

УТВЕРЖДЕНО
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
17.02.2016 № 104
Регистрационное удостоверение
№ UA/4033/01/01

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 в возрасте от 2 до 12 лет отмечались такие нежелательные эффекты, как головная боль (2,7 %), нервозность (2,3 %) или 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 $\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1\ 000$), очень редко ($< 1/10\ 000$) 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.

Дата последнего пересмотра.