

**HISTALOR syrup 5 mg/5 ml - 120 ml****1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ**

ХИСТАЛОП 5 mg/5 ml сироп  
HISTALOR 5 mg/5 ml syrup

**ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА**

Кратка характеристика на продукта - Приложение 1

Към Рег. № 2806 0365

Разрешение № 9481 / 27.04.2010

Добрение № /

**2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ**

5 ml сироп съдържа активно вещество лоратадин (loratadine) 5 mg.  
Помощни вещества: захароза, метил парахидроксибензоат; пропил парахидроксибензоат и др.  
За пълния списък на помощните вещества, вижте точка 6.1.

**3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА**

Сироп.  
Хисталор сироп представлява бистра бледожълта течност.

**4. КЛИНИЧНИ ДАННИ****4.1 Терапевтични показания**

Симптоматично лечение на сезонен и целогодишен алергичен ринит, алергичен конюнктивит и хронична идиопатична уртикария.

**4.2 Дозировка и начин на приложение**

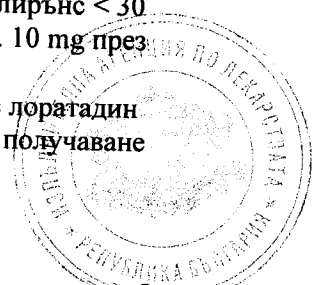
Хисталор сироп се прилага перорално.  
Възрастни и деца над 12 години - по 10 ml (10 mg) веднъж дневно.  
Деца от 2 до 12 години с телесно тегло под 30 kg - по 5 ml (5 mg) веднъж дневно; с тегло над 30 kg - по 10 ml (10 mg) веднъж дневно.  
Пациенти с нарушена чернодробна и бъбречна функция - по 5 ml (5 mg) веднъж дневно или по 10 ml (10 mg) през ден.

**4.3 Противопоказания**

- Свръхчувствителност към активното или някое от помощните вещества.
- Деца под 2-годишна възраст.

**4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба**

- При пациенти с чернодробни или бъбречни нарушения (бъбречен клирънс < 30 ml/min) се препоръчва намаляване на дозата в началото на лечението (напр. 10 mg през ден).
- При необходимост от провеждане на тестове за алергия лечението с лоратадин трябва да бъде прекратено 4-7 дни преди тестирането, тъй като е възможно получаване на фалшиво-отрицателен резултат.



## HISTALOR syrup 5 mg/5 ml - 120 ml

- Този лекарствен продукт съдържа 36 g захароза. Когато се приема съгласно препоръките за дозиране всяка доза от 10 ml набавя до 3 g захароза. Пациенти с редки наследствени проблеми на непоносимост към фруктоза, глюкозо-галактозна малабсорбция или сукраза-изомалтазна недостатъчност не трябва да приемат това лекарство.
- Сиропът съдържа като помощни вещества метил- и пропил парахидроксibenзоат, които могат да причинят алергични реакции (възможно е да са от забавен тип).

### 4.5. Лекарствени и други взаимодействия

- При едновременно приложение на лоратадин с еритромицин, циметидин, кетоконазол, въпреки повишаването на плазмените концентрации на лекарствения продукт и неговия метаболит, не се наблюдават клинично значими нежелани реакции.
- При едновременно приложение на лоратадин и перорални контрацептивни средства не се повишава риска от поява на сериозни нежелани реакции.
- Не се наблюдава потенциране на потискащото действие на алкохол върху централната нервна система при едновременно приемане с лоратадин.

### 4.6 Бременност и кърмене

Проучвания върху животни, проведени с лоратадин, не показват токсичност върху плода (категория В по отношение използването при бременни). Няма проведени изследвания върху хора, необходими за сигурно доказване на безопасната употреба по време на бременност.

Приемането на лоратадин по време на бременност е възможно само в случаите на сериозни медицински показания за това. Необходимо е да се избягва приложението му по време на кърмене, тъй като лоратадин се екскретира в кърмата и може да достигне концентрации, еквивалентни на плазмените.

### 4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

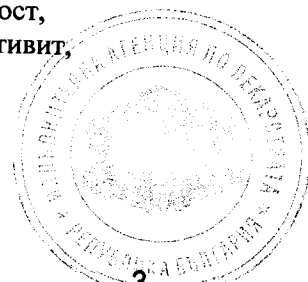
Хисталор се отнася към неседативни антихистаминови лекарствени продукти. По време на клинични проучвания не е установено нарушение на способността за шофиране. Въпреки това, пациентите трябва да бъдат предупредени за макар и рядката възможност за поява на сънливост, която може да повлияе способността им за шофиране и работа с машини.

### 4.8 Нежелани лекарствени реакции

По време на лечението с лоратадин е възможно, макар и рядко, да се наблюдават следните нежелани лекарствени реакции: главоболие, сънливост, уморяемост, сухота в устата, гадене, повишен апетит, стомашно-чревен дискомфорт и реакции на свръхчувствителност.

При деца прилагането на лоратадин много рядко може да предизвика нервност, свиркащо дишане, уморяемост, хиперкинезия, абдоминални болки, конюнктивит, дисфония, общо неразположение.

### 4.9 Предозиране



При приемане на високи дози (40-180 mg) лоратадин от възрастни пациенти се наблюдава сомнолентност, тахикардия, главоболие. При деца предозирането се изразява с екстрапирамидна симптоматика и палпитации.

**Лечение:** предизвикване на повръщане в случаите, когато съзнанието не е нарушено. Дава се активен въглен за абсорбция на останалите нерезорбирани количества от медикамента. В случаите, когато е невъзможно предизвикването на повръщане, се прави стомашна промивка със солеви разтвори. Показани са осмотични лаксативни средства. Лоратадин не може да бъде елиминиран чрез хемодиализа и няма данни за отстраняването му чрез перитониална диализа. След оказване на съответна помощ в случай на предозиране, пациентът трябва да остане под лекарско наблюдение.

## 5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

### 5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Други антихистаминови средства за системно приложение, АТС код: R06AX13

Лоратадин е трицикличен антихистаминов продукт с продължително действие. Той избирателно блокира периферните хистаминови H<sub>1</sub>-рецептори. Свързването му с H<sub>1</sub>-рецепторите в централната нервна система е незначително, с което се обяснява липсата на клинично значим седативен ефект при приложението на лоратадин. Терапевтичният ефект на продукта започва да се проявява между 1-3-ти час и достига максимума между 8-12-ти час, като действието му може да се запази до 24 часа.

### 5.2 Фармакокинетични свойства

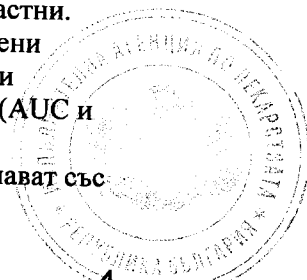
**Резорбция:** лоратадин бързо и напълно се резорбира в стомашно-чревния тракт при приложение на еднократна доза 10 mg. Максимални плазмени концентрации се наблюдават след 60-70 мин за лоратадин и на 2-3 часа за основния му метаболит – декарбоетоксилоратадин. Фармакокинетичните параметри на лоратадин и основния му метаболит не са дозозависими в границите на дози от 10 до 40 mg. Храната може да повиши системната бионаличност на лоратадин приблизително с 40%, на неговия метаболит – с 15%. Времето на полуживот на лоратадин е в границите от 3 до 20 часа (средно около 8 часа) и около 28 часа за неговия основен метаболит. При многократно приложение постоянни плазмени концентрации се достигат на 5-ти ден.

**Разпределение:** свързването на лоратадин с плазмените протеини е около 97-99%, а на основния метаболит е около 73-75%.

**Метаболизъм:** лоратадин се метаболизира до декарбоетоксилоратадин главно в черния дроб с участието на цитохром P450 3A4 (CYP3A4), и в по-малка степен на цитохром P450 2D6 (CYP2D6).

**Екскреция:** до 80% от приетата доза се екскретира под формата на метаболити с урината и фекалиите.

Фармакокинетичните параметри не се различават съществено при деца и възрастни. При пациенти в старческа възраст (66-78 год.) се наблюдават по-високи плазмени концентрации на лоратадин и неговия метаболит, като съответно се удължава и времето на полуживот при тях. Фармакокинетичните параметри на лоратадин (AUC и C<sub>max</sub>) се повишават със 73% при пациенти с бъбречни нарушения (клирънс на креатинина < 30 ml/min). Параметрите на неговия основен метаболит се повишават със



120%. Същевременно времето на полуживот не се променя съществено при пациенти с хронична бъбречна недостатъчност. При пациенти с хронично алкохолно чернодробно заболяване параметрите AUC и  $C_{max}$  се удвояват за лоратадин и не се променят значително за неговия метаболит. При тях се наблюдава удължаване на времето на полуживот на лоратадин и на метаболита, като тази промяна е по-съществена при пациенти с по-тежки чернодробни увреждания.

### **5.3 Предклинични данни за безопасност**

Лоратадин се отнася към веществата със слаба токсичност. ЛД<sub>50</sub> за плъхове и мишки при перорално приложение е > 5000 mg/kg т.м.

При изследвания на хроничната (12 месеца) токсичност върху плъхове в дози 2-240 mg/kg дневно и върху маймуни в дози 0,4 – 90 mg/kg дневно не се наблюдават промени в поведението и рефлексите, хематологичните и биохимични тестове, както и токсични изменения на вътрешните органи на експерименталните животни.

При мъжки плъхове, третирани с лоратадин в доза 64 mg/kg се наблюдава обратимо намаляване на фертилността. При по-ниски дози не се наблюдава подобен ефект.

Проучванията върху женски плъхове и зайци, третирани перорално с лоратадин в дози до 96 mg/kg показват, че лоратадин няма тератогенен ефект.

## **6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ**

### **6.1 Списък на помощните вещества**

Захароза, пропиленгликол, глицерол, метил парахидроксibenзоат, пропилен парахидроксibenзоат, лимонена киселина монохидрат, лимонена есенция, пречистена вода.

### **6.2 Несъвместимости**

Не са известни.

### **6.3 Срок на годност**

2 години.

Сиропът може да се използва до 1 месец след отваряне на бутилката.

### **6.4 Специални условия на съхранение**

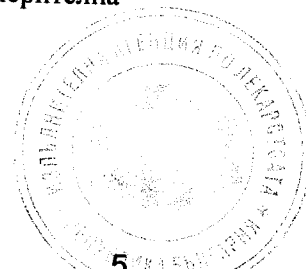
Да се съхранява на сухо и защитено от светлина място, при температура под 25°C.

### **6.5 Данни за опаковката**

120 ml сироп в тъмна стъклена бутилка с алуминиева или полиетиленова капачка или тъмна бутилка от полиетилен терефталат с полиетиленова капачка, заедно с мерителна чашка/лъжичка и листовка в картонена кутия.

### **6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа**

Няма специални изисквания.



**7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

СОФАРМА АД  
ул. Илиенско шосе 16, 1220 София, България

**8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

20060365

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

24.07.06.

**10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА**

Юли 2009

