

# VALMISTEYHTEENVETO

## 1. LÄÄKEVALMISTEEN NIMI

Loratadin Actavis 10 mg tabletit

## 2. VAIKUTTAVAT AINEET JA NIIDEN MÄÄRÄT

Yksi tabletti sisältää 10 mg loratadiinia.

Apuaineet, ks. 6.1.

## 3. LÄÄKEMUOTO

Tabletti.

Valkoinen tai melkein valkoinen halkaisijaltaan 8 mm pyöreä litteä tabletti. Merkintä L tabletin toisella puolella ja toisella puolella jakoura.

## 4. KLIINiset TIEDOT

### 4.1 Käyttöaiheet

Loratadin Actavis tabletit on tarkoitettu allergisen nuhan sekä kroonisen idiopaattisen urtikarian oireiden hoitoon.

### 4.2 Annostus ja antotapa

Aikuiset ja yli 12 -vuotiaat lapset: 10 mg kerran vuorokaudessa (yksi tabletti kerran vuorokaudessa). Tabletit voidaan ottaa joko ruoan kanssa tai ilman.

2-12 -vuotiaat lapset:

Lapsen paino yli 30 kg: 10 mg kerran vuorokaudessa (yksi tabletti kerran vuorokaudessa).

Lapsen paino 30 kg tai vähemmän: 5 mg (1/2 tablettia) kerran vuorokaudessa.

Loratadin Actavis-valmisteen tehoa ja turvallisuutta alle 2-vuotiaille lapsille ei ole osoitettu.

Potilaiden, joiden maksan toiminta on vakavasti heikentynyt, tulisi aloittaa pienemmällä annoksella, koska heillä loratadiinin puhdistuma saattaa olla alentunut. 10 mg joka toinen päivä on suositeltu aloitusannos aikuisille ja yli 30 kg painaville lapsille, 30 kg tai vähemmän painaville lapsille suositeltu aloitusannos on 5 mg (1/2 tablettia) joka toinen päivä.

Annosten sovittaminen ei ole tarpeen vanhuksille eikä potilaille, joilla on munuaisten vajaatoimintaa.

### 4.3 Vasta-aiheet

Loratadin Actavis-valmiste on vasta-aiheinen potilaille, jotka ovat yliherkkiä vaikuttavalle aineelle tai jollekin valmisteen apuaineelle.

#### 4.4 Varoitukset ja käyttöön liittyvät varotoimet

Varovaisuutta tulee noudattaa käytettäessä Loratadin Actavis-valmistetta vaikean maksan vajaatoiminnan yhteydessä (ks. 4.2).

Valmiste sisältää laktoosia. Potilaiden, joilla on harvinaisia perinnöllisiä sairauksia kuten esim. galaktoosi- tai laktoosi-intoleranssi tai glukoosi-galaktoosi-imeytymishäiriö, ei tulisi käyttää Loratadin Actavis-valmistetta.

Loratadin Actavis-valmisteen käyttö tulee lopettaa viimeistään 48 tuntia ennen ihotestejä, sillä antihistamiinit saattavat estää tai heikentää muuten positiivisia ihoreaktioita.

#### 4.5 Yhteisvaikutukset muiden lääkevalmisteiden kanssa sekä muut yhteisvaikutukset

Loratadin Actavis-valmisteen käyttö samanaikaisesti alkoholin kanssa ei vahvista alkoholin psykomotorisia vaikutuksia.

Mahdollisia yhteisvaikutuksia saattaa esiintyä kaikkien tunnettujen CYP3A4:n tai CYP2D6:n estäjien kanssa. Ne johtavat kohonneisiin loratadiinipitoisuuksiin. Tämä saattaa lisätä haittavaikutuksia (ks. kohta 5.2)

#### 4.6 Raskaus ja imetys

Loratadiini ei ollut teratogeeninen eläinkokeissa. Lääkkeen turvallisuutta raskauden aikana ei ole varmistettu. Loratadin Actavis-valmisteen käyttöä raskauden aikana ei sen vuoksi suositella.

Loratadiini erittyy äidinmaitoon. Siksi loratadiinin käyttöä imetyksen aikana ei suositella.

#### 4.7 Vaikutus ajokykyyn ja koneiden käyttökykyyn

Kliiniset tutkimukset ovat osoittaneet, että loratadiinilla ei ole vaikutusta ajokykyyn. Potilaille on kuitenkin kerrottava, että erittäin harvoin on esiintynyt uneliaisuutta, joka saattaa vaikuttaa ajokykyyn ja kykyyn käyttää koneita.

#### 4.8 Haittavaikutukset

2-12 -vuotiaille lapsille tehdyissä kliinisissä tutkimuksissa raportoitiin seuraavia yleisiä haittavaikutuksia ilmenneen enemmän kuin lumeryhmässä: päänsärky (2,7 %), hermostuneisuus (2,3 %) ja väsymys (1 %).

Aikuisille ja nuorille tehtiin kliinisiä tutkimuksia useilla indikaatioilla, mukaan lukien allerginen nuha ja krooninen idiopaattinen urtikaria. Suositeltua 10 mg:n vuorokausiannosta käytettäessä haittavaikutuksia raportoitiin ilmenneen 2 %:lle potilaista enemmän kuin plaseboa saaneille. Yleisimpiä haittavaikutuksia, joita raportoitiin loratadiinista enemmän kuin plasebosta, olivat uneliaisuus (1,2 %), päänsärky (0,6 %), lisääntynyt ruokahalu (0,5 %) ja unettomuus (0,1 %). Muita haittavaikutuksia, joita on raportoitu erittäin harvoin valmisteen markkinoilla oloaikana, on lueteltu alla olevassa taulukossa.

Immuunijärjestelmä	Anafylaksia
Hermosto	Heitehuimaus
Sydän	Takykardia, sydämentykytys
Ruoansulatuselimistö	Pahoinvointi, suun kuivuminen, gastriitti
Maksa ja sappi	Maksan toiminnan häiriöt
Iho ja ihonalainen kudος	Ihottuma, hiusten lähtö
Yleisoireet ja antopaikassa todettavat haitat	Väsymys

## 4.9 Yliannostus

Loratadiinin yliannostus lisäsi antikolinergisten oireiden esiintyvyyttä. Uneliaisuutta, takykardiaa ja päänsärkyä on raportoitu ilmenneen yliannosten yhteydessä.

Yliannostustapauksessa aloitetaan tavanomainen oireenmukainen ja elintoimintoja ylläpitävä hoito ja sitä jatketaan niin pitkään kuin tarpeellista. Potilaalle voidaan antaa lääkehiilisuspensiota. Mahahuuhdeltu voidaan suorittaa harkinnan mukaan. Loratadiinia ei voi poistaa hemodialyysillä eikä ole tiedossa, voidaanko loratadiinia poistaa peritoneaalidialyysillä. Ensiavun jälkeen potilaan tilaa tulee seurata edelleen.

## 5. FARMAKOLOGISET OMINAISUUDET

### 5.1 Farmakodynamiikka

Farmakoterapeuttinen ryhmä: Systemiset antihistamiinit, ATC-koodi: R06AX13.

Loratadin Actavis-valmisteen vaikuttava aine loratadiini on trisyklinen antihistamiini, jolla on selektiivinen, perifeerinen, H<sub>1</sub>-reseptoreita salpaava vaikutus.

Loratadiinilla ei ole kliinisesti merkitsevää sedatiivista tai antikolinergistä vaikutusta valtaosaan käyttäjistä, kun käytetään suositeltua annosta.

Pitkäaikaisessa hoidossa ei havaittu kliinisesti merkitseviä vitaaliarvojen, laboratorioarvojen, fyysisen tilan tai ekg:n muutoksia.

Loratadiinilla ei ole merkitsevää vaikutusta H<sub>2</sub>-reseptoreihin. Se ei estä noradrenaliinin soluunottoa, eikä sillä ole käytännöllisesti katsoen mitään vaikutusta kardiovaskulaariseen toimintaan eikä sydämen tahdistajaan.

### 5.2 Farmakokinetiikka

Suun kautta annettu loratadiini imeytyy nopeasti ja hyvin ja sillä on runsas ensikierron metabolia pääasiassa CYP3A4- ja CYP2D6-entsyymien välittämänä. Päämetaboliitti desloratadiini (DL) on farmakologisesti aktiivinen ja aiheuttaa suuren osan kliinisistä vaikutuksista. Loratadiinin ja DL:n maksimipitoisuus plasmassa (T<sub>max</sub>) saavutetaan 1-1,5 tunnissa ja 1,5-3,7 tunnissa annon jälkeen.

Kontrolloiduissa tutkimuksissa on raportoitu plasman loratadiinipitoisuuden nousevan samanaikaisen ketokonatsoli-, erytromysiini- ja simetidiinihoidon yhteydessä. Kliinisesti merkitseviä muutoksia ei ole havaittu, ei myöskään elektrokardiogrammissa.

Loratadiini sitoutuu runsaasti (97 % - 99 %) ja sen aktiivinen metaboliitti kohtalaisesti (73 % - 76 %) plasman proteiineihin.

Terveiden koehenkilöiden elimistössä loratadiinin jakaantumisvaiheen puoliintumisaika plasmassa on yksi tunti ja sen aktiivisen metaboliitin puoliintumisaika kaksi tuntia. Keskimääräinen eliminaation puoliintumisaika terveissä aikuisissa on 8,4 tuntia loratadiinilla (vaihteluväli 3 - 20 tuntia) ja sen aktiivisella metaboliitilla 28 tuntia (vaihteluväli 8,8 - 92 tuntia).

Noin 40 % annoksesta erittyy virtsaan ja 42 % ulosteisiin lähinnä konjugoituneina metaboliitteina kymmenen päivän aikana. Annoksesta noin 27 % erittyy virtsaan ensimmäisten 24 tunnin aikana. Alle 1 % vaikuttavasta aineesta erittyy muuttumattomana, loratadiinina tai desloratadiinina.

Loratadiinin ja sen aktiivisen metaboliitin hyötyosuus on verrannollinen käytettyyn annokseen.

Loratadiinin ja sen metaboliittien farmakokineettinen profiili on samankaltainen terveissä aikuisissa ja terveissä iäkkäissä.

Ruoka voi hidastaa loratadiinin imeytymistä lievästi, mutta ei vaikuta sen kliiniseen tehoon.

Munuaisten kroonisesta vajaatoiminnasta kärsivissä potilaissa loratadiinin ja sen aktiivisen metaboliitin AUC-arvot sekä huippupitoisuudet plasmassa ( $C_{max}$ ) kohosivat verrattuna potilaisiin, joilla munuaisten toiminta oli normaalia. Loratadiinin ja sen metaboliitin keskimääräiset eliminaation puoliintumisajat eivät merkitsevästi poikenneet terveissä koehenkilöissä havaituista. Hemodialyysi ei vaikuttanut loratadiinin tai sen aktiivisen metaboliitin farmakokinetiikkaan kroonisesta munuaisten vajaatoiminnasta kärsivissä potilaissa.

Potilaissa, joilla oli krooninen alkoholin aiheuttama maksasairaus, loratadiinin AUC-arvo ja huippupitoisuudet plasmassa ( $C_{max}$ ) olivat kaksinkertaiset. Aktiivisen metaboliitin farmakokinetiikka ei poikennut merkitsevästi verrattuna potilaisiin, joilla oli normaali maksan toiminta. Eliminaation puoliintumisajat loratadiinilla ja sen metaboliitilla olivat 24 ja 37 tuntia ja kasvoivat, mitä vakavammasta maksan toimintahäiriöstä oli kysymys.

Loratadiini ja sen aktiivinen metaboliitti erittyvät äidinmaitoon.

### **5.3 Prekliiniset tiedot turvallisuudesta**

Turvallisuutta, farmakologiaa, toistuvan altistuksen aiheuttamaa toksisuutta, genotoksisuutta ja karsinogeenisuutta koskevien tavanomaisten prekliinisten tutkimusten tulokset eivät viittaa mihinkään erityiseen vaaraan kliinisessä käytössä.

Loratadiinin lisääntymistoksisuustutkimuksissa ei havaittu teratogeenisiä vaikutuksia. Rotilla havaittiin kuitenkin pitkittynyttä synnytystä ja jälkeläisten vähentynyttä elinkykyisyyttä, kun plasman loratadiinipitoisuudet (AUC) olivat 10-kertaiset verrattuna kliinisillä annoksilla saavutettuihin pitoisuuksiin.

Paikallista limakalvoärsytystä ei havaittu, kun annettiin jopa 12 kylmäkuivattua tablettia (120 mg) päivässä hamsterin poskipussiin 5 päivän ajan.

## **6. FARMASEUTTISET TIEDOT**

### **6.1 Apuaineet**

Laktoosimonohydraatti  
Mikrokiteinen selluloosa (E460)  
Maissitärkkelys  
Magnesiumstearaatti

### **6.2 Yhteensopimattomuudet**

Ei tunnettuja.

### **6.3 Kesto aika**

3 vuotta.

### **6.4 Säilytys**

Ei erityisiä säilytysolosuhteita.

#### **6.5 Pakkaustyyppi ja pakkauskoot**

Kirkas, läpinäkyvä tai valkoinen, läpinäkymätön PVC/alumiiniläpipainopakkaus pahvisessa ulkopakkauksessa.

Pakkauskoot: 7, 10, 14, 15, 20, 28, 30, 50, 56, 60, 100

Kaikkia pakkauskokoja ei välttämättä ole myynnissä.

#### **6.6 Käyttö- ja käsittelyohjeet**

Ei erityisohjeita.

### **7. MYYNTILUVAN HALTIJA**

Actavis Group PTC ehf  
Reykjavikurvegi 76-78  
IS-220 Hafnarfjordur  
Islanti

### **8. MYYNTILUVAN NUMERO**

17490

### **9. MYYNTILUVAN MYÖNTÄMISPÄIVÄMÄÄRÄ/UUDISTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ**

15.11.2002

### **10. TEKSTIN MUUTTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ**

27.1.2011