

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Roletra 10 mg
Ролетра 10 мг

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1
Към РУ <u>11-2541</u> / <u>18.04.08</u>
Одобрено: <u>15/ 25.03.08</u>

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа 10 mg лоратадин (*loratadine*)

За помощни вещества виж б.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетки за перорална употреба.

Белезникаво бели кръгли, необвити таблетки със символа „R” от едната страна и „10” от другата страна.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Показания

Лоратадин е индициран за облекчаване на симптомите, асоциирани със сезонен и персистиращ, целогодишен алергичен ринит и идиопатична хронична уртикария.

4.2. Дозировка и начин на приложение

Деца над 7 годишна възраст (над 30 kg) и възрастни: 10 mg дневно (1 таблетка дневно).

Ефикасността и безопасността на лоратадин 10 mg таблетки при деца под 6 годишна възраст не е установена. Таблетките от 10 mg не са подходящи за децана възраст под 6 години.

Пациенти с тежко чернодробно увреждане следва да приемат по-ниска начална доза, поради вероятността за понижен клирънс на лоратадин. Начална доза от 10 mg през ден се препоръчва при възрастни и деца с телесна маса над 30 kg; при деца под 30 kg се препоръчва доза от 5 mg през ден.

Не се изисква корекция на дозата при пациенти в напреднала възраст или пациенти с бъбречна недостатъчност.

Таблетката може да се приеме независимо от времето за хранене.

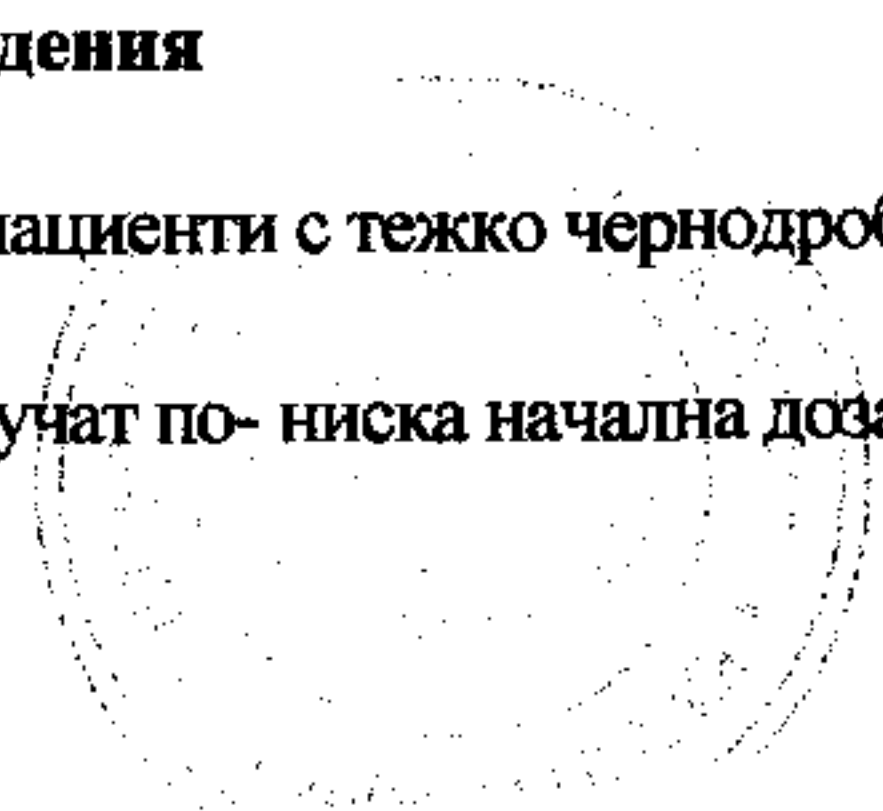
4.3. Противопоказания

Лоратадин 10 mg таблетки е противопоказан при пациенти със свръхчувствителност към активното вещество или някоя от съставките на таблетките.

4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения

Лоратадин 10 mg таблетки трябва да се прилага внимателно при пациенти с тежко чернодробно увреждане. (виж 4.2).

Пациенти с бъбречно увреждане ($GFR < 30 \mu mol/l$) следва да получат по-ниска начална доза (10 mg през ден).



Приложението на Лоратадин 10 mg таблетки следва да се прекрати за поне 48 часа преди кожен тест, тъй като антихистамините могат да предотвратят или намалят иначе позитивните реакции на кожна реактивност.

Таблетките съдържат лактоза монохидрат. Пациенти с рядка наследствена галактозна непоносимост, Lapp лактаза недостатъчност или глюкозо- галактозна малабсорбция не бива да приемат този лекарствен продукт.

4.5. Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

При проведени психомоторни проучвания не са наблюдавани потенциращи ефекти на Лоратадин 10 mg таблетки при съвместно приложение с алкохол.

Поради широкия терапевтичен индекс на лоратадин не са очаквани или наблюдавани клинично значими взаимодействия при проведените клинични изпитвания (виж 5.2).

При пациенти, приемащи перорални контрацептиви и лоратадин не се наблюдава зачестяване на нежеланите реакции.

4.6. Бременност и кърмене

Лоратадин не се препоръчва да се прилага по време на бременността. Няма опит с употребата му по време на бременност при човека. В проучвания с животни той не е показал тератогенност.

Лоратадин се екскретира в кърмата, поради което не се препоръчва да се използва при кърмачки.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Лоратадин не оказва клинично значим седативен ефект при клинични проучвания, оценяващи способността за шофиране. Обаче, пациентите следва да бъдат информирани, че в много редки случаи при някои хора може да се появи сънливост, която да повлияе способността за шофиране или работа с машини.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

В клинични проучвания на деца на възраст от 2 до 12 годишна възраст са докладвани следните обичайни нежелани реакции, различни от плацебо: главоболие (2.7 %), нервност (2.3 %) и умора (1 %).

В клинични проучвания при възрастни и подрастващи с показания обхващащи индикации като алергичен ринит и хронична идиопатична уртикария при препоръчителна доза от 10 mg дневно, нежелани лекарствени реакции с лоратадин са били докладвани при 2 % от пациентите в сравнение с тези от плацебо групата. Най- често докладваните нежелани реакции за разлика от плацебо са: сомнолентност (1.2 %), главоболие (0.6%), повишен апетит (0.5 %) и инсомния и сухота на устната лигавица (0.1%).

В допълнение на гореизброените нежелани реакции са били докладвани още:

Автономна нервна система: нарушено слъзоотделяне, нарушено слюноотделяне, енхимоза, хипоестезия, импотентност, повишено потене, жажда.

Организъмът като цяло: ангионевротичен едем, астения, бокла в гърба, замъглено виждане, болка в гръдния кош, болка в ушите и очите, треска, крампи на краката, неспокойствие, тръпки, тинитус, вирусни инфекции, покачване на телото.

Сърдечно съдова система: хипертония, хипотония, палпитации, суправентрикуларна тахикардия, синкоп, тахикардия.

Централна и периферна нервна система: блефароспазм, замайване, дисфония, хипертония, мигрена, парестезия, тремор, конвулсии и вертиго.

Гастроинтестинална система: нарушен вкус, анорексия, констипация, диария, диспепсия, флатуленция, гастрит, хълцане, увеличен апетит, гадене, стоматит, зъбобол, повръщане.

Мускуло-скелетна система: артралгия, миалгия.

Психиатрични: агитация, амнезия, тревога, объркване, намалено либидо, депресия, нарушена концентрация, инсомния, раздразнителност, паронирия.

Репродуктивна система: болка в гърдите, дисменорея, менорагия, вагинит.

Дихателна система: бронхит, бронхоспазъм, кашлица, диспнея, епистаксис, хемоптизис, ларингит, сохота на носната лигавица, фарингит, синусит, кихане.

Кожа и кожни придатъци: дерматит, суха коса и кожа, реакции на фоточувствителност, пруритус, пурпура, обрив, уртикария.

Отделителна система: нарушена миктурия, промяна в цвета на урината, уринна инконтиненция и ретенция.

В допълнение по време на марткетинга на лоратадин рядко са докладвани следните спонтанни нежелани реакции: нарушена чернодробна функция, включително жълтеница, хепатит и чернодробна некроза; алопедия; анафилаксия; уголемени гърди; еритема мултиформе, периферен едем, припадъци.

Лекарствено пристрастяване и зависимост

Няма информация, сочеща за поява на лекарствена зависимост или пристрастяване при лоратадин.

4.9. Предозиране

Предозирането с лоратадин увеличава честотата на поява на антихолинергични симптоми. Докладвани са сомнолентност, тахикардия и главоболие в случаи на предозиране с повече от 10 mg таблетна форма (40 до 80 mg). Екстрапирамидални белези и палпитации са били докладвани при деца с предозиране повече от 10 mg.

В случай на предозиране следва да се започне лечение, което да е симптоматично и поддържащо, което да трае колкото е нужно.

На пациента трябва да се предизвика повръщане, освен ако не е с нарушено съзнание.

След повръщането може да се приложи активен въглен под формата на суспензия във вода. В случай, че повръщането е недостатъчно или контраиндицирано, следва да се направи стомашен лаваж с нормален физиологичен разтвор. Солеви очистителни също могат да се използват за бързо разтваряне на чревното съдържимо. Loratadine не се премахва чрез хемодиализа и не е известно, дали лоратадин се премахва чрез перитонеална диализа. След спешното лечение пациентът трябва да остане под медицинско наблюдение.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1. Фармакодинамични данни

Фармакотерапевтична група: антихистамини- H₁ антагонист, АТС код: R06AX13.

Лоратадин- активното вещество на таблетките е трицикличен антихистамин със селективна, периферна H₁ – рецепторна активност.

Когато се прилага в препоръчителни дози при по- голяма част от хората, лоратадин не проявява клинично значими седативни или антихолинергични свойства.

По време на дългосрочно лечение не са наблюдавани клинично значими промени във виталните белези, стойностите на лабораторните тестове, физическите прегледи или електрокардиограмите.

Лоратадин не притежава никаква значима H₂- рецепторна активност. Той не инхибира захващането на норепинефрина и практически няма никакво влияние върху кардиоваскуларната функция или върху вътрешната сърдечна пейсмейкърна активност.

5.2. Фармакокинетични данни

След перорална употреба лоратадин се абсорбира бързо и добре и почти цялостно се метаболизира главно чрез CYP3A4 и CYP2D6. Основният метаболит- деслоратадин (DL) е фармакологично активен и отговорен в голяма степен за клиничния ефект. Лоратадин и DL достигат максимални плазмени концентрации (T_{max}) респективно 1- 1.5 часа и 1.5- 3.7 часа след приложение.

Покачване на плазмените концентрации на лоратадин са били докладвани след едновременно приложение с кетоназол, еритромицин и циметидин в контролирани проучвания, но без клинично

значими промени (включително електрокардиографски).

Лоратадин във висока степен (97% до 99%) се свързва с плазмените протеини, а активният му метаболит в умерена степен (73% до 76%).

При здрави индивиди времето му на полуживот на лоратадин и активния му метаболит е приблизително един и два часа респективно. Средното време на полуелиминиране при здрави индивиди е 8.4 часа (варира от 3 до 20 часа) за лоратадин и 28 часа (варира от 8.8 до 92 часа) за основния активен метаболит. Около 40 % от дозата се екскретира в урината и 42 % във фецеса в рамките на период от 10 дни основно под формата на свързани метаболити. През първите 24 часа около 27 % от дозата се елиминират в урината. По-малко от 1 % от активното вещество се екскретират непроменени в активна форма като лоратадин или DL. Параметрите на бионаличност на лоратадин и активния метаболит са пропорционални на дозата.

Фармакокинетичните параметри на лоратадин и неговите метаболити при здрави доброволци и здрави пациенти в напреднала възраст са съпоставими.

Приемът едновременно с храна може леко да забави абсорбцията на лоратадин, но без повлияване на клиничния ефект.

При пациенти с хронично бъбречно увреждане както AUC, така и върховете плазмени нива (C max) са повишени за лоратадин и метаболитите му, сравнени със същите параметри при пациенти с нормална бъбречна функция. Средното време на полуелиминиране на лоратадин и метаболитите му не е значително по различно от същото при здрави индивиди. Хемодиализата не повлиява фармакокинетиката на лоратадин и активния метаболит при индивиди с хронично бъбречно увреждане.

При пациенти с хронично алкохолно чернодробно заболяване AUC и върховете плазмени нива (C max) на лоратадин са двойни, докато фармакокинетичния профил на активния метаболит не се променя значително в сравнение със същите при пациентите с нормална чернодробна функция. Средното време на полуелиминиране за лоратадин и неговия метаболит са съответно 24 и 37 часа като нарастват с влошаването на чернодробното заболяване. Стабилни нива се достигат след петата доза лоратадин.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Предклиничните данни не показват никакъв специален риск базиран на конвенционални проучвания на безопасността, фармакологията, проучвания на токсичността с повторни дози, генотоксичността и канцерогенния потенциал.

В проучвания на репродуктивната токсичност не е наблюдаван тератогенен ефект. При пътхове с плазмени нива (AUC) 10 пъти по-високи от тези, достигнати при клинични дози обаче, се наблюдават удължено раждане и намалена жизнеспособност на новородените.

Не са получени доказателства за дразнене на мукозните мембрани след приложение на перорален лиофилизат до 12 таблетки дневно (120 mg) в торбичката на бузата на хамстери за 5 дни.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

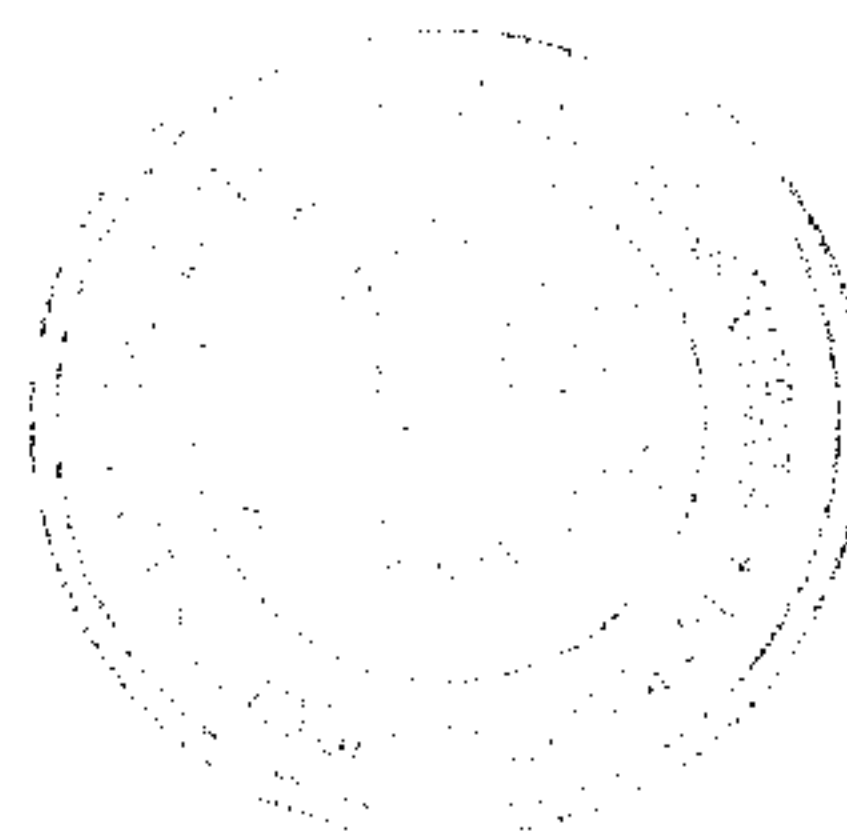
6.1. Списък на помощните вещества

Интрагрануларни съставки: mg/ tabl.

Лактоза монохидрат	78.25
Царевично нишесте	7.50
Прежелатинизирано царевично нишесте	2.00
Пречистена вода	q.s.

Екстрагрануларни съставки:

Прежелатинизирано царевично нишесте	1.50
Магнезиев стеарат	0.75



6.2. Физико-химични несъвместимости

Не са докладвани.

6.3. Срок на годност

36 месеца

6.4. Специални условия на съхранение

Да се съхранява в оригиналната опаковка.

6.5. Данни за опаковката

Блистер от PVC/ PVdC/ алуминиево фолио по 10 таблетки, кутия 3 x 10.

6.6. Препоръки при употреба

Няма.

7. ИМЕ И АДРЕС НА ПРИТЕЖАТЕЛЯ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

RANBAXY UK LIMITED
20 Balderton Street
London W1K 6TL
Великобритания

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР

20030522

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТРЕБА

21.07.2003 г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА

29.06. 2007 г.

