

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування препарату

ЛОРАТАДИН-ЛХ (LORATADIN-LH)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: loratadine; етиловий ефір 4-(8-хлор-5,6-дигідро-11Н-бензол[5,6]циклогепта [1,2-*b*]піридин-11-ілідин)-1-піперидинакарбоксілової кислоти;

основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого або майже білого кольору, з рискою та фаскою;

склад: 1 таблетка містить лоратадину 0,01 г;

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

Форма випуску. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні засоби для системного застосування. Код АТС R06A X13.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Антигістамінний, антиексудативний, протисвербіжний засіб. Довгочасно діючий селективний трициклічний блокатор периферичних гістамінних H₁-рецепторів. Запобігає дії гістаміну на гладку мускулатуру і судини, зменшує проникність капілярів, гальмує ексудацію, зменшує свербіж і еритему, попереджаючи розвиток і полегшуючи перебіг алергійних реакцій. Має слабку бронхорозширювальну активність. Погано проникає крізь гематоенцефалічний бар'єр, має слабкий афінитет до гістамінових рецепторів головного мозку, внаслідок чого седативна дія і холіноблокуючі властивості відсутні.

Фармакокінетика. Після прийому внутрішньо швидко всмоктується. Прийом їжі не чинить значного впливу на фармакокінетику, але сповільнює час досягнення максимальної концентрації в крові на 1 год. Інтенсивно біотрансформується в печінці системою цитохрому P450 з утворенням активного метаболіту – дескарбоетоксилоратадину. Максимальна концентрація лоратадину в плазмі крові при прийомі натще досягається через 1,3 год, його активного метаболіту – дескарбоетоксилоратадину – через 2,5 год. При концентрації в плазмі 2,5-100 нг/мл зв'язування з білками становить 97% (активного метаболіту 73–77% при рівні 0,5-100 нг/мл). Ефект розвивається через 1–3 год, досягає максимуму через 8–12 год і зберігається не менше 24 год. Рівноважні концентрації лоратадину і його активного метаболіту в плазмі досягаються на 5-й день. При 28-денному застосуванні розвитку толерантності не спостерігається.

Період напіввиведення лоратадину – 3–20 год (у середньому – 8,4 год), активного метаболіту – 8,8–92 год (у середньому – 28 год). Об'єм розподілу лоратадину –119 л/кг, кліренс – 142–202 мл/хв/кг. Протягом 24 год 27% загальної дози виводиться із сечею у вигляді гідроксильованих метаболітів і/або кон'югатів. Через 10 діб близько 80% екскретується у вигляді метаболітів в однаковій мірі: із сечею (40%) і з фекаліями (40%).

Легко проникає в грудне молоко і створює концентрації, еквівалентні рівню в плазмі. Після прийому в дозі 40 мг близько 0,03% екскретується в молоко матері за 48 год.

У пацієнтів з хронічною нирковою недостатністю (кліренс креатиніну < 30 мл/хв) біодоступність і максимальна концентрація лоратадину і його активного метаболіту збільшуються (у середньому на 73% і 120% відповідно), середнє значення періоду

напіввиведення не змінюється і становить 7,6 год для лоратадину і 23,9 год – для дескарбоетоксилоратадину. Проведення гемодіалізу у пацієнтів з хронічною нирковою недостатністю не чинить впливу на фармакокінетику лоратадину і його активного метаболіту.

При алкогольному ураженні печінки максимальна концентрація в плазмі і біодоступність лоратадину подвоюються, а дескарбоетоксилоратадину не змінюються, період напіввиведення лоратадину становить 24 год, а його активного метаболіту – 37 год.

У літніх пацієнтів показники біодоступності і максимальної концентрації в плазмі лоратадину і дескарбоетоксилоратадину збільшуються на 50%, період напіввиведення лоратадину і його активного метаболіту становить 18,2 год (6,7–37 год) і 17,5 год (11–38 год), відповідно.

Показання для застосування. Алергійний риніт (сезонний і цілорічний), поліноз, алергійний кон'юнктивіт, хронічна ідіопатична кропив'янка, сверблячі дерматози (контактні алергодерматити, хронічна екзема), ангіоневротичний набряк, бронхіальна астма (допоміжний засіб), алергійні реакції на укуси комах, псевдоалергійні реакції на гістамінолібератори.

Спосіб застосування та дози. Призначають внутрішньо, до їди. Дорослим і дітям (старше 12 років або при масі тіла більш 30 кг) – 0,01 г (1 таблетка) 1 раз на добу. Дітям від 2 до 12 років – 0,005 г (½ таблетки) 1 раз на добу. Пацієнтам з печінковою або нирковою недостатністю призначають по 0,01 г (1 таблетка) через день або 0,005 г (½ таблетки) щодня. Тривалість прийому визначають індивідуально, звичайно курс лікування не повинен перевищувати 6 місяців, у дітей 6–12 років – 2 тижнів. Досвід прийому препарату при кропив'янці обмежує курс лікування до 4 тижнів.

Побічна дія. З боку нервової системи і органів чуття: головний біль (12%), сонливість (8%), стомлюваність (4%), у 2% і менше - порушення концентрації уваги, запаморочення, нервозність, занепокоєння, збудження (у дітей), безсоння, непритомність, амнезія, депресія, гіперкінезія, тремор, парестезія, гіпестезія, дисфонія, порушення зору, кон'юнктивіт, блефароспазм, біль в очах і вухах, шум у вухах; дуже рідко - судоми.

З боку органів ЖКТ: сухість у роті (3%), у 2% і менше – підвищення апетиту, збільшення маси тіла, анорексія, нудота, зміна саливації, зміна смакових відчуттів, зубний біль, стоматит, блювання, гастрит, метеоризм, диспепсія, запор або діарея; дуже рідко - жовтяниця, гепатит, некроз печінки.

З боку респіраторної системи: у 2% і менше – закладеність носа, чхання, сухість у носі, носова кровотеча, синусит, фарингіт, ларингіт, кашель, кровохаркання, бронхіт, бронхоспазм, біль у грудній клітці, інфекції верхніх дихальних шляхів, диспное.

З боку сечостатевої системи: зміна кольору сечі, болісні позиви до сечовипускання, дисменорея, менорагія, вагініт, ослаблення лібідо, імпотенція, дуже рідко – набряки.

З боку опорно-рухового апарату: біль у спині, артралгія, міалгія, судоми литкових м'язів. *Алергійні реакції:* гіперемія, шкірний висип, кропив'янка, дерматит, свербіж, ангіоневротичний набряк; дуже рідко – анафілаксія.

З боку серцево-судинної системи: гіпертензія або гіпотензія, відчуття серцебиття, тахікардія; дуже рідко - суправентрикулярна тахіаритмія.

Інші: сухість волосся і шкіри, спрага, астенія, нездужання, пропасниця, озноб, фотосенсибілізація, підвищена пітливість, біль у молочних залозах, збільшення маси тіла; дуже рідко – алопеція, збільшення розмірів грудної клітки, мультиформна еритема.

Протипоказання. Гіперчутливість, вагітність, годування груддю, дитячий вік до 2 років.

Передозування. *Симптоми:* головний біль, сонливість, тахікардія. У дітей з масою тіла менше 30 кг при прийомі у дозі понад 10 мг можливі екстрапірамідні розлади, підсилене серцебиття. *Лікування:* специфічні антитоди відсутні. Індукція блювання сиропом іпекакуани (застосування препаратів іпекакуани показано навіть у випадку виникнення спонтанного блювання); промивання шлунка, призначення активованого вугілля і великої кількості рідини; симптоматична і підтримуюча терапія.

Гемодіаліз є неефективним.

Особливості застосування. Прийом препарату рекомендується відмінити не менше ніж за тиждень до проведення шкірної проби на алергени. Призначення вагітним і в період лактації можливо, тільки якщо передбачувана користь для матері перевищує потенційний ризик для плоду і немовляти. Слід дотримуватися обережності при спільному призначенні препарату з інгібіторами ферментів печінки (з гуанідіном, флуконазолом, флуоксетином), тому що відсутня достатня кількість спостережень щодо безпеки подібних комбінацій.

Пацієнт повинен дотримуватись обережності при роботі з транспортними засобами або такій роботі, що вимагає підвищеної уваги, оскільки можливі запаморочення, сонливість, порушення концентрації уваги.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. Еритроміцин і кетоконазол, циметидин (інгібітори системи цитохрому Р450 печінки) збільшують концентрацію лоратадину і його активного метаболіту в крові. Лоратадин знижує рівень еритроміцину в плазмі (на 15%). У зв'язку з можливістю розвитку дозозалежного седативного ефекту слід дотримуватися обережності при одночасному призначенні лоратадину з іншими антигістамінними препаратами, барбітуратами, бензодіазепінами, агоністами опіїдних рецепторів, нейролептиками, антидепресантами, анксиолітиками, седативними, снодійними засобами, а також при застосуванні етанолу.

Умови та терміни зберігання. Зберігати в недоступному для дітей, сухому, захищеному від світла місці при температурі 15–25 С. Термін придатності – 3 роки.

Умови відпуску. Без рецепта.

Упаковка. По 10 таблеток у контурних чарункових упаковках; по 1 або 2 контурні чарункові упаковки в пачці картонній.

Виробник. ЗАТ «Лекхім-Харків».

Адреса. Україна, 61115, м. Харків, вул. 17-го Партз'їзду, 36.