

**І Н С Т Р У К Ц І Я**  
**для медичного застосування препарату**  
**ЛОРАТАДИН**  
**(LORATADINE)**

**Загальна характеристика:**

**міжнародна та хімічна назви:** loratadine; етил 4-(8-хлоро-5,6-дигідро-11Н-бензо[5,6] циклогепта [1,2-*b*]піридин-11-ілдин)-1-піперидин карбоксилат;

**основні фізико-хімічні властивості:** круглі, плоскі таблетки білого кольору, зі скошеними краями, з розподільчою рисою з одного боку, з м'ятним та ванільним запахом;

**склад:** 1 таблетка містить лоратадину 10 мг;

**допоміжні речовини:** лактоза, крохмаль кукурудзяний, натрію крохмальгліколят, крохмаль кукурудзяний (у вигляді клейстеру), крошпівідон, тальк, кремнію діоксид колоїдний безводний, магнеію стеарат, аспартам, ароматизатор м'яти перцевої та ванілі.

**Форма випуску.** Таблетки дисперговані.

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

Код АТС R06A X13.

**Фармакологічні властивості.**

**Фармакодинаміка.** Лоратадин – блокатор гістамінових H<sub>1</sub>-рецепторів, який є трициклічною сполукою. Характеризується селективним антагонізмом відносно периферичних рецепторів вказаного типу. При проведенні шкірних проб на гістамін після прийому однієї (10 мг) чи кількох доз лоратадину антигістамінний ефект відзначався через 1 - 3 год і досягав максимуму через 8 - 12 год від початку дії, тривав понад 24 год.

**Фармакокінетика.**

**Всмоктування.** При прийомі в терапевтичній дозі лоратадин швидко всмоктується і практично повністю метаболізується в організмі. Концентрації лоратадину в плазмі крові виявляються через 15 хв після прийому препарату внутрішньо. У ході клінічних досліджень поліпшення стану більшості хворих спостерігалось у перші 30 хв після прийому лоратадину. Максимальна концентрація (C<sub>max</sub>) препарату в плазмі досягається через 1 - 1,3 год, а C<sub>max</sub> активного метаболіту дезкарбоетоксилоратадину, – приблизно через 2,5 год.

При одночасному прийомі препарату з їжею підвищувалась системна біодоступність лоратадину і дезкарбоетоксилоратадину приблизно на 40% і 15% відповідно. Час досягнення C<sub>max</sub> лоратадину і дезкарбоетоксилоратадину дещо зростав (приблизно на 1 год), значення C<sub>max</sub> цих речовин в плазмі залишались без змін і ніяких клінічних проявів взаємодії лоратадину з їжею не відзначалось.

**Метаболізм.** Спостерігалась значна варіабельність фармакокінетичних даних в усіх дослідженнях лоратадину, що пов'язано зі значною різницею первинного метаболізму. Фармакокінетика лоратадину не залежить від дози (10 - 40 мг) і тривалості лікування. Практично в усіх випадках метаболіти були активніші за незмінений препарат. У дослідженнях *in vitro* на мікосомах печінки людини було виявлено, що лоратадин перетворюється на дезкарбоетоксилоратадин, головним чином, під дією цитохрому P4503A4 (CYP3A4) і меншою мірою - цитохрому P450 2D6 (CYP2D6). У присутності кетокконазолу, інгібітора CYP3A4, лоратадин перетворюється на дезкарбоетоксилоратадин здебільшого під дією CYP2D6.

**Виведення.** В середньому період напіввиведення лоратадину становить 8,4 год (3 - 20 год), дезкарбоетоксилоратадину – 28 год (8,8 - 92 год). Приблизно 80% дози лоратадину виводиться у вигляді метаболітів з сечею та калом у рівних співвідношеннях протягом 10 днів. Приблизно 27% дози виводиться з сечею протягом першої доби.

У дітей віком від 2 до 12 років після прийому препарату в дозі 10 мг фармакокінетичний профіль лоратадину був таким самим, як у дорослих.

**Показання для застосування.** Сезонний алергічний риніт і усунення симптомів, пов'язаних з цим захворюванням: чхання, свербіж слизової оболонки носа, ринорея, відчуття печіння і свербіжу в очах; шкірні захворювання алергічного походження, зокрема хронічної кропив'янки.

**Спосіб застосування та дози.** Лоратадин – диспергована таблетка, яка розчиняється в ротовій порожнині без застосування води і має приємний м'ятно-ванільний смак. Це особливо зручно в тих випадках, коли хворому необхідно прийняти ліки, не запиваючи водою (в екстремальних умовах).

Для дорослих, пацієнтів літнього віку і дітей старше 12 років рекомендована доза препарату дорівнює 10 мг 1 раз на добу. Для дітей віком від 2 до 12 років рекомендована доза становить 5 мг 1 раз на добу при масі тіла менше 30 кг, при масі тіла понад 30 кг – 10 мг 1 раз на добу. Пацієнтам з порушенням функції печінки або з нирковою недостатністю (швидкість клубочкової фільтрації – менше 30 мл/хв) початкова доза препарату становить 10 мг через день.

#### **Побічна дія.**

*З боку травної системи:* можливі (частіше у дорослих) – сухість у роті, нудота, гастрит; рідко – порушення функції печінки.

*З боку центральної нервової системи:* частіше у дорослих – головний біль, втомлюваність, сонливість; рідко у дітей – головний біль, нервовість, седативна дія.

*Алергічні реакції:* частіше у дорослих – висипи на шкірі; рідко – анафілактичні реакції.

**Протипоказання.** Підвищена чутливість до лоратадину або інших компонентів препарату. Дитячий вік до 2 років.

**Передозування.** У дорослих пацієнтів відзначались головний біль, сонливість і тахікардія при прийомі препарату в дозах 40 - 180 мг, які значно перевищують рекомендовану терапевтичну добову дозу – 10 мг. У дітей з масою тіла менше 30 кг при прийомі лоратадину понад 10 мг відзначались екстрапірамідні симптоми та прискорення серцевих скорочень.

*Лікування:* проведення симптоматичної та підтримуючої терапії. Лоратадин не виводиться з організму при гемодіалізі. Даних про виведення лоратадину при перитонеальному діалізі немає.

**Особливості застосування.** Не можна повністю виключити можливість появи судом, особливо у пацієнтів зі схильністю до них.

Якщо пацієнту потрібно провести шкірні проби, то необхідно не менше як за 48 год припинити приймання лоратадину для того, щоб уникнути хибних результатів.

*Вагітність і годування груддю:* адекватних та добре контрольованих клінічних досліджень щодо безпеки застосування лоратадину у період вагітності не проводилось. Призначення препарату у період вагітності можливе тільки тоді, коли очікувана користь від застосування лоратадину перевищує можливий ризик для плода. В експериментальних умовах на тваринах не виявлено тератогенної дії лоратадину.

Лоратадин та його метаболіт дезкарбоетоксилоратадин легко проникають у грудне молоко, де досягають концентрацій, подібних до концентрацій цих сполук у плазмі. Тому, при необхідності призначення препарату, годування груддю потрібно припинити.

Незважаючи на те, що лоратадин не є седативним антигістамінним засобом, у деяких пацієнтів може спостерігатися дозозалежний седативний ефект.

У рекомендованих дозах Лоратадин не впливає на здатність керувати транспортними засобами або іншими механізмами, що потребують підвищеної уваги і швидких психомоторних реакцій.

**Взаємодія з іншими лікарськими засобами.** При дослідженні психомоторної функції після застосування Лоратадину одночасно з алкоголем потенціюючої дії Лоратадину не виявлено.

При одночасному застосуванні Лоратадину з кетоконазолом, еритроміцином чи циметидином відзначалось підвищення концентрації Лоратадину і його метаболіту в плазмі крові, що не проявлялось

Сторінка 3 з 3. Видаєник: Державний експертний центр МОЗ України клінічно, включаючи дані електрокардіографії (ЕКГ).

**Умови та термін зберігання.** Зберігати у сухому, темному, недоступному для дітей місці при температурі не вище 30 °С. Термін придатності – 3 роки.

**Умови відпуску.** Без рецепта – таблетки № 10.  
За рецептом – таблетки № 100.

**Упаковка.** По 10 таблеток у блістері, кожний у паперовому конверті, 10 конвертів у картонній упаковці.

**Виробник.** Русан Фарма Лтд.

**Адреса.** 58-Д. Говт. Інд. Істейт, Чаркоп, Кандівалі (Вест), Мумбаї 400067, Індія.