

ЗБИРЕН ИЗВЕШТАЈ ЗА ОСОБИНИТЕ НА ЛЕКОТ

1. ИМЕ НА ЛЕКОТ

Лоратадин Лек таблети 10 mg

LORATADINE

2. КВАЛИТАТИВЕН И КВАНТИТАТИВЕН СОСТАВ

Една таблета содржи 10 mg лоратадин.

Помошни состојки: лактоза монохидрат.

Останатите помошни состојки се наведени во делот 6.1

3. ФАРМАЦЕВТСКА ФОРМА

Таблети

4. КЛИНИЧКИ ПОДАТОЦИ

4.1. Терапевтски индикации

Лоратадин Лек е индициран за превенција и третман на:

- сезонски и целогодишен алергиски ринитис
- алергиски конјуктивитис
- хронична уртикарија и други алергиски дерматолошки нарушувања

4.2 ДОЗИРАЊЕ И НАЧИН НА УПОТРЕБА

- **Возрасни и деца над 12 години:** еднаш на ден по 1 таблета.

Посебна популација

Пациенти со хепатално нарушување

Кај болни со инсуфициенција на црниот дроб терапијата се започнува со помала доза, бидејќи кај нив клиренсот на лоратадин може да е редуциран. Почетна доза од 10 mg секој втор ден се препорачува кај возрасни и деца со телесна тежина над 30 kg, а кај деца со телесна тежина од 30 kg и помалку се препорачува (5 mg), секој втор ден.

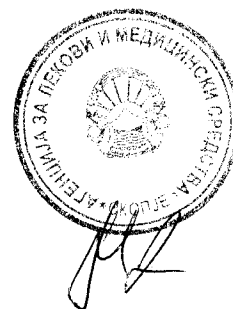
Пациенти со бубрежно нарушување

Не е потребно прилагодување на дозата.

Постари пациенти

Не е потребно прилагодување на дозата.

Педијатриска популација



- **Деца на возраст од 2 до 12 години**
телесна тежина поголема од 30 kg: еднаш на ден по 1 таблета
телесна тежина помала од 30 kg: еднаш на ден по половина таблета.

Безбедноста и ефикасноста кај деца помали од 2 години сеуште не е утврдена.

4.3 Контраиндикации

Лоратадин Лек е контраиндициран кај пациенти со позната хиперсензитивност на лоратадин или на било која од неговите состојки.

4.4 Посебни мерки на претпазливост и посебни предупредување

Претпазливост е потребна кај пациенти со сериозни хепатални оштетувања (Видете дел 4.2).

Бидејќи лоратадинот може да ги маскира резултатите на тестовите за сензитивност на кожата, неговата употреба треба да се прекине најмалку 2 дена пред започнувањето на испитувањата.

Лоратадин Лек таблетите содржат лактоза. Пациентите со ретки наследни проблеми поради нетолерантност на галактоза, Lapp-лактоза дефицит или глукозо-галактозна малапсорпција не може да го употребуваат овој лек.

4.5 Интеракции со други лекови и други форми на интеракции

Од студиите за психомоторни перформанси утврдено е дека при истовремена употреба со алкохол, лоратадинот нема потенцирачки ефект. Можно е да се појават потенцијални интеракции со сите познати CYP3A4 или CYP2D6 инхибитори, што резултира со зголемени нивоа на лоратадин (видете дел 5.2), и зголемена појава на несакани дејства.

4.6 Употреба за време на бременост и доење

Нема докази за тератогено дејство на лоратадинот кај животни. Безбедноста од употребата на лоратадин во тек на бременоста не е докажана, и затоа не се препорачува негова употреба за време на бременост.

Лоратадин се екскретира во мајчиното млеко, и поради тоа неговата употреба не се препорачува кај жени кои дојат.

4.7 Ефекти врз способноста за возење и ракување со машини

Нема податоци кои индицираат дека лоратадинот во препорачаните дози влијае на способноста за возење на моторно возило или управување со машини. Сепак пациентите треба да се предупредат дека многу ретко може да почувствуваат поспаност што може да влијае врз способноста за возење или ракување со машини.



4.8 Несакани дејства

Во клиничките испитувања кај педијатриската популација (деца на возраст од 2 до 12 години), најчесто забележани несакани дејства во споредба со плацебо биле: главоболка (2,7%), нервоза (2,3%) и умор (1%).

Во клиничките испитувања кај возрасни и адолесценти во домен на индикацијското подрачје (алергиски ринитис и хронична идиопатска уртикарија) и препорачана доза од 10mg на ден, несаканите дејства кај пациенти третирани со лоратадин биле поголеми за 2% во споредба на оние кои земале плацебо. Најчесто забележани несакани дејства во споредба со плацебо биле: сонливост (1,2%), главоболка (0,6%), зголемен апетит (0,5%) и несоница (0,1%).

Останатите несакани дејства кои многу ретко биле пријавувани во пост-маркетингшките студии се прикажани подолу.

Кај секое групирање по фреквенција, несаканите дејства се претставени по редослед на опаѓање на степенот на нивната сериозност.

Несаканите дејства по систем орган класа според MedDRA класификацијата и фреквенција кај секој систем орган класа се дефинирани како:

Многу чести: $\geq 1/10$,

чести: $\geq 1/100$ и $< 1/10$,

помалку чести: $\geq 1/1,000$ и $< 1/100$,

ретки $\geq 1/1,0000$ и $< 1/1,000$

многу ретки: $< 1/10,000$, непознати (не може да се процени од расположивите податоци).

Срцеви нарушувања:

Многу ретки: тахикардија, палпитација, ~~синкопа~~, аритмија

Нарушувања на нервниот систем:

Многу ретки: вртоглавица

Гастроинтестинални нарушувања:

Многу ретки: гадење, сува уста, гастритис

Нарушувања на кожата и подкожните ткива

Многу ретки: кожен раш, алопеција

Помалку чести: зголемен апетит

Нарушувања на имунолошкиот систем

Многу ретки: анафилакса

Хепатобилијарни нарушувања

Многу ретки: нарушена хепатална функција

Општи нарушувања на местото на апликација

Многу ретки: замор

4.9 Предозирање



Прекумерни дози може да предизвикаат зголемена инциденца на антихолинергични симптоми. Главоболка, поспаност и брзо чукање на срцето. Во случај на внесување на прекумерни дози на лоратадин, треба да се превземат симптоматски и супортивни мерки и треба да се одржуваат колку што е потребно. Може да се примени администрација на активен јаглен во форма на водена суспензија, и гастрична лаважа може да се земе предвид. Лоратадинот не се отстранува со хемодијализа и не е познато дали се отстранува по пат на перитонеална дијализа. После итниот третман на пациентот, треба да се продолжи со медицинскиот надзор.

5. ФАРМАКОЛОШКИ ПОДАТОЦИ

5.1 Фармакодинамски својства

Фармакотерапевтска група

Антихистаминици за системска употреба

Перорални антихистаминици за системска употреба, лоратадин

АТС код : R06AX13

Третманот со лоратадин е многу ефикасен кај пациенти со алергиски ринитис, уртикарија и делумно кај пациенти со астма. Лекот припаѓа на групата на неседативни антихистаминици со долго дејство со парцијална периферна селективност на хистаминскиот H1 рецептор и слаба пенетрација во ЦНС.

In vitro студиите покажале дека афинитетот на лоратадинот на холинергичните и адренергичните рецептори е ниска. *In vivo* студиите покажале дека лоратадинот нема антихолинергична активност.

Во *in vivo* студиите на морски прасиња лоратадинот се покажал како поефикасен и неговото дејство траело подолго (од 18 до 24 часа) во споредба со терфенадин (од 6 до 8 часа), астемизол, прометазин и дифенхидрамин.

Во *in vivo* студии на животни антиалергиското дејство на лоратадинот било докажано со стандардни тестови. Кај стаорци лоратадинот го инхибирал ослободувањето на хистамин од мастоцитите.

Лоратадинот не влијае на психомоторните способности. Се претпоставува дека причината е нискиот афинитет кон хистаминските рецептори во централниот нервен систем. Кај морски прасиња немало пријавено статистички важни промени на ЕКГ по единечна интравенозна администрација на лоратадин (до 100 mg/kg) што не било случај со терфенадинот.

5.2 Фармакокинетски својства

Апсорпција

По перорална администрација лоратадинот добро и брзо се абсорбира од гастроинтестиналниот тракт без оглед на фармацевтската форма. Максималните плазматски концентрации на лоратадин се постигнуваат



еден до еден час и половина по внесувањето, максималните плазматски концентрации на неговиот метаболит дескарбоетоксилоратадин малку подоцна.

Дејството на лоратадинот трае приближно 24 часа.

Фармакокинетските својства се независни од дозата, и не се менуваат значително со траењето на третманот.

Дистрибуција

Лоратадинот е во голема мера врзан, а неговиот метаболит слабо врзан за плазматските протеини. Лоратадинот и неговиот метаболит не ја минуваат крвно-мозочната бариера. Волуменот на дистрибуција е висок. Лоратадин се екскретира во мајчиното млеко со механизам на пасивна дифузија, а количината што ја поминува плацентата е минимална. Максималната количина на лоратадин се излучува во мајчиното млеко за 8 часа, но вкупниот износ е минимален. Концентрациите на лоратадин во ткивата на фетусот се помали отколку кај мајката.

Метаболизам

По пероралната администрација лоратадинот се метаболизира при првото поминување низ хепарот. Лоратадинот се метаболизира во 4 пати поактивни метаболити претежно со цитохром P450 CYP3A4 и алтернативно со цитохром CYP2D6 резултирајќи во ретка интеракција во одредени медицински продукти.

Елиминација

Полу-животот на елиминација за лоратадин е 10 часа по единечна доза, а за главниот метаболит околу 17 часа. Има разбирлива варијабилност во фармакокинетските параметри помеѓу индивидуални пациенти. Активниот метаболит се екскретира во хидроксилирана форма во урината и фецесот. Лоратадинот и неговиот активен метаболит минуваат во мајчиното млеко, меѓутоа лоратадинот може да се дава на доилки.

Фармакокинетиката на лоратадин кај деца е практично иста како и кај возрасните.

Кај постари лица и средните и максималните плазматски концентрации на лоратадин биле покачени, додека пак полу-животот на елиминација и дистрибуциониот волумен не биле. Истото се однесува и на пациентите со ренални оштетувања. Хемодијализата не влијае на фармакокинетиката на лоратадин или на неговиот активен метаболит.

Кај пациенти со цироза на хепар и максималните и средните плазматски концентрации на лоратадин се дуплирани, а полу-животот на елиминација е значително пролонгиран.

5.3 Предклинички податоци за безбедноста

Според студиите за **акутна токсичност** на Лоратадин Лек (loratadinum), заклучено е дека тој е супстанца со ниска токсичност.

По орална администрација вредноста на лоратадин LD50 кај женски глвци била 3918 mg/kg и 4779 mg/kg кај машки глвци; LD50 кај женски стаорци било 4483 mg/kg и 5738 mg/kg кај машки стаорци.



Токсичното дејство на **хроничната токсичност** било проучено во 26 неделно испитување кај WISTAR стаорци и ловечки кучиња. На глувците им било дадено орално 15, 25 и 60 mg/kg/ден, а на кучињата 12.5, 25 и 50 mg/kg/ден. Не биле забележани никакви клинички знаци на труење за време на студијата. Кај две од 3 женски кучиња се јавило гадење, атаксија и тремор. Стандардни лабораториски тестови на крвта и анализи на урината биле изведени за време на третманот. Единствената забележана промена кај машките стаорци кои примале максимална доза било покачување на вредноста на хепаталните трансаминази. Немало разлики во макроскопските и микроскопските наоди во контролната и третираната група на животни.

Студиите за **тератогеноста** биле изведени кај женски стаорци од видовите Wistar и женски зајаци од сојот New Zeland; на стаорците им биле дадени дози од 5, 15 и 45 mg/kg/ден од шестиот до шеснаесетиот ден од гестацијата, додека на зајациите им биле дадени истите дози од шестиот до дваесет и првиот ден од гестацијата. Не биле забележани никакви клинички знаци на труење за време на студијата. Највисоката доза предизвикала значително намалување на телесната тежина и помал број на живи фетуси кои биле помали и слабо витални. Нема значителни разлики во инциденцата на макроскопските и микроскопските висцерални или скелетни абнормалности меѓу контролната и третираната група на животни.

Студиите за **репродуктивност и фертилитет** биле изведени на Wistar стаорци од двата пола кои примале лоратадин во дози од 5 mg/kg/ден, 15 mg/kg/ден и 45 mg/kg/ден.

Машките стаорци биле третирани во тек на 63 дена пред парењето, а женските стаорци биле третирани во тек на 14 дена пред парењето, за време на парењето и во тек на целиот гестациски период. Кај женските стаорци била забележана повисока инциденца на фетална ресорпција и бројот на живородени бил помал. Новородените биле помали и слабо витални со повисока инциденца на морталитет за време на периодот на одбивање, со поспор телесен развој и развој во однесувањето. Способноста за репродукција била нормална.

6. ФАРМАЦЕВТСКИ ПОДАТОЦИ

6.1 Листа на ексципиенси

Лоратадин Лек таблети

Лактоза монохидрат

Пченкарен скроб

Прежелатинозен скроб

Магнезиум стеарат

6.2 Инкомпатибилност



Нема.

6.3 Рок на траење

Таблети: 4 години

6.4 Начин на чување

Таблетите се чуваат на температура до 25°C, заштитени од светлина и влага.

Лекот се чува на места достапни за деца.

6.5 Природа и содржина на пакувањето

Лоратадин Лек таблети:

- Кутија со 10 таблети од 10 mg (блистер)

7. Носител на одобрението за ставање во промет

Лек Скопје ДООЕЛ, Перо Наков бр.33, Скопје, Р.Македонија

8. Број(еви) на одобрението(јата) за ставање во промет таблети:

9. Датум на првото одобрение за ставање на лекот во промет и датум на последното обновено одобрение

23.10.1997 година, 22.08.2011 година

10. Датум на последната ревизија на текстот

Декември 2016 година

