

## КРАТКАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ПРЕПАРАТА

### 1. НАЗВАНИЕ МЕДИЦИНСКОГО ПРЕПАРАТА

**ЭРОЛИН® таблетки 10 мг**

**Международное непатентованное название (МНН):** лоратадин

### 2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: лоратадин.

Одна таблетка содержит 10 мг лоратадина.

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (63,8 мг в каждой таблетке).

Полный перечень вспомогательных веществ представлен в разделе 6.1.

### 3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки для приема внутрь.

Круглые плоские таблетки с фаской, с гравировкой в виде стилизованной буквы Е и цифры 531 на одной стороне и риской – на другой стороне, белого или почти белого цвета, без или почти без запаха.

С помощью риски таблетку можно разделить на 2 равные дозы.

### 4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

#### 4.1. Показания к медицинскому применению

Симптоматическое лечение аллергического ринита и идиопатической хронической крапивницы.

#### 4.2. Способ применения и режим дозирования

##### Режим дозирования

*Взрослые и подростки старше 12 лет*

Рекомендуемая доза 10 мг лоратадина (1 таблетка) один раз в день.

##### *Дети*

Детям в возрасте от 2 до 12 лет препарат назначается на основании массы тела пациента:

- детям в возрасте от 6 до 12 лет с массой тела менее 30 кг: 5 мг ( $\frac{1}{2}$  таблетки) один раз в день;
- детям в возрасте от 6 до 12 лет с массой тела более 30 кг: 10 мг (1 таблетка) один раз в день.

Детям в возрасте от 2 до 6 лет адекватная доза лоратадина рекомендуется только в форме сиропа.

Препарат Эролин® не рекомендуется детям до 2 лет.

Эффективность и безопасность таблеток не изучали у детей младше 2 лет, такие данные отсутствуют.

##### **Специальные группы пациентов**

##### *Пожилые*

Нет необходимости коррекции дозы у пожилых пациентов.

##### *Пациенты с нарушениями функции почек*

Нет необходимости коррекции дозы у пациентов с нарушениями функции почек.

##### *Пациенты с нарушениями функции печени*

У пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени лечение следует начинать с более низких доз, так как у этих пациентов клиренс лоратадина понижен. Рекомендуемая начальная доза для взрослых и детей с весом тела более 30 кг составляет 10 мг, но через день. Для детей с массой тела 30 кг и менее рекомендуемая начальная доза составляет 5 мг ( $\frac{1}{2}$  таблетки) через день.

Если эффект недостаточен, дозу можно постепенно повышать до достижения обычной рекомендуемой дозы.

#### Способ применения

Таблетки для приема внутрь.

Таблетки Эролин® следует принимать целиком, не разжевывая, запивая водой или другой жидкостью.

Таблетки Эролин® можно принимать независимо от приема пищи.

### **4.3. Противопоказания для медицинского применения**

Гиперчувствительность к действующему веществу или любому из вспомогательных веществ, приведенных в разделе 6.1.

### **4.4. Особые указания и меры предосторожности при медицинском применении**

При тяжелых нарушениях функции печени препарат следует назначать с особой осторожностью (см. раздел 4.2).

Как и в случае приема других антигистаминных препаратов, больным рекомендуют прекратить прием этого препарата по крайней мере за 48 часов до проведения запланированной кожной аллергической пробы (Prick-теста), так как антигистаминные препараты могут полностью тормозить или понизить положительную кожную реакцию на антигены.

Так как препарат Эролин® таблетки 10 мг содержит лактозы моногидрат, то его не следует назначать пациентам с редкими наследственными нарушениями толерантности к галактозе, полным наследственным дефицитом лактозы сами или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции.

### **4.5 Взаимодействие с другими лекарственными препаратами или пищевыми продуктами**

Исследования по оценке психомоторных реакций показали, что при совместном применении лоратадина с алкоголем лоратадин не потенцирует эффект алкоголя.

Имеется возможность взаимодействия лоратадина со всеми известными ингибиторами цитохромов CYP3A4 и CYP2D6 с повышением уровня лоратадина (см. раздел 5.2), что может привести к повышению побочных реакций.

В клинических контролируемых исследованиях при совместном применении с кетоконазолом, эритромицином и циметидином наблюдалось повышение концентрации лоратадина в плазме крови, однако, эти изменения (включая изменения ЭКГ) не были клинически значимы.

#### Дети и подростки

Исследования проводились только с участием взрослых.

### **4.6. Фертильность, беременность и грудное вскармливание**

В экспериментах на животных не было выявлено тератогенного эффекта препарата.

#### Беременность

Большое количество данных по применению лоратадина у беременных женщин (более 1000) указывает, что лоратадин не вызывает врожденных аномалий и не обладает токсическим действием на плод или новорожденного. В экспериментах на животных не было выявлено непосредственных или косвенных неблагоприятных эффектов на репродуктивную токсичность (см. раздел 5.3). Тем не менее, в целях предосторожности, рекомендуется избегать приема препарата Эролин во время беременности.

#### Грудное вскармливание

Лоратадин выделяется в грудное молоко, таким образом применение лоратадина кормящим матерям не рекомендуется.

#### Фертильность

Отсутствуют данные о влиянии препарата на фертильность мужчин и женщин.

#### 4.7 Влияние лекарственного препарата на способность к управлению транспортными средствами и работы с механизмами

В клинических исследованиях, оценивающих способность к управлению транспортными средствами у пациентов, принимавших лоратадин, не выявили нарушений. Лоратадин не влияет или оказывает лишь незначительное влияние на способность управлять автотранспортом и работу с механизмами. Тем не менее, пациентов следует информировать о том, что в очень редких случаях может развиваться сонливость, которая может повлиять на способность к управлению транспортными средствами и работы с механизмами.

#### 4.8 Возможные побочные реакции при медицинском применении лекарственного препарата

##### Резюме профиля безопасности

В клинических исследованиях, проведенных у взрослых и подростков с применением лоратадина в рекомендуемой дозе (10 мг/сутки) при различных показаниях, в том числе и при аллергическом рините и хронической идиопатической крапивнице, было показано, что у 2% пациентов, получавших препарат, побочные реакции наблюдались более часто, чем в группе плацебо. По сравнению с плацебо, наиболее частыми побочными эффектами ( $\geq 1/10$ ) являлись сонливость (1,2%), головная боль (0,6%), повышение аппетита (0,5%) и бессонница (0,1%).

##### Табличное резюме нежелательных реакций

Другие очень редко встречающиеся побочные эффекты ( $< 1/10\ 000$ ), наблюдавшиеся в пострегистрационном периоде, представлены в таблице:

| Системы классов органов                            | Частота            | Побочная реакция                                                             |
|----------------------------------------------------|--------------------|------------------------------------------------------------------------------|
| Нарушения со стороны иммунной системы              | Очень редко        | Реакции гиперчувствительности, включая ангионевротический отек и анафилаксию |
| Нарушения со стороны нервной системы               | Очень редко        | Головокружение, судороги                                                     |
| Нарушения со стороны сердца                        | Очень редко        | Тахикардия, ощущение сильного сердцебиения                                   |
| Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта    | Очень редко        | Тошнота, сухость во рту, гастрит                                             |
| Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей | Очень редко        | Нарушения функции печени                                                     |
| Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей       | Очень редко        | Сыпь, алопеция                                                               |
| Общие расстройства и нарушения в месте введения    | Очень редко        | Усталость                                                                    |
| Результаты лабораторных исследований:              | Частота неизвестна | Увеличение массы тела                                                        |

##### Дети

В клинических исследованиях, проведенных у детей в возрасте от 2 до 12 лет, частота таких побочных реакций как головная боль (2,7%), нервозность (2,3%) и усталость (1%) превосходила таковую в группе плацебо.

##### **Сообщения о предполагаемых побочных реакциях**

Предоставление данных о предполагаемых побочных реакциях препарата является очень важным моментом, позволяющим осуществлять непрерывный мониторинг соотношения риск/польза лекарственного средства. Медицинским работникам следует предоставлять информацию о любых предполагаемых неблагоприятных реакциях по указанным в конце инструкции контактам, а также через национальную систему сбора информации.

#### 4.9 Симптомы передозировки и меры по оказанию помощи при передозировке.

Симптомы: при передозировке лоратадин вызывает парасимпатолитические симптомы. При передозировке отмечены сонливость, тахикардия, головная боль.

Лечение: специфические антидоты отсутствуют. Необходимо как можно быстрее начинать общую поддерживающую и симптоматическую терапию. Терапию следует продолжать, пока это необходимо. Можно применять водную суспензию активированного угля. Может быть полезным промывание желудка. Лоратадин не выводится при гемодиализе. Отсутствуют данные о выведении лоратадина методом перитонеального диализа. После проведения неотложных мероприятий больные нуждаются в медицинском наблюдении.

### 5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

#### Фармакологическая группа:

Антигистаминные средства для системного применения; прочие антигистаминные средства для системного применения.

Код АТХ: R06AX13

#### 5.1. Фармакодинамические свойства

##### Механизм действия

Действующим веществом препарата Эролин® таблетки 10 мг является лоратадин –избирательный трициклический блокатор периферических гистаминовых H<sub>1</sub>-рецепторов.

##### Фармакодинамический эффект

При применении в рекомендуемых дозах у большинства пациентов лоратадин не обладает клинически значимыми седативными или парасимпатолитическими свойствами.

При продолжительном применении не наблюдалось изменения физиологических функций, результатов физикального обследования, лабораторных показателей и ЭКГ.

Лоратадин не оказывает выраженного эффекта на рецепторы H<sub>2</sub>. Он не блокирует обратный захват норадреналина и практически не влияет на функцию сердечно-сосудистой системы и на водитель сердечного ритма.

В исследованиях влияния 10 мг лоратадина на вызванные гистамином отек и покраснение кожи ("wheal and flare") у человека было показано, что лоратадин значительно тормозил развитие этой кожной реакции. Антигистаминные эффекты проявлялись через 1-3 часа после приема препарата и достигали максимума через 8-12 часов. Эффект продолжался в течение 24 часов. Не наблюдалось развития толерантности к лоратадину после приема препарата на протяжении 28 дней.

##### Клиническая эффективность и безопасность

В контролируемых клинических исследованиях, в которых участвовало более 10,000 человек (в возрасте 12 лет и старше) получали лоратадин таблетки 10 мг. С точки зрения улучшения назальных и неназальных симптомов ринита, лоратадин (таблетки 10 мг один раз в день) превосходил эффект плацебо и был сопоставим с эффектом клемастина. В этом исследовании в группе лоратадина сонливость проявлялась реже, чем при применении клемастина, и ее частота была сопоставима с таковой при применении плацебо и терфенадина.

Среди участников в возрасте от 12 лет и старше 1000 пациентов с хронической идиопатической крапивницей были включены в исследования с контролем плацебо. Лоратадин в дозе 10 мг один раз в день превосходил эффект плацебо по улучшению симптомов хронической идиопатической крапивницы, таких как зуд, эритема, уртикарные кожные высыпания. В данных исследованиях частота появления сонливости в группе, получавшей лоратадин превышала была сходна с таковой в группе плацебо.

##### Дети и подростки

В педиатрическом исследовании с участием около 200 пациентов в возрасте 6-12 лет с сезонным аллергическим ринитом, пациентам назначался лоратадин в форме сиропа в дозе 10 мг один раз в день. В другом исследовании 60 больных детей в возрасте 2-5 лет получали лоратадин сироп в дозе 5 мг один раз в день. Неожиданных побочных эффектов не наблюдалось.

Эффективность лоратадина в педиатрических исследованиях была сходна с таковой, наблюдаемой у взрослых.

## **5.2. Фармакокинетические свойства**

### *Всасывание*

Лоратадин после приема внутрь быстро всасывается из желудочно-кишечного тракта. При приеме препарата во время еды всасывание лоратадина в незначительной мере замедляется, что не влияет на его клиническую эффективность.

Биоусвояемость лоратадина и его активного метаболита пропорциональна дозе.

Максимальная концентрация лоратадина в сыворотке отмечается через 1-1,5 часов, а его активного метаболита – через 1,5-3,7 часа.

### *Распределение*

Общее связывание лоратадина с белками плазмы крови составляет 97-99%, тогда как его активный метаболит связывается с белками на 73-77%.

У здоровых добровольцев 50% снижение концентрации лоратадина и его активного метаболита на 50%, связанное с их распределением, соответственно наблюдается через 1 и 2 часа после приема препарата.

### *Биотрансформация*

Лоратадин в значительной мере подвергается предсистемному метаболизму. Лоратадин практически полностью метаболизируется в печени под влиянием изоферментов CYP3A4 и CYP2D6. Главный фармакологически активный метаболит лоратадина – дезлоратадин (ДЛ) ответственен за значительную часть клинических эффектов препарата.

### *Выведение*

40% и 42% всей введенной дозы выводится в течение 10 дней в форме конъюгированных метаболитов почками и через кишечник соответственно. Менее 1% дозы выводится либо в неизменной форме (лоратадин), либо в форме его активного метаболита ДЛ.

Средний период полувыведения лоратадина у здоровых испытуемых составляет 8,4 часа (интервал 3-20) часов, а его активного метаболита – 28 часов (интервал 8,8-92).

Более продолжительное время полувыведения отмечено у пожилых, а также у больных с хроническими заболеваниями печени. Через 24 часа после назначения препарата 27% от введенной дозы выделяется почками в конъюгированной форме. При назначении препарата в течение 10 дней 40% и 42% всего введенного количества выводится с мочой и калом соответственно. Лоратадин и его активный метаболит выводится с грудным молоком. Примерно 1% дозы выводится либо в неизменной форме (лоратадин), либо в форме его активного метаболита.

### Специальные группы пациентов

#### *Пожилые*

Фармакокинетические параметры лоратадина и его активного метаболита у здоровых взрослых и у лиц пожилого возраста сходны.

#### *Пациенты с нарушениями функции почек*

У пациентов с хронической почечной недостаточностью значения AUC и  $C_{max}$  лоратадина а его метаболита были повышены, по сравнению с лицами с нормальной функцией почек. Среднее время полувыведения лоратадина и ДЛ у таких пациентов практически не отличались от такового, определяемого здоровых испытуемых. Гемодиализ не влияет на фармакокинетику лоратадина и ДЛ у лиц с хроническим нарушением функции почек

#### *Пациенты с нарушениями функции печени*

У пациентов с хроническим алкогольным поражением печени значения AUC и  $C_{max}$  лоратадина увеличивались вдвое, однако фармакокинетические параметры дезлоратадина (ДЛ) не отличались от таковых, определяемых у лиц со здоровой печенью. Время полувыведения лоратадина и его активного метаболита у пациентов с нарушением функции печени увеличивается и зависит от степени тяжести нарушения.

### **5.3 Доклинические исследования безопасности**

Общепринятые токсикологические исследования с повторными дозами, исследования на карциногенность, а также фармакологические исследования безопасности и генотоксические доклинические исследования не выявили опасности для человека.

Экспериментальные исследования репродуктивной токсичности не выявили тератогенности, однако продлевалось время родов и наблюдалось понижение жизнеспособности потомства у крыс, получавших лоратадин в дозе, вызывающей 10-кратное повышение уровня лоратадина в сыворотке (AUC), по сравнению с уровнем, характерным для клинической дозы.

## **6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**

### **6.1 Перечень вспомогательных веществ**

Лактозы моногидрат (63,8 мг), целлюлоза микрокристаллическая, крахмал прежелатинизированный, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

### **6.2. Несовместимость**

Неприменимо

### **6.3 Срок годности**

5 лет

### **6.4 Особые меры предосторожности при хранении**

Хранить препарат при температуре не выше 25° С, в недоступном для детей месте!

### **6.5 Вид и содержимое упаковки**

По 10 таблеток упаковано в блистер из ПВХ/ПВДХ/алюминиевая фольга, 1 или 3 блистера помещены в картонную пачку с инструкцией по применению.

### **6.6 Меры предосторожности при утилизации или использовании**

Специальных требований нет.

Удаление любых количеств неиспользованного препарата или отходов следует выполнять в соответствии с местными требованиями.

### **6.7 Условия отпуска из аптек**

Отпускается без рецепта.

## **7. ВЛАДЕЛЕЦ ЛИЦЕНЗИИ НА МАРКЕТИНГ И ПРОИЗВОДИТЕЛЬ**

ЗАО «Фармацевтический завод ЭГИС»

1106 Будапешт, ул. Керестури, 30-38

ВЕНГРИЯ

**Производственная площадка**

ЗАО «Фармацевтический завод ЭГИС»

1165 Будапешт, ул. Бёкенфёлди, 118-120

ВЕНГРИЯ