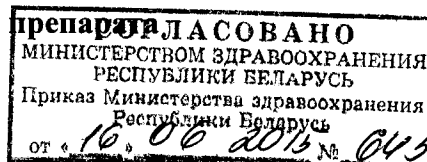


ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению

КЛАРИТИН®

CLARITINE®

**ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА**

международное и химическое названия: лоратадин; 11-[N-(этоксикарбонил)4-пиперидилиден]-8-хлоро-6,11-дигидро-5H-бензо[5,6]циклогепта[1,62-и]-пиридин;

основные физико-химические свойства: прозрачный, бесцветный или светло-желтый сироп, без посторонних включений.

СОСТАВ

1 мл сиропа содержит 1 мг лоратадина;

вспомогательные вещества: пропиленгликоль, глицерин, лимонная кислота, натрия бензоат, сахара, искусственный ароматизатор персиковый, вода очищенная.

ФОРМА ВЫПУСКА: сироп.

ФАРМАКОТЕРАПЕВТИЧЕСКАЯ ГРУППА

Антигистаминное (противоаллергическое) средство для системного применения.

КОД АТХ: R06A X13.

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА***Фармакодинамика.******Механизм действия.***

Лоратадин (активный компонент препарата Кларитин®) является трициклическим антигистамином с селективной активностью относительно периферических H₁-рецепторов.

Фармакодинамические эффекты.

У большинства пациентов при применении в рекомендованной дозе лоратадин не обладает клинически выраженными седативными (снотворными) или антихолинергическими свойствами.

При длительном лечении не наблюдалось клинически значимых изменений основных показателей жизненно важных функций, показателей лабораторных тестов, физикального осмотра или ЭКГ.

Лоратадин не обладает значимой активностью относительно H₂-рецепторов. Препарат не ингибирует захват норэпинефрина и практически не влияет на сердечно-сосудистую систему или активность водителя ритма сердца.

Исследования с проведением кожных проб на гистамин после применения разовой дозы 10 мг показали, что антигистаминный эффект возникает через 1–3 часа, достигает пика через 8–12 часов и длится более 24 часов. Не отмечалось развития устойчивости к действию препарата после 28 дней применения лоратадина.

Клиническая эффективность и безопасность.

Более 10000 человек (в возрасте 12 лет и старше) получали лечение лоратадином (таблетки по 10 мг) в контролируемых клинических исследованиях. Лоратадин (таблетки) в дозе 10 мг 1 раз в сутки был более эффективным по сравнению с плацебо и таким же эффективным как клемастин относительно улучшения при симптомах (назальных и не назальных) аллергического ринита. В этих исследованиях сонливость возникала реже при применении лоратадина, чем клемастина, и практически с такой же частотой, как и при применении терфенадина и плацебо.

Из участников этих исследований (в возрасте 12 лет и старше) 1000 человек с хронической идиопатической крапивницей были зарегистрированы в плацебо-контролируемых исследованиях. Лоратадин в дозе 10 мг 1 раз в сутки был более эффективным, чем плацебо в лечении хронической идиопатической крапивницы, что подтверждалось ослаблением зу-

да, эритемы и аллергической сыпи. В этих исследованиях частота сонливости при применении лоратадина была аналогична таковой при использовании плацебо.

Дети.

Приблизительно 200 детей (в возрасте от 6 до 12 лет) с сезонным аллергическим ринитом получали лоратадин (сироп) в дозах до 10 мг 1 раз в сутки в контролируемых клинических исследованиях. В другом исследовании 60 детей (в возрасте от 2 до 5 лет) получали лоратадин (сироп) в дозе 5 мг 1 раз в сутки. Непредусмотренных побочных реакций не наблюдалось.

Эффективность у детей была аналогичной таковой у взрослых.

Фармакокинетика.

Всасывание.

Лоратадин быстро и хорошо всасывается. Применение препарата во время еды может несколько задерживать всасывание лоратадина, однако это не оказывает никакого влияния на клинический эффект. Показатели биодоступности лоратадина и его активного метаболита пропорциональны дозе.

Распределение.

Лоратадин активно связывается (от 97 % до 99 %) с белками плазмы крови, а его активный метаболит – с умеренной активностью (от 73 % до 76 %).

У здоровых добровольцев период полураспределения лоратадина и его активного метаболита в плазме крови составляет приблизительно 1 и 2 часа, соответственно.

Биотрансформация.

После перорального применения лоратадин быстро и хорошо абсорбируется и подвергается экстенсивному метаболизму при первом прохождении через печень, главным образом при посредстве CYP3A4 и CYP2D6. Основным метаболитом дезлоратадин является фармакологически активным и в большей мере отвечает за клинический эффект. Лоратадин и дезлоратадин достигают максимальной концентрации в плазме крови (T_{max}) через 1–1,5 часа и 1,5–3,7 часов после применения, соответственно.

Выведение.

Приблизительно 40 % дозы выводится с мочой и 42 % с калом на протяжении 10 дней, в основном в форме конъюгированных метаболитов. Приблизительно 27% дозы выводится с мочой на протяжении первых 24 часов. Менее 1 % действующего вещества выводится в неизменной активной форме – как лоратадин или дезлоратадин.

У взрослых здоровых добровольцев средний период полувыведения лоратадина составлял 8,4 часа (диапазон от 3 до 20 часов), а основного активного метаболита – 28 часов (диапазон от 8,8 до 92 часов).

Нарушение функции почек.

У пациентов с хроническим нарушением функции почек повышались показатели AUC и максимальной концентрации в плазме крови (C_{max}) лоратадина и его активного метаболита по сравнению с таковыми показателями у пациентов с нормальной функцией почек. Средний период полувыведения лоратадина и его активного метаболита не отличался в значительной степени от такового показателя у здоровых людей. У пациентов с хроническим нарушением функции почек гемодиализ не влияет на фармакокинетику лоратадина и его активного метаболита.

Нарушение функции печени.

У пациентов с хроническим алкогольным поражением печени показатели AUC и C_{max} лоратадина были в два раза выше, а его активного метаболита не изменялись существенно по сравнению с таковыми показателями у пациентов с нормальной функцией печени. Период полувыведения лоратадина и его активного метаболита составляет 24 и 37 часов, соответственно, и увеличивается в зависимости от тяжести заболевания печени.

Пациенты пожилого возраста.

Показатели фармакокинетики лоратадина и его активного метаболита были аналогичными у здоровых взрослых добровольцев среднего возраста и здоровых добровольцев пожилого возраста.

Особенности фармакокинетики у детей, у пациентов с нарушениями функций сердечно-сосудистой системы не исследовались, и данные отсутствуют.

Доклинические данные по безопасности.

Данные доклинических исследований свидетельствуют об отсутствии специфического вреда для человека, что основано на общепринятых исследованиях безопасности, фармакологии, токсичности повторных доз, генотоксичности и канцерогенного потенциала.

В исследованиях репродуктивной токсичности не наблюдалось тератогенных эффектов.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

Кларитин® показан для симптоматического лечения аллергического ринита и хронической идиопатической крапивницы у взрослых и детей в возрасте от 2 лет.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗИРОВКА

Способ применения.

Перорально. Сироп можно применять независимо от приема пищи.

Дозировка.

Взрослые и дети в возрасте старше 12 лет: 10 мл (10 мг) сиропа 1 раз в сутки.

Дети.

Для детей в возрасте от 2 до 12 лет дозировка зависит от массы тела.

При массе тела более 30 кг: 10 мл (10 мг) сиропа 1 раз в сутки.

При массе тела 30 кг и меньше: 5 мл (5 мг) сиропа 1 раз в сутки.

Безопасность и эффективность препарата Кларитин® у детей в возрасте младше 2 лет не исследовались и данные отсутствуют.

Пациенты с нарушением функции печени.

Пациентам с тяжелой формой нарушения функции печени следует назначать препарат в более низкой начальной дозе, поскольку возможно снижение клиренса лоратадина. Для взрослых и детей с массой тела более 30 кг рекомендованная начальная доза составляет 10 мг через день, а для детей с массой тела 30 кг и меньше – 5 мл (5 мг) через день.

Пациенты с нарушением функции почек.

Нет необходимости в коррекции дозы для пациентов с нарушением функции почек.

Пациенты пожилого возраста.

Нет необходимости в коррекции дозы для пациентов пожилого возраста.

При пропуске приема очередной дозы препарата необходимо принять пропущенную дозу как можно быстрее, затем вернуться к привычной схеме приема. Не принимайте двойную дозу лекарства, чтобы восполнить пропущенный прием.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Краткая характеристика профиля безопасности.

В клинических исследованиях с участием взрослых и подростков при применении лоратадина в рекомендованной дозе 10 мг в сутки по показаниям, включающим аллергический ринит и хроническую идиопатическую крапивницу, о побочных реакциях сообщалось у 2 % пациентов, что превышало показатель среди пациентов, получавших плацебо. Наиболее частыми побочными реакциями, о которых сообщалось чаще, чем при применении плацебо, были: сонливость (1,2 %), головная боль (0,6 %), усиление аппетита (0,5 %) и бессонница (0,1 %).

Перечень побочных реакций.

Побочные реакции, о которых сообщалось в ходе постмаркетингового периода, указаны ниже согласно классам систем органов. Частота определена как: очень часто ($\geq 1/10$), часто (от $\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечасто (от $\geq 1/1\ 000$ до $< 1/100$), редко (от $\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1\ 000$), очень редко ($< 1/10\ 000$) и неизвестно (невозможно установить по имеющимся данным).

В каждой группе частоты побочные реакции указаны в убывающем порядке их серьезности.

Нарушения со стороны иммунной системы: очень редко – анафилаксия (включая ангио-

невротический отек).

Нарушения со стороны нервной системы: очень редко – головокружение.

Нарушения со стороны сердца: очень редко – тахикардия, сердцебиение.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: очень редко – тошнота, сухость во рту, гастрит.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: очень редко – нарушения функций печени.

Нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки: очень редко – сыпь, алопеция.

Нарушения общего состояния и связанные со способом применения препарата: очень редко – усталость.

Дети.

В клинических исследованиях с участием детей в возрасте от 2 до 12 лет возникали следующие побочные реакции, о которых сообщалось чаще, чем при применении плацебо: головная боль (2,7 %), нервозность (2,3 %) и усталость (1 %).

При появлении любой из вышеперечисленных реакций, либо реакции, не указанной в инструкции по применению, необходимо обратиться к врачу.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

Гиперчувствительность к активному веществу или любому из вспомогательных веществ.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Передозировка лоратадином повышает частоту возникновения антихолинергических симптомов. При передозировке сообщалось о сонливости, тахикардии и головной боли.

В случае передозировки следует проводить симптоматическое и поддерживающее лечение на протяжении необходимого времени. Возможно применение активированного угля в виде водной суспензии. Также можно провести промывание желудка. Лоратадин не выводится из организма при проведении гемодиализа; эффективность перитонеального диализа в выведении препарата неизвестна. После проведения неотложного лечения следует наблюдать состояние пациента.

МЕРЫ ПРЕДОСТОРОЖНОСТИ

Кларитин® следует с осторожностью применять у пациентов с тяжелой формой нарушения функции печени.

В состав препарата входит сахароза. По этой причине пациенты с такими редкими наследственными заболеваниями, как непереносимость фруктозы, мальабсорбция глюкозы-галактозы или недостаточность сахаразы-изомальтазы, не должны принимать этот препарат.

Применение препарата Кларитин® необходимо прекратить как минимум за 48 часов перед проведением кожных тестов, поскольку антигистамины могут нейтрализовать или ослаблять другим образом положительные реакции кожных проб при определении индекса реактивности.

В состав препарата входит натрия бензоат в концентрации 1,0 мг/мл. В 5 мл сиропа содержится 0,8 мг натрия.

ПРИМЕНЕНИЕ В ПЕРИОД БЕРЕМЕННОСТИ И КОРМЛЕНИЯ ГРУДЬЮ

Беременность. Данных о применении лоратадина у беременных женщин очень мало. Исследования на животных не показали прямого или непрямого отрицательного воздействия относительно репродуктивной токсичности. В целях предосторожности необходимо по возможности избегать применения препарата Кларитин® в период беременности.

Кормление грудью. Физико-химические данные свидетельствуют о выведении лоратадина/метаболитов с грудным молоком. Так как не может быть исключен риск для ребенка, Кларитин® не следует применять в период лактации.

ВЛИЯНИЕ НА СПОСОБНОСТЬ УПРАВЛЯТЬ АВТОТРАНСПОРТОМ И ДРУГИМИ МЕХАНИЗМАМИ

Кларитин® не оказывает или оказывает незначительное влияние на способность управлять автотранспортом и механизмами. Однако пациенту необходимо сообщить, что очень редко сообщалось о головокружении, что может влиять на способность управлять автотранспортом и механизмами.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

При применении одновременно с алкоголем Кларитин® не обладает потенцирующими эффектами, что подтверждено исследованиями психомоторной функции.

Потенциальное взаимодействие может иметь место при применении всех известных ингибиторов CYP3A4 или CYP2D6 с повышением уровней лоратадина, что может сопровождаться повышением частоты возникновения побочных реакций.

В контролируемых исследованиях сообщалось о повышении концентраций лоратадина в плазме крови после одновременного применения с кетоконазолом, эритромицином и циметидином без клинически значимых изменений (включая ЭКГ).

Дети.

Исследования взаимодействий проводились только с участием взрослых пациентов.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ И СРОК ГОДНОСТИ

Хранить при температуре не выше 25°C, в недоступном для детей месте.

Срок годности 3 года. Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА ИЗ АПТЕК

Без рецепта.

УПАКОВКА

Стекланный флакон по 60 мл или 120 мл, с мерной ложечкой, в картонной коробке.

ИНФОРМАЦИЯ О ПРОИЗВОДИТЕЛЕ, АДРЕС

Шеринг-Плау Лабо Н.В.,

Индустриепарк 30 Б2220, Хейст-оп-ден-Берг, Бельгия.

ВЛАДЕЛЕЦ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Байер Консьюмер Кэр АГ,

Петер Мериан-Штрассе 84, 4052 Базель, Швейцария.