

**ІНСТРУКЦІЯ**  
**для медичного застосування лікарського засобу**

**ЛОРАТАДИН**  
**(LORATADINE)**

**Склад:**

*діюча речовина:* loratadine;

1 таблетка містить лоратадину в перерахуванні на 100 % речовину (0,01 г) 10 мг;

*допоміжні речовини:* крохмаль картопляний, лактози моногідрат, повідон, кальцію стеарат.

**Лікарська форма.** Таблетки.

*Основні фізико-хімічні властивості:* таблетки круглої форми білого кольору з плоскою поверхнею, з фаскою і рискою або без риски.

**Фармакотерапевтична група.** Антигістамінні засоби для системного застосування.

Код АТХ R06A X13.

***Фармакологічні властивості.***

*Фармакодинаміка.*

Лоратадин – трициклічний антигістамінний засіб із селективною активністю відносно периферичних H<sub>1</sub>-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, лабораторних досліджень, фізикального обстеження або електрокардіограми. Лоратадин не має значущого впливу на H<sub>2</sub>-гістамінові рецептори. Препарат не інгібує захоплення норепінефрину і фактично не має впливу 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 толерантності до дії препарату після 28 днів застосування лоратадину.

***Клінічна ефективність і безпека.***

Більше 10000 пацієнтів (віком 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.

Серед 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 свербіжжю, еритеми та алергічного висипання. У цих дослідженнях частота сонливості була подібною при застосуванні лоратадину та плацебо.

***Діти.*** Близько 200 дітей (віком від 6 до 12 років) із сезонним алергічним ринітом отримували лоратадин (сіроп) 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 до 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 до дози.

**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<sub>max</sub>) 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. У дорослих здорових добровольців середній період напіввиведення лоратадину становив 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<sub>max</sub>) лоратадину і його активного метаболіта 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 людей. 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<sub>max</sub> лоратадину були в два рази вищими, а 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 хронічної ідіопатичної кропив'янки та алергічного риніту.

#### ***Протипоказання.***

Препарат протипоказаний пацієнтам з підвищеною чутливістю до діючої речовини або до будь-якого іншого компонента препарату.

#### ***Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.***

При застосуванні одночасно з алкоголем ефекти лоратадину не посилюються, що підтверджено дослідженнями психомоторної функції.

Потенційна взаємодія може мати місце 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.

Повідомлялося про підвищення концентрацій лоратадину у 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 для пацієнтів із тяжкою формою порушення функції печінки.

До складу препарату входить лактоза. Пацієнтам з такими рідкісними спадковими захворюваннями як непереносимість галактози, дефіцит лактази Лаппа і мальабсорбція глюкози-галактози не слід застосовувати даний препарат.

Застосування препарату Лоратадин 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 Лоратадин 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 Лоратадин 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.***

Загалом препарат не впливає або впливає незначним чином на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Проте пацієнта необхідно проінформувати, що дуже рідко повідомлялося про випадки сонливості, які можуть впливати на здатність керувати автотранспортом або роботу з іншими механізмами.

### ***Спосіб застосування та дози.***

Перорально. Таблетки можна застосовувати незалежно від прийому їжі.

Дорослим та дітям віком від 12 років слід приймати по 1 таблетці (10 мг лоратадину) 1 раз на добу.

Для дітей у віці 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 лоратадин у вигляді сиропу.

*Пацієнти літнього віку.* Не вимагається корекції дозування людям 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 в корекції дози для пацієнтів з порушенням функції нирок.

### ***Діти.***

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

Препарат Лоратадин, таблетки, 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.* 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). 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 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 %).

*З боку імунної системи:* анафілаксія, включаючи ангіоедему.

*З боку нервової системи:* запаморочення, судоми.

*З боку серцево-судинної системи:* тахікардія, пальпітація.

*З боку шлунково-кишкового тракту:* нудота, сухість у роті, гастрит.

*З боку гепатобіліарної системи:* патологічні зміни функції печінки.

*З боку шкіри та підшкірної клітковини:* висипання, алопеція.

*Порушення загального стану і пов'язані зі способом застосування препарату:* втома.

**Термін придатності.** 4 роки.

Не застосовувати препарат після закінчення терміну придатності, зазначеного на упаковці.

### **Умови зберігання.**

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

Зберігати у недоступному для дітей місці.

### **Упаковка.**

По 10 таблеток у блістері. По 1 або 2 блістери у пачці.

**Категорія відпуску.** Без рецепта.

### **Виробник.**

ПАТ «Фармак».

**Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.**

Україна, 04080, м. Київ, вул. Фрунзе, 74.

**Дата останнього перегляду.** 15.08.2016.

**ИНСТРУКЦИЯ**  
**по медицинскому применению лекарственного средства**

**ЛОРАТАДИН**  
**(LORATADINE)**

**Состав:**

*действующее вещество:* loratadine;

1 таблетка содержит лоратадина в пересчёте на 100 % вещество (0,01 г) 10 мг;

*вспомогательные вещества:* крахмал картофельный, лактозы моногидрат, повидон, кальция стеарат.

**Лекарственная форма.** Таблетки.

*Основные физико-химические свойства:* таблетки круглой формы белого цвета с плоской поверхностью, с фаской и риской или без риски.

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

**Фармакологические свойства.**

*Фармакодинамика.*

Лоратадин – трициклическое антигистаминное средство с селективной активностью в отношении периферических H<sub>1</sub>-рецепторов.

У большинства пациентов при применении в рекомендованной дозе лоратадин не оказывает клинически значимого седативного и антихолинергического действия. В течение длительного лечения не наблюдалось клинически значимых изменений в показателях жизненно важных функций организма, лабораторных исследований, физикального обследования или электрокардиограммы. Лоратадин не имеет значимого влияния на H<sub>2</sub>-гистаминовые рецепторы. Препарат не ингибирует захват норэпинефрина и фактически не оказывает влияния на функцию сердечно-сосудистой системы или на активность водителя ритма сердца.

Исследования с проведением кожных проб на гистамин после применения 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 толерантности к действию препарата после 28 дней применения лоратадина.

Клиническая эффективность и безопасность.

Более 10000 пациентов (старше 12 лет) получали лечение лоратадином (таблетки по 10 мг) в контролируемых клинических исследованиях. Лоратадин (таблетки) в дозе 10 мг 1 раз в сутки был более эффективным, чем плацебо, и таким же эффективным, как клемастин, в отношении улучшения состояния при симптомах (назальных и не назальных) аллергического ринита. В этих исследованиях сонливость возникала с меньшей частотой при применении лоратадина, чем клемастина, и практически с такой же частотой, как и при применении терфенадина и плацебо.

Среди участников этих исследований (старше 12 лет) 1000 пациентов с хронической идиопатической крапивницей были зарегистрированы в плацебо-контролируемых исследованиях. Лоратадин в дозе 10 мг 1 раз в сутки был более эффективным, чем плацебо в лечении хронической идиопатической крапивницы, что подтверждается уменьшением зуда, эритемы и аллергической сыпи. В этих исследованиях частота сонливости была подобной при

применении лоратадина и плацебо.

Дети. Около 200 детей (с 6 до 12 лет) с сезонным аллергическим ринитом получали лоратадин (сироп) в дозах до 10 мг 1 раз в сутки в контролируемых клинических исследованиях. В другом исследовании 60 детей (с 2 до 5 лет) получали лоратадин (сироп) в дозе 5 мг 1 раз в сутки. Непредвиденные побочные реакции не наблюдались. Эффективность у детей была подобной эффективности у взрослых.

*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 метаболитом дезлоратадин является фармакологически активным и в большей мере отвечает за клинический эффект. Лоратадин и дезлоратадин достигают максимальной концентрации в плазме крови (T<sub>max</sub>) через 1-1,5 часа и 1,5-3,7 часа соответственно, после применения препарата.

Выведение. Приблизительно 40 % дозы выводится с мочой и 42 % с калом в течение 10 дней, в основном в форме конъюгированных метаболитов. Приблизительно 27 % дозы выводится с мочой в течение первых 24 часов. Менее 1 % действующего вещества выводится в неизменной активной форме – как лоратадин или дезлоратадин. У взрослых здоровых добровольцев средний период полувыведения лоратадина составлял 8,4 часа (диапазон от 3 до 20 часов), а основного активного метаболита – 28 часов (диапазон от 8,8 до 92 часов).

Нарушения функции почек. У пациентов с хроническим нарушением функции почек повышались показатели AUC и максимальной концентрации в плазме крови (C<sub>max</sub>) 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 мере от показателей у здоровых людей. У пациентов с хроническим нарушением функции печени гемодиализ не влияет на фармакокинетику лоратадина и его активного метаболита.

Нарушения функции печени. У пациентов с хроническим алкогольным поражением печени показатели AUC и C<sub>max</sub> лоратадина были в два раза выше, а 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 хронической идиопатической крапивницы и аллергического ринита.

### ***Противопоказания.***

Препарат противопоказан пациентам с повышенной чувствительностью к действующему веществу или к какому-либо другому компоненту препарата.

### ***Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.***

При применении одновременно с алкоголем эффекты лоратадина не усиливаются, что подтверждено исследованиями психомоторной функции.

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

Сообщалось о повышении концентраций лоратадина в плазме крови после одновременного применения с кетоконазолом, эритромицином и циметидином, что 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 для пациентов с тяжелой формой нарушения функции печени.

В состав препарата входит лактоза. Пациентам с такими редкими наследственными заболеваниями как непереносимость галактозы, дефицит лактазы Лаппа и мальабсорбция глюкозы-галактозы не следует применять данный препарат.

Применение препарата Лоратадин необходимо прекратить как минимум за 48 часов перед проведением кожных тестов, поскольку антигистамины могут нейтрализовать или другим образом ослаблять позитивную 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 непрямых негативных эффектов, касающихся репродуктивной токсичности. Желательно, в качестве меры безопасности, избегать применения препарата Лоратадин в период беременности.

*Кормление грудью.* Физико-химические данные свидетельствуют о выведении лоратадина/метаболитов с грудным молоком. Поскольку риск для ребенка не может быть исключен, препарат Лоратадин не следует применять в период кормления грудью.

*Фертильность.* Данные относительно влияния лоратадина на женскую или мужскую фертильность отсутствуют.

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

В общем препарат не влияет или влияет незначительным образом на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами.

Тем не менее пациента необходимо проинформировать, что очень редко сообщалось о случаях сонливости, которые могут влиять на способность управлять автотранспортом или работу с другими механизмами.

### ***Способ применения и дозы.***

Перорально. Таблетки можно применять независимо от приема пищи.

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

Для детей с 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 применять лоратадин в виде сиропа.

*Пациенты пожилого возраста.* Не требуется коррекции дозировки людям пожилого возраста.

*Пациенты с нарушением функции печени.* Пациентам с нарушениями функций печени тяжелой степени следует назначать препарат в более низкой начальной дозе, поскольку у них возможно снижение клиренса лоратадина. Для взрослых и детей с массой тела более 30 кг рекомендованная 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 установлена. Препарат Лоратадин, таблетки, 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. При передозировке рекомендовано 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 оставаться под медицинским наблюдением.

### **Побочные реакции.**

*Краткая характеристика профиля безопасности.* В клинических исследованиях с участием взрослых и подростков при применении лоратадина в рекомендованной дозе 10 мг в сутки при показаниях, включающих аллергический ринит и хроническую идиопатическую крапивницу, о побочных реакциях сообщалось у 2 % пациентов (что превышает показатель у пациентов, которые получали плацебо). 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 %). В клинических исследованиях у детей от 2 до 12 лет отмечались такие нежелательные явления как головная боль (2,7 %), нервозность (2,3 %) или утомляемость (1 %).

*Со стороны иммунной системы:* анафилаксия, включая ангиоэдему.

*Со стороны нервной системы:* головокружение, судороги.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* тахикардия, palpitation.

*Со стороны желудочно-кишечного тракта:* тошнота, сухость во рту, гастрит.

*Со стороны гепатобилиарной системы:* патологические изменения функции печени.

*Со стороны кожи и подкожной ткани:* сыпь, алопеция.

*Нарушения общего состояния и связанные со способом применения препарата:* утомляемость.

**Срок годности.** 4 года.

Не применять препарат после окончания срока годности, указанного на упаковке.

### **Условия хранения.**

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

Хранить в недоступном для детей месте.

### **Упаковка.**

По 10 таблеток в блистере. По 1 или 2 блистера в пачке.

**Категория отпуска.** Без рецепта.

### **Производитель.**

ПАО «Фармак».

### **Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.**

Украина, 04080, г. Киев, ул. Фрунзе, 74.

**Дата последнего пересмотра.** 15.08.2016.