

SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

1. NÁZOV LIEKU

Clarinase Repetabs
5 mg/120 mg
tablety s predĺženým uvoľňovaním

2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

Každá tableta s predĺženým uvoľňovaním obsahuje 5 mg loratadínu a 120 mg pseudoefedríniumsulfátu.

Pomocné látky so známym účinkom: v každej tablete s predĺženým uvoľňovaním sa nachádza 173,23 mg sacharózy a 156,80 mg monohydrátu laktózy.

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1.

3. LIEKOVÁ FORMA

Tableta s predĺženým uvoľňovaním: okrúhla, bikonvexná, lesklá, biela, obalená tableta.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikácie

Clarinase Repetabs je indikovaný na symptomatickú liečbu sezónnej alergickej rinitídy sprevádzanej nazálnou kongesciou u dospelých a detí vo veku 12 rokov a starších.

4.2 Dávkovanie a spôsob podávania

Dávkovanie

Dospelí a deti vo veku 12 rokov a staršie:

Jednu tabletu s predĺženým uvoľňovaním Clarinase Repetabs dva krát denne zapiť s pohárom vody.

Trvanie liečby má byť čo najkratšie a po vymiznutí príznakov sa v liečbe nemá pokračovať. Odporúča sa obmedziť liečbu na približne 10 dní, pretože účinnosť pseudoefedrínu môže pri chronickom užívaní postupne klesať. Po zlepšení príznakov kongescie sliznice horných dýchacích ciest sa môže podľa potreby pokračovať v liečbe samotným loratadínom.

Pediatrická populácia

Bezpečnosť a účinnosť Clarinase Repetabs u detí mladších ako 12 rokov neboli stanovené.

K dispozícii nie sú žiadne údaje. Clarinase Repetabs sa neodporúča používať u detí mladších ako 12 rokov.

Starší pacienti

Kombinovaný liek sa nemá podávať pacientom starším ako 60 rokov. U pacientov vo veku 60 rokov alebo starších je vyššia pravdepodobnosť výskytu nežiaducich reakcií na sympatomimetické lieky (pozri časť 4.4).

Pacienti s poruchou funkcie obličiek alebo pečene

Kombinovaný liek sa nemá používať u pacientov s poruchou funkcie obličiek alebo pečene (pozri časť 4.4).

Spôsob podávania

Perorálne použitie. Tableta s predĺženým uvoľňovaním sa musí prehltnúť celá (bez drvenia, lámania alebo hryzenia). Tableta s predĺženým uvoľňovaním sa môže užívať bez ohľadu na jedlo.

4.3 Kontraindikácie

Precitlivenosť na liečivá alebo na ktorúkoľvek z pomocných látok uvedených v časti 6.1, alebo na adrenergné látky.

Keďže Clarinase Repetabs obsahuje pseudoefedrín, je tiež kontraindikovaný u pacientov, ktorí sa liečia ireverzibilným inhibítorom monoaminoxidázy (MAO) alebo u ktorých bola takáto liečba ukončená v priebehu uplynulých 2 týždňov, a u pacientov s:

- glaukómom s úzkym uhlom;
- retenciou moču;
- kardiovaskulárnymi ochoreniami, ako sú ischemická choroba srdca, tachyarytmia a závažná hypertenzia;
- hypertyreózou;
- anamnézou hemoragickej cievej mozgovej príhody alebo s rizikovými faktormi, ktoré môžu riziko hemoragickej cievej mozgovej príhody zvyšovať. Dôvodom je, že pseudoefedrín má, v kombinácii s inými vazokonstrikčnými látkami, ako sú bromokryptín, pergolid, lisurid, kabergolín, ergotamín, dihydroergotamín, alebo s inými dekongestívami, ktoré sa používajú na nazálnu dekongesciu, či už perorálne alebo do nosa (ako sú fenylpropanolamín, fenylefrín, efedrín, oxymetazolín, nafazolín), alfamimetický účinok.

4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní

Neprekračujte odporúčané dávkovanie a trvanie liečby (pozri časť 4.2).

U pacientov vo veku 60 rokov alebo starších je vyššia pravdepodobnosť výskytu nežiaducich reakcií na sympatomimetické lieky. Bezpečnosť a účinnosť kombinácie neboli v tejto populácii stanovené a nie sú dostupné dostatočné údaje umožňujúce uviesť odporúčania pre primerané dávkovanie. Kombinovaný liek sa nemá používať u pacientov starších ako 60 rokov.

Porucha funkcie obličiek alebo pečene: Bezpečnosť a účinnosť kombinácie u pacientov s poruchou funkcie obličiek alebo pečene nebola stanovená a nie sú dostupné dostatočné údaje umožňujúce uviesť odporúčania pre primerané dávkovanie. Kombinovaný liek sa nemá používať u pacientov s poruchou funkcie obličiek alebo pečene.

Pacientov treba poučiť, že v prípade hypertenzie, tachykardie, palpitácií alebo srdcových arytmií, nauzey alebo akýchkoľvek iných neurologických príznakov (ako je bolesť hlavy alebo zosilnenie bolesti hlavy) majú liečbu ukončiť.

Sympatomimetické amíny môžu spôsobovať stimuláciu centrálného nervového systému s kŕčmi alebo kardiovaskulárny kolaps sprevádzaný hypotenziou. Vyššia pravdepodobnosť výskytu týchto účinkov je u detí, starších ľudí alebo v prípadoch predávkovania (pozri časť 4.9).

V ojedinelých prípadoch sa môže pri užívaní liekov s obsahom pseudoefedrínu objaviť akútna generalizovaná exantematózna pustulóza (AGEP), forma závažnej kožnej reakcie. Ak sa objavia príznaky ako horúčka, erytém alebo malé (generalizované) pustuly, pacient má prerušiť užívanie lieku a vyhľadať lekára.

U pacientov, ktorí užívajú digitalis, majú srdcové arytmie, hypertenziu, anamnézu infarktu myokardu, diabetes mellitus, obštrukciu hrdla močového mechúra alebo pozitívnu anamnézu bronchospazmu, sa má postupovať opatrne.

U pacientov so stenotizujúcim peptickým vredom, pyloroduodenálnou obštrukciou a obštrukciou krčka močového mechúra, je potrebná opatnosť.

Perorálne podávanie pseudoefedrínu v odporúčanej dávke môže spôsobiť iné sympatomimetické účinky, ako napríklad zvýšený krvný tlak, tachykardiu alebo prejavy excitácie centrálného nervového systému.

Súbežné podávanie sympatomimetík a reverzibilných inhibítorov MAO (ako napríklad linezolid [neselektívny] a moklobemid [MAO-A selektívny]) sa neodporúča.

Opatnosť sa vyžaduje aj u pacientov, ktorí sa liečia inými sympatomimetikami, vrátane dekongestív, anorektík alebo psychostimulancií amfetamínového typu, antihypertenzívnymi látkami, tricyklickými antidepresívami a inými antihistaminikami.

Opatrne treba postupovať u pacientov liečených vazokonstrikčnými alkaloidmi ergotamínového typu.

Tak ako pri iných stimulanciách CNS, aj pri pseudoefedríniumsulfáte existuje riziko zneužívania. Zvýšené dávky môžu nakoniec viesť k toxicite. Nepretržité užívanie môže viesť k tolerancii a tým k zvýšeniu rizika predávkovania. Po rýchlom vysadení môže dôjsť k depresii.

Ak sa počas liečby nepriamymi sympatomimetikami používajú prchavé halogénované anestetiká, môže sa objaviť perioperačná akútna hypertenzia. Preto v prípade naplánovaného chirurgického zákroku, je vhodné 24 hodín pred anestéziou tú liečbu prerušiť.

Športovcov treba informovať, že liečba pseudoefedrínom môže viesť k pozitívnym dopingovým testom.

Tento liek obsahuje laktózu a sacharózu. Pacienti so zriedkavými dedičnými problémami intolerancie fruktózy, galaktózovej intolerancie, laponského deficitu laktázy, glukózo-galaktózovej malabsorpcie alebo deficitu sacharázy a izomaltázy nesmú užívať tento liek.

Podávanie Clarinase Repetabs sa má ukončiť najmenej 48 hodín pred kožnými testami, nakoľko antihistaminiká môžu zabrániť reakciám alebo zoslabiť inak pozitívne reakcie na index kožnej reaktivity.

Závažné kožné reakcie

Pri užívaní liekov s obsahom pseudoefedrínu sa môžu vyskytnúť závažné kožné reakcie, ako je akútna generalizovaná exantematózna pustulóza (AGEP). Táto akútna pustulózná erupcia sa môže vyskytnúť počas prvých 2 dní terapie s horúčkou a veľkým počtom malých, predovšetkým nefolikulárnych pustúl objavujúcich sa na rozšírenom edematóznom erytému a predovšetkým lokalizovaných na kožných záhyboch, trupe a horných končatinách. Pacient musí byť dôkladne monitorovaný. Ak sa objavia prejavy a príznaky ako sú zvýšená telesná teplota, erytém alebo veľké množstvo malých pustúl, podávanie Clarinase Repetabs sa musí ukončiť a musia byť prijaté náležité opatrenia.

Ischemická kolitída

V súvislosti s užívaním pseudoefedrínu bolo hlásených niekoľko prípadov ischemickej kolitídy. Ak sa vyskytne náhla abdominálna bolesť, rektálne krvácanie alebo iné príznaky ischemickej kolitídy, užívanie pseudoefedrínu sa má prerušiť a je potrebné vyhľadať lekársku pomoc.

Ischemická očná neuropatia

Pri pseudoefedríne boli hlásené prípady ischemickej očnej neuropatie. V prípade náhlej straty zraku alebo zníženej zrakovej ostroti, ako napríklad skotóm, sa má pseudoefedrín vysadiť.

4.5 Liekové a iné interakcie

Ako sa zistilo v štúdiách psychomotorickej výkonnosti, loratadín nezosilňuje účinky súčasne požitého alkoholu.

Preukázalo sa, že inhibítory CYP3A4 a CYP2D6 zvyšujú expozíciu loratadínu a desloratadínu. Kvôli širokému terapeutickému indexu loratadínu sa však neočakávajú žiadne klinicky významné interakcie a vo vykonaných klinických skúšaníach pri súbežnom podávaní s erytromycínom, ketokonazolom a cimetidínom, sa žiadne klinicky relevantné interakcie nepozorovali (pozri časť 5.2).

Súbežné podávanie inhibítorov monoaminoxidázy (reverzibilných alebo ireverzibilných) a sympatomimetických liekov môže spôsobiť kritické hypertenzné reakcie.

Sympatomimetické lieky môžu znižovať účinok antihypertenzívnych liekov.

Neodporúčajú sa nasledovné kombinácie:

- bromokryptín, kabergolín, lisurid, pergolid: riziko vazokonstrikcie a zvýšenia krvného tlaku;
- dihydroergotamín, ergotamín, metylergometrín: riziko vazokonstrikcie a zvýšenia krvného tlaku;
- reverzibilný a ireverzibilný inhibítor (inhibítory) MAO: riziko vazokonstrikcie a zvýšenia krvného tlaku;
- iné vazokonstrikčné látky používané na nazálnu dekongesciu perorálne alebo nazálne (ako sú fenylpropanolamín, fenylefrín, efedrín, oxymetazolín, nafazolín): riziko vazokonstrikcie.

Antacidá zvyšujú rýchlosť vstrebávania pseudoefedríniumsulfátu, kaolín ju znižuje.

Pediatrická populácia

Interakčné štúdie sa uskutočnili len u dospelých.

4.6 Fertilita, gravidita a laktácia

Gravidita

V štúdiách na zvieratách neboli loratadín, ani kombinácia loratadínu a pseudoefedrínu, teratogénne. Bezpečné užívanie Clarinase Repetabs počas gravidity sa nestanovilo, avšak skúsenosti z veľkého počtu exponovaných gravidít u ľudí neodhalili žiadne zvýšenie výskytu malformácií v porovnaní s ich výskytom v bežnej populácii.

Keďže reprodukčné štúdie na zvieratách nie sú vždy prediktívne voči reakcii u ľudí a kvôli vazokonstrikčným účinkom pseudoefedrínu, Clarinase Repetabs sa nemá užívať počas gravidity.

Laktácia

Fyzikálno-chemické údaje naznačujú vylučovanie loratadínu a pseudoefedrínu/metabolitov do ľudského mlieka. Pri pseudoefedrínovej bola u dojčiacich matiek hlásená znížená tvorba mlieka. Riziko u novorodencov/dojčiat nemôže byť vylúčené. Clarinase Repetabs sa preto nemá užívať počas laktácie.

Fertilita

Nie sú k dispozícii žiadne údaje týkajúce sa mužskej a ženskej fertility.

4.7 Ovplyvnenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

Clarinase Repetabs nemá žiadny alebo má zanedbateľný vplyv na schopnosť viesť vozidlá a obsluhovať stroje. V klinických skúšaníach, ktoré vyhodnocovali schopnosť viesť vozidlá sa u pacientov užívajúcich loratadín neobjavilo žiadne narušenie. U niektorých ľudí sa však veľmi zriedkavo objavila ospalosť, ktorá mohla ovplyvniť ich schopnosť viesť vozidlá alebo obsluhovať stroje.

Neočakáva sa, že by pseudoefedríniumsulfát zhoršoval psychomotorickú výkonnosť.

4.8 Nežiaduce účinky

Tabuľkový zoznam nežiaducich reakcií

V nasledujúcej tabuľke sú uvedené nežiaduce reakcie pre 5 mg/120 mg tablety s predĺženým uvoľňovaním hlásené navyše oproti placebo počas klinických skúšaní, podľa triedy orgánových systémov. Frekvencie sú definované ako veľmi časté ($\geq 1/10$); časté ($\geq 1/100$ až $< 1/10$); menej časté ($\geq 1/1\ 000$ až $< 1/100$); zriedkavé ($\geq 1/10\ 000$ až $< 1/1\ 000$); veľmi zriedkavé ($< 1/10\ 000$) a neznáme (nemožno odhadnúť z dostupných údajov).

Trieda orgánových systémov	Kategória frekvencie	Nežiaduce reakcie
Poruchy metabolizmu a výživy	Časté	smäd
Psychické poruchy	Časté	nervozita, somnolencia, depresia, agitácia, anorexia
	Veľmi časté	insomnia
Poruchy nervového systému	Menej časté	zmätenosť, tremor, zvýšené potenie, návaly horúčavy, porucha chuti
	Časté	závrat
Poruchy oka	Menej časté	abnormálne slzenie
Poruchy ucha a labyrintu	Menej časté	tinitus
Poruchy srdca a srdcovej činnosti	Menej časté	palpitácia
	Časté	tachykardia
Poruchy dýchacej sústavy, hrudníka a mediastína	Menej časté	epistaxa
	Časté	faryngitída, rinitída
Poruchy gastrointestinálneho traktu	Časté	zápcha, nauzea, sucho v ústach
Poruchy kože a podkožného tkaniva	Menej časté	svrbenie
Poruchy obličiek a močových ciest	Menej časté	časté močenie a porucha močenia
Celkové poruchy a reakcie v mieste podania	Časté	bolesť hlavy, únava

Iné nežiaduce reakcie, hlásené po uvedení lieku na trh, sú uvedené v nasledujúcej tabuľke.

Trieda orgánových systémov	Kategória frekvencie	Nežiaduce reakcie
Poruchy imunitného systému	Veľmi zriedkavé	reakcie z precitlivenosti (ako napríklad anafylaxia, vyrážka, urtikária a angioedém)
Poruchy nervového systému	Veľmi zriedkavé	vertigo, kŕče
Poruchy oka	Neznáme	ischemická očná neuropatia

Poruchy srdca a srdcovej činnosti	Veľmi zriedkavé	srdcové arytmie
Poruchy ciev	Veľmi zriedkavé	hypertenzia
Poruchy dýchacej sústavy, hrudníka a mediastína	Veľmi zriedkavé	kašeľ, bronchospazmus
Poruchy gastrointestinálneho traktu	Neznáme	ischemická kolitída
Poruchy pečene a žlčových ciest	Veľmi zriedkavé	abnormálna funkcia pečene
Poruchy kože a podkožného tkaniva	Veľmi zriedkavé	alopécia
	Neznáme	závažné kožné reakcie, vrátane akútnej generalizovanej exantematózne pustulózy (AGEP)
Poruchy obličiek a močových ciest	Veľmi zriedkavé	retencia moču
Laboratórne a funkčné vyšetrenia	Neznáme	zvýšená telesná hmotnosť

Ostatné nežiaduce reakcie, ktoré boli hlásené len z klinických skúšaní s loratadínom a v období po uvedení lieku na trh, zahŕňajú zvýšenú chuť do jedla, vyrážku a gastritídu.

Z postmarketingového sledovania boli pri užívaní liekov s obsahom pseudoefedrínu hlásené ojedinelé prípady akútnej generalizovanej exantematózne pustulózy (AGEP), formy závažnej kožnej reakcie.

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie po registrácii lieku je dôležité. Umožňuje priebežné monitorovanie pomeru prínosu a rizika lieku. Od zdravotníckych pracovníkov sa vyžaduje, aby hlásili akékoľvek podozrenia na nežiaduce reakcie na štátny ústav pre kontrolu liečiv, Sekcia klinického skúšania liekov a farmakovigilancie, Kvetná ul. 11, SK-825 08 Bratislava 26, Tel: + 421 2 507 01 206, e-mail: neziaduce.ucinky@sukl.sk. Tlačivo na hlásenie nežiaduceho účinku je na webovej stránke www.sukl.sk v časti Bezpečnosť liekov/Hlásenie o nežiaducich účinkoch. Formulár na elektronické podávanie hlásení: <https://portal.sukl.sk/eskadra/>.

4.9 Predávkovanie

Príznaky predávkovania

Príznaky predávkovania sú, s výnimkou mierneho útlmu, ktorý môže spôsobiť loratadín v dávkach niekoľkonásobne vyšších ako je odporúčaná dávka, prevažne sympatomimetického charakteru. Príznaky môžu byť rôzne, od útlmu CNS (sedácia, apnoe, znížená mentálna bdelosť, cyanóza, kóma, kardiovaskulárny kolaps) až po stimuláciu CNS (insomnia, halucinácie, tremor, kŕče) s možným smrteľným koncom. Iné príznaky môžu zahŕňať: bolesť hlavy, úzkosť, problém s močením, svalovú slabosť a napätie, eufóriu, excitáciu, respiračné zlyhanie, srdcové arytmie, tachykardiu, palpitácie, smäd, perspiráciu, nauzeu, vracanie, prekordiálnu bolesť, závrat, tinitus, ataxiu, rozmazané videnie a hypertenziu alebo hypotenziu. Stimulácia CNS je obzvlášť pravdepodobná u detí a prejavuje sa príznakmi podobnými atropínu (sucho v ústach, fixované dilatované zrenice, začervenanie, hypertermia a gastrointestinálne príznaky). U niektorých pacientov sa môže prejaviť toxická psychóza s delúziami a halucináciami.

Liečba predávkovania

V prípade predávkovania sa má okamžite začať so symptomatickou a podpornou liečbou a má sa v nej pokračovať tak dlho, kým je to potrebné. Možno sa pokúsiť o adsorbciu zvyšku liečiva v žalúdku podaním aktívneho uhlia vo forme suspenzie s vodou. Urobte výplach žalúdka fyziologickým roztokom, najmä u detí. U dospelých možno na výplach použiť vodu z vodovodu. Pred ďalšou instiláciou odstráňte čo najviac z podaného množstva tekutiny. Loratadín nemožno odstrániť

hemodialýzou a nie je známe, či sa dá odstrániť peritoneálnou dialýzou. Po akútnej terapii pokračujte v lekárskom monitorovaní pacienta.

Liečba predávkovania pseudoefedrínom je symptomatická a podporná. Nesmú sa použiť stimulanty (analeptiká). Hypertenziu možno kontrolovať alfablokátorom, tachykardiu betablokátorom. Na zvládnutie záchvatov sa môžu podať krátkodobo účinkujúce barbituráty, diazepam alebo paraldehyd. Hyperpyrexia, najmä u detí, môže vyžadovať kúpeľ špongiou namočenou vo vlažnej vode alebo hypotermický zábal. Apnoe sa lieči podporou ventilácie.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: antihistaminiká na systémové použitie, iné antihistaminiká na systémové použitie, ATC kód: R06AX13

Farmakoterapeutická skupina: nosové liečivá, sympatomimetiká, ATC kód: R01BA52

Mechanizmus účinku

Loratadín je tricyklické antihistaminikum so selektívnym periférnym účinkom na H₁-receptory.

Pseudoefedríniumsulfát (d-isoefedríniumsulfát) je sympatomimetická látka s prevažne α -mimetickým účinkom v porovnaní s β -aktivitou. Pseudoefedríniumsulfát má po perorálnom podaní účinok na dekongesciu nosa vďaka svojmu vazokonstrikčnému účinku. Mechanizmom nepriameho sympatomimetického účinku je predovšetkým uvoľnenie adrenergických mediátorov z postgangliových nervových zakončení.

Farmakodynamické účinky

Farmakodynamika tablet Clarinase Repetabs je priamo viazaná na jednotlivé zložky.

Keď sa loratadín podáva v odporúčanom dávkovaní nemá u väčšiny populácie klinicky významné sedatívne alebo anticholinergné vlastnosti.

Počas dlhodobej liečby sa nepozorovali žiadne klinicky významné zmeny vitálnych funkcií, hodnôt laboratórnych testov, fyzikálnych vyšetrení alebo elektrokardiogramov.

Loratadín nemá významný účinok na H₂-receptory. Neinhibuje vychytávanie noradrenalínu a prakticky nemá žiadny vplyv na kardiovaskulárnu funkciu ani na vlastnú aktivitu srdcového pacemakera.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

• Loratadín

Absorpcia

Loratadín sa rýchlo a dobre absorbuje. Súbežná konzumácia jedla môže mierne oddialiť absorpciu loratadínu, ale nemá vplyv na klinický účinok. Biologická dostupnosť loratadínu a jeho aktívneho metabolitu sú úmerné dávke.

V kontrolovaných skúšaníach bol po súbežnom použití s ketokonazolom, erytromycínom a cimetidínom hlásený vzostup plazmatických koncentrácií loratadínu. Tento však nebol sprevádzaný klinicky významnými zmenami (vrátane elektrokardiografických).

Distribúcia

Loratadín sa silno viaže na plazmatické bielkoviny (97 % až 99 %) a jeho aktívny hlavný metabolit desloratadín (DL) sa viaže stredne silno (73 % až 76 %).

Polčas distribúcie loratadínu v plazme u zdravých jedincov je približne 1 hodina, polčas distribúcie jeho aktívneho metabolitu je asi 2 hodiny.

Biotransformácia

Po perorálnom podaní loratadín podlieha extenzívnemu metabolizmu prvého prechodu pečeňou, predovšetkým prostredníctvom CYP3A4 a CYP2D6. Hlavný metabolit - desloratadín (DL) je farmakologicky aktívny a zodpovedá za veľkú časť klinického účinku. Maximálna koncentrácia loratadínu v plazme (T_{max}) sa dosiahne medzi 1 - 1,5 hodinou po podaní a maximálna plazmatická koncentrácia (T_{max}) DL sa dosiahne medzi 1,5 - 3,7 hodinami po podaní.

Eliminácia

Približne 40 % dávky sa vylúči do moču a 42 % do stolice v priebehu 10 dní, a to prevažne vo forme konjugovaných metabolitov. Približne 27 % podanej dávky sa vylúči do moču počas prvých 24 hodín. Menej ako 1 % liečiva sa eliminuje nezmenené v účinnej forme ako loratadín alebo DL.

Priemerný polčas eliminácie je 8,4 hodiny (rozsah = 3 až 20 hodín) pre loratadín a 28 hodín (rozsah = 8,8 až 92 hodín) pre jeho aktívny metabolit.

Porucha funkcie obličiek

U pacientov s chronickou poruchou funkcie obličiek sa plocha pod krivkou (AUC) aj maximálne plazmatické hladiny (C_{max}) loratadínu a jeho aktívneho metabolitu, oproti AUC a maximálnym plazmatickým hladinám (C_{max}) u pacientov s normálnou funkciou obličiek, zvýšili. V porovnaní s normálnymi jedincami sa priemerné polčasy eliminácie loratadínu a jeho aktívneho metabolitu významne nelíšili. U jedincov s chronickou poruchou funkcie obličiek nemá hemodialýza vplyv na farmakokinetiku loratadínu alebo jeho aktívneho metabolitu.

Porucha funkcie pečene

U pacientov s chronickým alkoholovým ochorením pečene boli AUC a maximálne plazmatické hladiny (C_{max}) loratadínu dvojnásobné, zatiaľ čo farmakokinetický profil aktívneho metabolitu nebol významne odlišný od farmakokinetického profilu u pacientov s normálnou funkciou pečene. Polčas eliminácie loratadínu bol 24 hodín, jeho aktívneho metabolitu 37 hodín a zvyšoval sa so vzrastajúcou závažnosťou ochorenia pečene.

Starší pacienti

Farmakokinetický profil loratadínu a jeho metabolitov je porovnateľný u zdravých dospelých dobrovoľníkov a u zdravých dobrovoľníkov vyššieho veku.

• Pseudoefedríniumsulfát

Absorpcia

Po perorálnom podaní sa pseudoefedríniumsulfát rýchlo a kompletne absorbuje. Nástup účinku sa objavuje počas 30 minút a dávka 60 mg má dekongestívny účinok trvajúci 4 až 6 hodín.

Jedlo môže zvýšiť množstvo absorbovaného loratadínu, avšak bez klinicky významných výsledkov. Zvýšenie absorpcie jedlom sa u pseudoefedrínu nepozorovalo.

Distribúcia

Predpokladá sa, že pseudoefedrín prechádza placentou a hematoencefalickou bariérou.

Liečivo sa vylučuje do materského mlieka dojčiacich žien.

Biotransformácia

Pseudoefedríniumsulfát podlieha nekompletnému hepatálnemu metabolizmu N-demetyláciou na inaktívny metabolit.

Eliminácia

Polčas eliminácie u ľudí je, pri pH moču približne 6, v rozsahu 5 až 8 hodín. Liečivo a jeho metabolit sa vylučujú močom, 55 – 75 % podanej dávky sa vylúči v nezmenenej forme. Pri kyslom moči (pH 5)

je vylučovanie rýchlejšie a trvanie účinku kratšie. V prípade alkalizácie moču dochádza k čiastočnej resorpcii.

5.3 Predklinické údaje o bezpečnosti

Predklinické údaje pre loratadín na základe obvyklých štúdií bezpečnosti, farmakológie, toxicity po opakovanom podaní, genotoxicity a karcinogénneho potenciálu neodhalili žiadne osobitné riziko pre ľudí.

Toxicita kombinácie: Kombinácia loratadín/pseudoefedríniumsulfát vykazovala počas štúdií s jednorazovým a opakovaným podaním nízky stupeň toxicity. Toxicita kombinácie nebola vyššia ako toxicita jej jednotlivých zložiek a pozorované účinky všeobecne súviseli s pseudoefedrínom.

V štúdiách reprodukčnej toxicity loratadínu sa nepozorovali teratogénne účinky. U potkanov sa však pri plazmatických hladinách (AUC) 10-krát vyšších, ako sú hladiny, ktoré sa dosiahnu po klinických dávkach, pozorovalo predĺženie pôrodu a znížená životaschopnosť potomstva.

Počas štúdií reprodukčnej toxicity nebola kombinácia loratadín/pseudoefedrín, pri perorálnom podávaní potkanom v dávkach až do 150 mg/kg/deň (30-násobok navrhovanej klinickej dávky) a králikom v dávkach až do 120 mg/kg/deň (24-násobok navrhovanej klinickej dávky), teratogénna.

6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

6.1 Zoznam pomocných látok

Jadro:

monohydrát laktózy
kukuričný škrob
povidón (E1201)
magnéziumstearát

Filmový obal:

arabská guma (E414)
bezvodý síran vápenatý (E516)
dihydrát síranu vápenatého (E516)
karnaubský vosk (E903)
mikrokryštalická celulóza
kyselina olejová
kolofónia
liečivé mydlo
sacharóza
mastenec (E553b)
oxid titaničitý(E171)
biely vosk (E901)
zeín

6.2 Inkompatibility

Neaplikovateľné.

6.3 Čas použiteľnosti

2 roky.

6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

Uchovávajúte pri teplote do 25 °C. Uchovávajúte v pôvodnom blistrovom obale na ochranu pred vlhkosťou. Neuchovávajúte v mrazničke.

6.5 Druh obalu a obsah balenia

Balené v oPA-Al-PE/LDPE-Al blistri. Blistrové pásové balenia sú balené v škatuliach vo veľkostiach balenia po 7 alebo 14 tabliet.

Na trh nemusia byť uvedené všetky veľkosti balenia.

6.6 Špeciálne opatrenia na likvidáciu

Nepoužitý liek alebo odpad vzniknutý z lieku sa má zlikvidovať v súlade s národnými požiadavkami.

7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCII

Bayer, spol. s r.o.
Karadžičova 2
811 09 Bratislava
Slovenská republika

8. REGISTRAČNÉ ČÍSLO

24/0163/95-S

9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE/PREDĹŽENIA REGISTRÁCIE

Dátum prvej registrácie: 5. apríla 1995
Dátum posledného predĺženia registrácie: 10. marca 2008

10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

Jún 2020