

ЗБИРЕН ИЗВЕШТАЈ ЗА ОСОБИНТЕ НА ЛЕКОТ

1. ИМЕ НА ЛЕКОТ

Лоратадин Лек таблети 10 mg

Лоратадин Лек перорална суспензија 5 mg/ 5 ml

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

5 ml перорална суспензија (1 одмерна лажичка) содржи 5mg лоратадин.

Помошни состојки: сахароза.

Останатите помошни состојки се наведени во делот 6.1

3. ФАРМАЦЕВТСКА ФОРМА

Таблети

Перорална суспензија

4. КЛИНИЧКИ ПОДАТОЦИ

4.1. Терапевтски индикации

Лоратадин Лек е индициран за превенција и третман на:

- сезонски и целогодишен алергиски ринитис
- хронична идиопатска уртикарија
-

4.2 ДОЗИРАЊЕ И НАЧИН НА УПОТРЕБА

- **Возрасни и деца над 12 години:** еднаш на ден по 1 таблета или по 2 одмерни лажички (10 ml) суспензија.

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 возрасни и деца со телесна тежина од 30 kg и помалку се препорачува 5 ml (5mg), 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 или по 2 одмерни лажички (10 ml) суспензија.

телесна тежина помала од 30 kg: еднаш на ден по половина таблета или по 1 одмерна лажичка (5 ml) суспензија.

За деца помали од 12 години се препорачува употреба на пероралната суспензија.

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

Иако Лоратадин Лек генерално добро се поднесува, претпазливост е потребна кај пациенти со хепатални и бубрежни оштетувања.

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 гликозо-галактозна малапсорпција не може да го употребуваат овој лек.

Лоратадин Лек пероралната суспензија содржи сахароза. Пациенти со ретки наследни проблеми во однос на неподносливост на фруктоза, гликозо-галактозна малапсорпција или сахароза-изомалтоза инсуфициенција, не може да го употребуваат овој лек.

4.5 Интеракции со други лекови и други форми на интеракции

Лоратадин не го потенцира дејството на алкохол. Не постои клинички сигнификантно антихолинергично дејство, но пациентите не треба да конзумираат алкохол додека земаат лоратадин. 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 доене



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

Чести не-сериозни несакани дејства на Лоратадин Лек се главоболка, нервоза, поспаност и умор.

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%).

Во однос на честотата на појавување и телесните органи, несаканите дејства се класифицирани 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:

Чести: главоболка, нервоза, поспаност

Помалку чести: несоница

Многу ретки: вртоглавица

Гастроинтестинални нарушувања:

Многу ретки: гадење, сува уста, гастритис

Нарушувања на кожата и подкожните ткива

Многу ретки: кожен раш, алопеција



Општи нарушувања и нарушувања на местото на администрација

Чести: умор

Помалку чести: зголемен апетит

Нарушувања на имунолошкиот систем

Многу ретки: анафилакса

Хепатобилијарни нарушувања

Многу ретки: нарушена хепатална функција

4.9 Предозирање

Прекумерни дози може да предизвикаат главоболка, поспаност и брзо чукање на срцето. Овие дејства може да бидат пролонгирани. Специфичен антидот не постои.

Во случај на внесување на прекумерни дози на лоратадин, лекот треба да се отстрани од гастроинтестиналниот тракт што е можно побрзо за да се редуцира неговата апсорпција. Лоратадинот не се отстранува со хемодијализа. Третманот е симптоматски.

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. 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.



Со храна се редуцира апсорпцијата и се зголемува средната серумска концентрација на лоратадин и во помал степен на дескарбоетоксилоратадин.

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 глувци била 3918 mg/kg и 4779 mg/kg кај машки глувци; 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 WIATAR 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 трансминази. Немало разлики во макроскопските и микроскопските наоди во контролната и третираната група на животни.

Студиите за **тератогеноста** биле изведени кај женски стаорци од видовите Wiatar 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 Wiatar 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

Лоратадин Лек перорална суспензија

Арома на цреша
Микрокристална целулоза
Карбоксиметил целулоза
Полисорбат 80
Лимонска киселина монохидрат
Натриум цитрат дихидрат
Натриум бензоат
Сахароза
Глицерол
Пропилен гликол
Прочистена вода

6.2 Инкомпатибилност

Нема.

6.3 Рок на траење

Таблети: 4 години

Перорална суспензија: 4 години

6.4 Начин на чување

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

Пероралната суспензија се чува на температура до 25 °C.

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)
- Лоратадин Лек перорална суспензија: стаклено шишенце со 120 ml суспензија.

7. Носител на одобрението за ставање во промет

Лек Скопје ДООЕЛ, Перо Наков б.б., Скопје, Р.Македонија



8. Број(еви) на одобрението(јата) за ставање во промет
таблети: 15-5729/06
перорална суспензија: 15-5730/06

9. Датум на првото одобрение за ставање на лекот во промет и датум на последното обновено одобрение
23.10.1997 година, 25.10.2006 година

10. Датум на последната ревизија на текстот
Мај 2011

