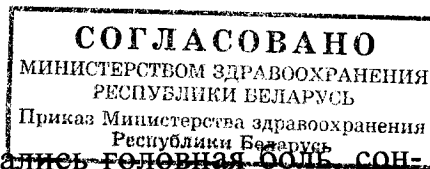
Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

В клинических исследованиях не отмечалось влияние лоратадина на скорость реакции пациента при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами. Однако в очень редких случаях возможно головокружение, поэтому не рекомендуется применять лекарственное

средство во время управления автотранспортом или при работе с другими механизмами.

Передозировка

Симптомы: у взрослых пациентов отмечались ~~головная боль, сон-~~



ливость и тахикардия при приеме лекарственного средства в дозах 40-180 мг, значительно превышающих рекомендованную терапевтическую дозу 10 мг. У детей с массой тела менее 30 кг при приеме в дозе более 10 мг отмечались экстрапирамидные симптомы и учащенное сердцебиение.

Лечение: индукция рвоты, промывание желудка, назначение активированного угля, симптоматическая и поддерживающая терапия. Лоратадин не выводится из организма при гемодиализе.

Упаковка

10 таблеток в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой. 1 или 3 контурные ячейковые упаковки с листком-вкладышем помещают в пачку из картона (№10x1, №10x3).

Условия хранения

В защищенном от света и влаги месте, при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не применять после окончания срока годности.

Условия отпуска из аптек

Без рецепта.

Информация о производителе

Открытое акционерное общество «Борисовский завод медицинских препаратов», Республика Беларусь, Минская обл., г. Борисов, ул. Чапаева, 64, тел/факс +375(177)735612, 731156.