

Loratadin AL
Лоратадин АЛ

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА LORATADIN AL

SPC

1. Име на лекарствения продукт

Loratadin AL
Лоратадин АЛ 10

Лекарствено вещество: loratadine

2. Количествен и качествен състав лекарствено вещество:

Loratadin AL 10

Всяка таблетка съдържа: 10 mg loratadine

3. Лекарствена форма таблетки

4. Клинични данни

4.1. Показания

За облекчаване симптомите свързани с:

- алергични ринити като кихане, секреция или сърбеж в носа, парене или сърбеж в очите
- хронична уртикария като сърбеж, зачервяване и мехурчета

4.2. Дозирание и начин на употреба

Възрастни и деца на 12-17 години: Ако друго не е предписано 1 таблетка веднъж дневно.

Деца от 6-12 години с телесно тегло под 30 кг: половин таблетка дневно, а тези с тегло над 30 кг - по 1 таблетка дневно.

За продължителността на лечението ще реши лекуващия лекар. Тя обикновено зависи от клиничния курс и не трябва да превишава 6 месеца. Опитът показва, че при лечение на уртикария, продължителност от 4 седмици в много от случаите е достатъчна за отшумяване на симптомите.

Деца от 6 до 12 години не трябва да приемат лекарствения продукт по-дълго от 2 седмици.

4.3. Противопоказания

Лоратадин АЛ 10 не трябва да се приема при:

- пациенти със свръхчувствителност към лоратадин или някоя от другите съставки на продукта
- деца под 6 години

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВНОТО	
Приложено към разрешение за употреба №	1-7752/14.07.07
039/27.05.03	Мисир



4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба.

Пациенти с рядка наследствена галактозна интолерантност, наследствена лактазна недостатъчност или влошена глюкозо-галактозна абсорбция не трябва да използват този лекарствен продукт.

Особено внимателно трябва да се прилага при деца с бъбречна или чернодробна недостатъчност.

Пациенти с тежка чернодробна недостатъчност трябва да приемат намалена доза. Препоръчителната начална доза за тези пациенти е половината от обичайната (5 mg лоратадин) един път дневно или нормалната дневна доза от 10 mg лоратадин, но приемана през ден.

Употреба при деца под 6 години

Не е установена ефикасността на Лоратадин АЛ 10 при деца.

Употреба при пациенти в напреднала възраст и пациенти с чернодробна или бъбречна недостатъчност

Пациенти в напреднала възраст и пациенти с чернодробна или бъбречна недостатъчност са подложени на увеличен риск от нежелани лекарствени реакции. При такива пациенти е повишена възможността от проява на нежелани лекарствени реакции като сомноленция дори при препоръчаните дози.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Ако лоратадин се приема по време на хранене е възможно резорбцията му леко да се забави (приблизително с 1 час), но това не възпрепятства ефективността на лекарството.

Ефектът на алкохол не се увеличава при употреба на лоратадин.

Увеличаване на плазмената концентрация на лоратадин е съобщено при едновременното приемане на лоратадин и кетоконазол, еритромицин или цимитидин при проучване върху доброволци, но ефектът е без клинично значими промени (включително и електрокардиографски).

Други лекарства, известни като инхибитори на чернодробния лекарствен метаболизъм трябва да се прилагат с внимание едновременно с лоратадин, докато се установят точни данни за лекарствено взаимодействие.

Приемът на лоратадин трябва да се преустанови 48 часа преди кожен тест за алергии, т.к. може да промени достоверността на резултатите.

4.6. Бременност и кърмене

Въпреки, че не е установен тератогенен ефект на лоратадин при експериментални проучвания върху животни (виж точка 5. 3.), безопасността на Лоратадин АЛ 10 при бременност и кърмене не е установена. Ето защо този лекарствен продукт може да се използва при бременни жени, само ако евентуалната полза оправдава възможния риск за плода. Лоратадин се излъчва в майчиното мляко в концентрация, подобна на тази в плазмата на майката. По тази причина лоратадин не трябва да се приема по време на кърмене.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Лоратадин не повлиява или незначително повлиява способността за шофиране и работа с машини.



4.8. Нежелани лекарствени реакции

Препоръчителната дневна доза от 10 mg лоратадин не се свързва с клинично значим седращ ефект.

Редки съобщения (>1/10 000 и <1/1000)

умора, главоболие, сомноленция, сухота в устата, стомашно-чревни неразположения, като гаденеи гастрити, и алергични реакции като обрив.

Много редки съобщения (<1/10000), вкл. изолирани съобщения

косопад, анафилактични реакции, чернодробна дисфункция и суправентрикуларна тахиаритмия.

Могат да се срещнат и нежелани сърдечни ефекти като увеличаване на QT интервала на ЕКГ и специфична вентрикуларна тахиаритмия (torsade de pontes).

4.9. Предозиране

а) Симптоми на предозиране

Сомноленция, тахикардия и главоболие са съобщени при интоксикация с лоратадин.

Еднократно поглъщане на 160 mg лоратадин не предизвиква значими нежелани лекарствени реакции.

б) Терапевтични мерки при предозиране

Терапевтичните мерки, ако са необходими, са симптоматични: предизвикване на повръщане, прилагане на активен въглен и ако е необходимо стомашна промивка и използване на очистително.

Пациентите трябва да се наблюдават известно време след посоченото лечение.

Изотоничен разтвор на натриев хлорид се препоръчва за стомашна промивка при деца.

Лоратадин не се елиминира чрез хемодиализа. Не е известно дали лоратадин се елиминира чрез перитонеална диализа.

5. Фармакологични данни.

5.1. Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група/АТС-група R 06 AX 13

Лоратадин е трицикличен антихистамин, притежаващ селективна периферна H_1 рецепторна антагонистична активност. Проучване за действието му върху ЦНС не показват нито депресивни нито антихолинергични свойства.

Лоратадин притежава много слаб афинитет към мозъчните мембранни рецептори и почти не преминава кръвно-мозъчната бариера. Авторадиографски проучвания върху плъхове и маймуни, проучвания с радиоактивно маркиран лоратадин за разпределението му в тъканите на мишки и плъхове и ин виво проучвания върху мишки показват, че нито лоратадин нито неговите метаболити преминават мозъчно-кръвната бариера.



Проучвания върху морски свинчета за свързване към H_1 рецепторите на белите дробове и мозъчните клетки показват, че свързването се осъществява предпочитано към периферните нервни клетки вместо към тези на ЦНС.

Седирацията профил на лоратадин 10 mg дневно е сравним с този на плацебо. По време на продължително лечение, лоратадин не се свързва с никакви клинично значими промени в жизнените функции, лабораторни тестове, физически резултати или електрокардиографски параметри. Проучвания за тестване на дозирането 2 до 4 пъти над препоръчителната терапевтична доза при хора показва лек седиращ ефект.

Лоратадин няма значима H_2 рецепторна активност, не повлиява синаптичното връщане на норадреналина и практически не повлиява сърдечно-съдовата функция и сърдечната честота.

5.2. Фармакокинетични свойства

След перорален прием лоратадин се абсорбира бързо и почти изцяло се метаболизира по време на първи пасаж през черния дроб. При здрави доброволци разпределението на времето на полуживот и неговите активни метаболити е приблизително съответно 1 или 2 часа.

При здрави възрастни пациенти средното време на елиминиране е 8,4 часа (стойности между 3-20) за лоратадин и 28 часа (стойности между 8.8-92) за активните метаболити.

Първоначални данни при здрави доброволци показва средното време на полуживот във фазата на елиминиране 12.4 часа за лоратадин и 19.6 часа за неговите активни метаболити. Почти при всички пациенти обхватът на бионаличност (AUC) на метаболитите е по-висок от този на лоратадин. AUC и C_{max} на лоратадин и неговите метаболити са пропорционални на перорално приетата доза.

Лоратадин екстензивно се свързва към плазмените протеини (97-99 %), а активните метаболити се свързват около 73-76 %.

Приблизително 40 % от дозата се излъчва в урината и 42 % във фекалиите, главно под формата на конюгирани метаболити за над 10 дневен период. По време на първите 24 часа елиминирането е главно през бъбреците (26 % от дозата). Непроменен лоратадин и активни метаболити се откриват само в следи в урината.

Фармакокинетичният профил на лоратадин и неговите активни метаболити е сравним при възрастни и млади пациенти.

AUC и C_{max} на лоратадин и неговите метаболити са по-високи при пациенти с хронична бъбречна недостатъчност от колкото при тези, с нормална бъбречна функция. Средното време на полуживот на лоратадин и неговите метаболити не се различава много от това на нормални субекти.

Хемодиализата няма ефект върху фармакокинетиката на лоратадин и неговите метаболити при пациенти с хронична бъбречна недостатъчност. При пациенти с хронично, алкохолно обусловено чернодробно заболяване AUC и C_{max} на лоратадин са двойни, докато фармакокинетичният профил на метаболитите не се различава значително от този при пациенти с нормална чернодробна функция. Времето на елиминиране лоратадин и неговите метаболити е 24 часа и 37 часа респективно и се увеличава с увеличаване степеня на чернодробното заболяване.



Лоратадин и неговите активни метаболити се излъчват в майчиното мляко. На 48-я час след приема само малки количества от приетата доза (0.029 %) присъства като непроменен лоратадин или неговите активни метаболити.

Сравнително проучване за бионаличност

При сравнително рандомизирано, стеди-сеит, двустранно кръстосано проучване за бионаличност на Лоратадин АЛ 10 спрямо референтен продукт Clarityn (10 mg loratadine таблетки) на фирмата Schering-Plough при здрави доброволци (n=38) на гладно са получени следните резултати:

Сравнителна loratadine - фармакокинетика за Лоратадин АЛ 10 и референтен продукт Clarityn:

	Loratadin AL 10	Clarityn
ln AUC _{0-τ} (ng x h/ml)	6.7825	6.2091
ln C _{max} (ng/ml)	2.50833	2.29824
t _{max} (h)	1.317	1.276
C _{min} (ng/ml)	0.1546	0.1515
Flux 1 (%)= 100 (C _{max} - C _{min}) / C _{av}	880.3	847.9
Flux 2 (%)= 100 (C _{max} - C _{min}) / C _{min}	2127.4	2189.7

Аритметично средно на отношението Тест/Референтен продукт (90% конфиденциален интервал): AUC_{0-τ} (ng x h/ml) = 95.1 ÷ 125.9 %

Аритметично средно на отношението Тест/Референтен продукт (90% конфиденциален интервал): C_{max} (ng/ml) = 93.6 ÷ 127.5%

Сравнителна descarboethoxyloratadine - фармакокинетика за Лоратадин АЛ 10 и референтен продукт Clarityn:

	Loratadin AL 10	Clarityn
ln AUC _{0-τ} (ng x h/ml)	42.0648	40.9290
ln C _{max} (ng/ml)	3.93032	3.71292
t _{max} (h)	1.624	1.754
C _{min} (ng/ml)	0.9051	0.8356
Flux 1 (%)=100 (C _{max} - C _{min}) / C _{av}	181.2	176.4
Flux 2 (%)=100 (C _{max} - C _{min}) / C _{min}	400.1	409.4



Аритметично средно на отношението Тест/Референтен продукт (90% конфиденциален интервал): $AUC_{0-t} (ng \times h/ml) = 96.7 \div 108.4 \%$

Аритметично средно на отношението Тест/Референтен продукт (90% конфиденциален интервал): $C_{max} (ng/ml) = 98.2 \div 113.9\%$

5.3. Предклинични данни за безопасност

Лоратадин няма мутагенно действие.

Проучвания за туморогенен потенциал на лоратадин са проведени върху плъхове и мишки. Наблюдавани са висока хепатоцелуларна хиперплазия и хепатоцелуларен аденом. Клиничната значимост на тези данни по време на продължително използване на лоратадин не е известна.

Резултатите от проучвания за фертилност върху плъхове и зайци показват, че лоратадин не действа тератогенно. Плъхове третирани с 24 mg лоратадин на килограм не показват нежелани промени при бременност или репродукция.

6. Фармацевтични данни

6.1. Списък на помощните вещества

Lactose monohydrate, Microcrystalline cellulose, Maize starch, Magnesium stearate - лактоза монохидрат, микрокристална целулоза, царевично нишесте, магнезиев стеарат

6.2. Физико-химични несъвместимости

До момента не са познати.

6.3. Срок на годност

Срокът на годност е 4 години.

След изтичане на срока на годност, показан на опаковката, лекарството не трябва да се използва повече.

6.4. Специални условия на съхранение

няма специфични изисквания

6.5. Данни за опаковката

Алуминиев блистер от PVC

Оригинални опаковки от 7, 20, 50 и 100 таблетки

7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба

ALIUD® PHARMA GmbH & Co.KG

Gottlieb-Daimler-Str. 19

D-89150 Laichingen

Germany

E-mail: info@aliud.de

Internet: www.aliud.de

8. Регистрационен №

9. Дата на актуализация на текста



ноември 2002

10. Начин на отпускане
По лекарско предписание

