

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

НАЦИОНАЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1
Към Рег. № 20030522
Изрешение № B6/MK/MK-48537
Действителен до 13-11-2019
Датум на издаване №

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Ролетра 10 mg таблетки
Roletra 10 mg tablets

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа 10 mg лоратадин (*loratadine*).

Помощни вещества: лактоза монохидрат и др.

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетка

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

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Лоратадин е показан за облекчаване на симптомите, асоциирани с алергичен ринит и идиопатична хронична уртикария.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Възрастни и деца над 6-годишна възраст с телесно тегло над 30 kg: 10 mg веднъж дневно (1 таблетка веднъж дневно).

Педиатрична популация

Деца от 6 до 12 годишна възраст – дозата се определя според теглото:

- с тегло > 30 kg: 10 mg веднъж дневно (1 таблетка дневно);
- с тегло ≤ 30 kg: таблетките от 10 mg не са подходящи за деца под 6-годишна възраст с телесно тегло под 30 kg.

Ефикасността и безопасността на лоратадин 10 mg таблетки при деца под 2-годишна възраст не са установени.

Пациенти с чернодробно увреждане

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 с тежко чернодробно увреждане.

Пациенти с бъбречно увреждане

Не се изисква корекция на дозата при пациенти с бъбречна недостатъчност.

Пациенти в старческа възраст

Не се изисква корекция на дозата при пациенти в напреднала възраст.



Начин на приложение

Перорално приложение. Таблетката може да се приема независимо от времето за хранене.

4.3 Противопоказания

Свръхчувствителност към активното вещество или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

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

Приложението на лоратадин следва да се прекрати 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-лактазна 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 при съвместно приложение с алкохол.

Потенциални взаимодействия могат да възникнат с всички известни инхибитори на CYP3A4 или CYP2D6, в резултат на което се повишават нивата на лоратадин (виж точка 5.2), което може да доведе до увеличаване на нежеланите реакции.

В контролирани изпитвания е съобщено повишение на плазмените концентрации на лоратадин при едновременната употреба с кетоконазол, еритромицин и циметидин, но без клинично значими промени (вкл. електрокардиографски).

Педиатрична популация

Проучвания за взаимодействия са провеждани само при възрастни.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Големият обем от данни за лоратадин при бременни жени (повече от 1000 получени резултата) не показват малформации, нито фето- или неонатална токсичност. Проучванията при животни не показват наличие на директни или индиректни вредни ефекти върху репродуктивната токсичност, свързани с употребата на лоратадин (вж. точка 5.3). Като предпазна мярка се препоръчва да се избягва употребата на лоратадин по време на бременност.

Кърмене

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

Фертилитет

Няма данни по отношение на мъжкия и женския фертилитет.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини



В клинични изпитвания, оценяващи способността за шофиране, не са наблюдавани отклонения при пациенти, приемащи лоратадин. Лоратадин не повлиява или повлиява пренебрежимо способността за шофиране и работа с машини. Пациентите следва да бъдат информирани обаче, 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

Резюме на профила на безопасност

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% повече пациенти в сравнение с тези от плацебо групата. Най-често докладваните нежелани реакции с различна от плацебо честота са: сомнолентност (1.2%), главоболие (0.6%), повишен апетит (0.5%) и инсомния (0.1%).

Табличен списък на нежеланите реакции

Следните нежелани реакции, съобщавани по време на постмаркетинговия период, са изброени в следващата таблица, групирани по системно-органен клас. Според честотата, те се определят като: много чести ($\geq 1/10$); чести: ($\geq 1/100$ и $< 1/10$); нечести: ($\geq 1/1000$ и $< 1/100$); редки: ($\geq 1/10,000$ и $< 1/1000$); много редки: ($< 1/10,000$), с неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка).

Системо-органен клас	Честота	Нежелана реакция
Нарушения на имунната система	Много редки	Реакции на свръхчувствителност (включително ангиоедем и анафилаксия)
Нарушения на нервната система	Много редки	Замаяност, конвулсии
Сърдечни нарушения	Много редки	Тахикардия, палпитации
Стомашно-чревни нарушения	Много редки	Гадене, сухота в устата, гастрит
Хепато-билиарни нарушения	Много редки	Абнормна чернодробна функция
Нарушение на кожата и подкожната тъкан	Много редки	Обрив, алопеция
Общи ефекти и нарушения на мястото на приложение	Много редки	Умора
Изследвания	С неизвестна честота	Увеличено телло

Педиатрична популация

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

Съобщаване на подозирани нежелани реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция към: Изпълнителна агенция по лекарствата, ул. „Дамян Груев“ № 8, 1303 София, Тел.: +35928903417, уебсайт: www.bda.bg.

4.9 Предозиране

Предозирането с лоратадин увеличава честотата на поява на симптоми, свързани с антихолинергични ефекти. Докладвани са сомнолентност, тахикардия и главоболие в случаи на предозиране.

В случай на предозиране следва да се започне лечение, което да е симптоматично и



поддържащо, и което да трае колкото е необходимо.

Може да се приложи активен въглен под формата на суспензия във вода. Може да се направи стомашен лаваж с нормален физиологичен разтвор. Лоратадин 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 СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Антихистамини - H₁-антагонисти, АТС код: R06AX13.

Механизъм на действие

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

Фармакодинамични ефекти

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

По време на дългосрочно лечение не са наблюдавани клинично значими промени в жизнените показатели, стойностите на лабораторните тестове, физикалните изследвания или електрокардиограмите.

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

Проучвания на ефекта на единична доза от 10 mg върху кожно зачервяване при тест с хистамин при хора показват, че антихистаминовите ефекти се проявяват след 1-3 часа, като достигат максимум на 8-12 час и продължават повече от 24 часа. Няма данни за развитие на толерантност към този ефект след прием на лоратадин в продължение на 28 дни.

Клинична ефикасност и безопасност

Над 10 000 участници (на възраст 12 години и повече) са лекувани с лоратадин 10 mg таблетки в контролирани клинични изпитвания. Лоратадин 10 mg таблетки веднъж дневно е бил по-ефективен спрямо плацебо и подобен на клемастин в облекчаването на назалните и неназалните симптоми на алергичен ринит. В тези проучвания сънливост е възниквала по-рядко при лоратадин в сравнение с клемастин и със същата честота в сравнение с терфенадин и плацебо.

От тези участници, 1000 пациенти с хронична идиопатична уртикария са били включени в плацебо-контролирани проучвания. Лоратадин в доза от 10 mg веднъж дневно е бил по-ефективен в сравнение с плацебо в терапията на хронична идиопатична уртикария, демонстрирано чрез намаляване на свързаните сърбеж, еритема и уртикария. В тези проучвания честотата на сънливост е сходна с тази при плацебо.

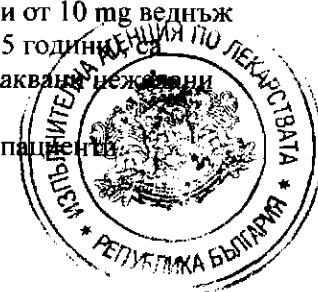
Педиатрична популация

В контролирани клинични изпитвания, около 200 педиатрични пациенти (на възраст от 6 до 12 години) със сезонен алергичен ринит, са приемали лоратадин сироп в дози от 10 mg веднъж дневно. В друго проучване, 60 педиатрични пациенти (на възраст от 2 до 5 години) приемали 5 mg лоратадин сироп веднъж дневно. Не са наблюдавани неочаквани нежелани реакции.

Ефикасността при педиатрични пациенти е сходна с тази при възрастните пациенти.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция



Лоратадин се резорбира бързо и напълно. Приемът едновременно с храна може леко да забави абсорбцията на лоратадин, но без повлияване на клиничния ефект. Параметрите на бионаличност на лоратадин и активния му метаболит са пропорционални на дозата.

Разпределение

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

При здрави индивиди времето на полуживот на лоратадин и активния му метаболит е приблизително един и два часа респективно.

Биотрансформация

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. Времето, за което лоратадин и DL достигат максимални плазмени концентрации (T_{max}), е респективно 1 - 1.5 часа и 1.5 - 3.7 часа след приложение.

Елиминиране

Средното време на полуживот 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 с урината и 42% чрез фецеса в рамките на период от 10 дни, основно под формата на свързани метаболити. През първите 24 часа около 27% от дозата се елиминира с урината. По-малко от 1% от активното вещество се екскретира непроменено в активна форма като лоратадин или DL.

Бъбречно увреждане

При пациенти с хронично бъбречно увреждане, както AUC, така и максималните плазмени концентрации (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.

Чернодробно увреждане

При пациенти с хронично алкохолно чернодробно заболяване, AUC и максималните плазмени концентрации (C_{max}) на лоратадин са удвоени, 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 е съответно 24 и 37 часа, като нарастват с влошаването на чернодробното заболяване.

Старческа възраст

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

Лоратадин и неговият активен метаболит се екскретират в млякото на кърмещи жени.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Предклиничните данни не показват никакъв особен риск, базиран на конвенционални проучвания на безопасността, фармакологията, проучвания на токсичността при многократно прилагане, генотоксичността и карциногенния потенциал.

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



6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Интрагрануларни съставки:

Лактоза монохидрат
Царевично нишесте
Царевично нишесте, прежелатинизирано
Пречистена вода

Екстрагрануларни съставки:

Царевично нишесте, прежелатинизирано
Магнезиев стеарат

6.2 Несъвместимости

Неприложимо.

6.3 Срок на годност

3 години

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява в оригиналната опаковка.

Този лекарствен продукт не изисква специални условия на съхранение.

6.5 Вид и съдържание на опаковката

Блистер от PVC/PVdC/алуминиево фолио по 10 таблетки, кутия 1 блистер x 10; 3 блистера x 10 таблетки.

Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати в продажба.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне

Няма специални изисквания.

7 ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Екофарм Груп АД
ул. Атанас Дуков №29, ет. 3
1407 София, България

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

20030522

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА



Дата на първо разрешаване: 21.07.2003 г.
Дата на последно подновяване: 18.07.2008 г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА
Септември 2019

