

SAMENVATTING VAN DE PRODUCTKENMERKEN

1. NAAM VAN HET GENEESMIDDEL

RUPTON 10 mg tabletten.

2. KWALITATIEVE EN KWANTITATIEVE SAMENSTELLING

Elk tablet bevat 10 mg loratadine.

De hoeveelheid van lactose monohydraat is 94 mg.

Voor de hulpstoffen, zie 6.1.

3. FARMACEUTISCHE VORM

Tablet

Beschrijving: Wit, biconvex tablet

4. KLINISCHE GEGEVENS

4.1 Therapeutische indicaties

Rupton is geïndiceerd voor de symptomatische behandeling van allergische rhinitis en chronische idiopathische urticaria.

4.2 Dosering en wijze van toediening

Volwassenen en kinderen van 12 jaar en ouder : 10 mg eenmaal per dag (1 tablet eenmaal per dag). Men dient geen rekening te houden met de maaltijden voor het tijdstip van inname van tablet.

Kinderen van 2 tot 12 jaar **worden gedoseerd op basis van hun gewicht:**

Lichaamsgewicht > 30 kg : 10 mg eenmaal per dag (1 tablet eenmaal per dag).

Lichaamsgewicht ≤ 30 kg: de tablet van 10 mg is niet geschikt voor kinderen met een lichaamsgewicht van minder dan 30 kg.

De werkzaamheid en de veiligheid van Rupton werden niet vastgesteld bij kinderen jonger dan 2 jaar.

Patiënten met ernstige leverinsufficiëntie moeten een lagere initiële dosis krijgen aangezien zij een verminderde loratadineklaring kunnen vertonen. Een initiële dosis van 10 mg om de andere dag wordt aanbevolen voor volwassenen en kinderen zwaarder dan 30 kg.

Er zijn geen dosisaanpassingen vereist bij bejaarden of patiënten met nierinsufficiëntie.

4.3 Contra-indicaties

Rupton is gecontraïndiceerd bij patiënten die overgevoelig zijn voor het werkzaam bestanddeel of voor één van de hulpstoffen in deze formuleringen..

4.4 Bijzondere waarschuwingen en voorzorgen bij gebruik

Voorzichtigheid is geboden bij toediening van Rupton aan patiënten met ernstige leverinsufficiëntie (zie 4.2).

Dit geneesmiddel bevat lactose.

Patiënten met zeldzame erfelijke aandoeningen als galactose-intolerantie, Lapp lactasedeficiëntie of glucose-galactose malabsorptie, dienen dit geneesmiddel niet te gebruiken.

De toediening van Rupton moet minstens 48 uur vóór het uitvoeren van huidtesten onderbroken worden, aangezien antihistaminica positieve huidreacties kunnen onderdrukken of verminderen.

4.5 Interacties met andere geneesmiddelen en anderen vormen van interactie

Uit onderzoeken naar de psychomotorische prestatie is gebleken dat Rupton bij gelijktijdige toediening met alcohol geen potentiërende effecten heeft.

Mogelijke interactie kan optreden met alle bekende CYP3A4-remmers of CYP2D6-remmers met verhoogde concentraties loratadine tot gevolg (zie 5.2), wat kan leiden tot een toename van bijwerkingen.

4.6 Vruchtbaarheid, zwangerschap en borstvoeding

Loratadine was niet teratogeen in dierproeven. De veiligheid van the gebruik van loratadine tijdens de zwangerschap werd niet vastgesteld. Daarom wordt het gebruik van Rupton tijdens de zwangerschap niet aanbevolen.

Loratadine wordt uigescheiden in de moedermelk; daarom wordt het gebruik van loratadine niet aanbevolen bij vrouwen die borstvoeding geven.

4.7 Beïnvloeding van de rijvaardigheid en van het vermogen om machines te bedienen

Tijdens klinische onderzoeken naar de rijvaardigheid werd geen stoornis waargenomen bij patiënten die loratadine toegediend kregen. Nochtans dienen patiënten geïnformeerd te worden dat sommigen zeer zelden duizeligheid ondervinden, hetgeen hun rijvaardigheid of vermogen om machines te bedienen kan beïnvloeden.

4.8 Bijwerkingen

In klinische onderzoeken met een pediatrie populatie (kinderen van 2 tot en met 12 jaar) waren de meest frequente bijwerkingen die vaker gemeld werden dan met placebo: hoofdpijn (2,7%), zenuwachtigheid (2,3%) en vermoeidheid (1%).

In klinische onderzoeken met volwassenen en adolescenten met een reeks indicaties waaronder AR (Allergische Rhinitis) en CIU (Chronische Idiopathische Urticaria) werden er bij de aanbevolen dosis van 10 mg per dag bijwerkingen waargenomen bij 2% meer patiënten die behandeld werden met loratadine dan bij degenen behandeld met placebo.

De meest frequente bijwerkingen die vaker gemeld werden dan met placebo waren slaperigheid (1,2%), hoofdpijn (0,6%), verhoogde eetlust (0,5%) en slapeloosheid (0,1%).

Andere bijwerkingen die zeer zelden gemeld werden na het in de handel brengen, worden weergegeven in onderstaande tabel.

Immuunsysteemaandoeningen	Anafylaxie
Zenuwstelselaandoeningen	Duizeligheid
Hartaandoeningen	Tachycardie, palpitaties
Maagdarmstelselaandoeningen	Nausea, droge mond, gastritis
Lever-en galaandoeningen	Abnormale leverfunctie
Huid-en onderhuidaandoeningen	Rash, alopecie
Algemene aandoeningen en toedieningsplaatsstoornissen	Vermoeidheid

Onderzoeken:

Frequentie 'niet bekend': gewichtstoename

4.9 Overdosering

Overdosering met loratadine verhoogde het optreden van anticholinerge symptomen. Slaperigheid, tachycardie en hoofdpijn werden gemeld met overdoses.

In geval van overdosering moeten algemene symptomatische en ondersteunende maatregelen genomen worden die zo lang als nodig is moeten worden voortgezet. Actieve kool, gesuspenseerd in water, kan toegediend worden. Een maagspoeling kan worden overwogen. Loratadine wordt niet geëlimineerd door middel van hemodialyse en het is niet bekend of loratadine door middel van peritoneale dialyse kan worden geëlimineerd. Na de spoedbehandeling moet de patiënt onder medisch toezicht blijven.

5. FARMACOLOGISCHE EIGENSCHAPPEN

5.1 Farmacodynamische eigenschappen

Farmacotherapeutische categorie: antihistaminica-H₁-antagonist, ATC-code R06AX13.

Loratadine, het werkzame bestanddeel van Rupton, is een antihistaminicum met een tricyclische structuur en een selectieve perifere H₁-receptor-activiteit.

Loratadine heeft geen klinisch significante sedatieve of anticholinerge eigenschappen bij het merendeel van de populatie en indien gebruikt in de aanbevolen dosering.

Bij langdurige behandeling werden er geen klinisch significante veranderingen van de vitale functies, laboratoriumwaarden, lichamelijk onderzoek of ECG's waargenomen.

Loratadine heeft geen significante H₂-receptor-activiteit, inhibeert de noradrenaline-opname niet en heeft praktisch geen invloed op de cardiovasculaire functie of intrinsieke pacemakeractiviteit van het hart.

5.2 Farmacokinetische gegevens

Na orale toediening wordt loratadine snel en goed geresorbeerd en ondergaat het een belangrijk first-pass-metabolisme, hoofdzakelijk door CYP3A4 en CYP2D6. De belangrijkste metaboliet-desloratadine (DL)- is farmacologisch actief en verantwoordelijk voor een groot deel van de klinische effecten.

Loratadine en DL bereiken maximale plasmaconcentraties (T_{max}) tussen respectievelijk 1-1,5 uur en 1,5-3,7 uur na toediening.

Een verhoging van de plasmaconcentraties van loratadine werd vastgesteld in gecontroleerde klinische studies na gelijktijdig gebruik met ketoconazol, erythromycine of cimetidine, maar zonder klinisch significante veranderingen (waaronder electrocardiografische).

Loratadine is sterk aan plasmaproteïnen gebonden (97% tot 99%), de actieve metaboliet in mindere mate (73 % tot 76%).

Bij gezonde personen bedraagt de plasmadistributiehelfwaardetijd van loratadine en zijn actieve metaboliet respectievelijk ongeveer 1 en 2 uur. De gemiddelde eliminatiehelfwaardetijd bij gezonde volwassenen bedroeg 8,4 uur (interval 3-20 uur) voor loratadine en 28 uur (interval 8,8-92 uur) voor de belangrijkste actieve metaboliet.

Ongeveer 40% van de dosis wordt via de urine uitgescheiden en 42% via de faeces gedurende een periode van 10 dagen en hoofdzakelijk in de vorm van geconjugeerde metabolieten. Binnen 24 uur na inna-

me wordt ongeveer 27% van de de dosis via de urine uitgescheiden. Minder dan 1% van het werkzaam bestanddeel wordt ongewijzigd in actieve vorm uigescheiden, als loratadine of DL.

De biologische beschikbaarheid van loratadine en de actieve metaboliet is evenredig aan de toegediende dosis.

Het farmacokinetische profiel van loratadine en zijn metabolieten is vergelijkbaar bij gezonde volwassenen en bij gezonde bejaarde vrijwilligers.

De gelijktijdige inname van voedsel kan de resorptie van loratadine lichtjes vertragen zonder dat de klinische effecten beïnvloed worden.

Bij patiënten met chronische nierinsufficiëntie zijn de AUC en de maximale plasmaconcentraties (C_{max}) van loratadine en zijn metaboliet verhoogd in vergelijking met de AUC en de maximale plasmaconcentraties (C_{max}) van patiënten met een normale nierfunctie. De gemiddelde eliminatiehalfwaardetijden van loratadine en zijn metaboliet verschillen niet significant van die van normale personen. Hemodialyse heeft geen effect op de farmacokinetiek van loratadine en zijn actieve metaboliet bij personen met chronische nierinsufficiëntie.

Bij patiënten met chronische alcoholische leveraandoeningen zijn de AUC en de maximale plasmaconcentraties (C_{max}) van loratadine met een factor twee verhoogd, terwijl het farmacokinetische profiel van de actieve metaboliet niet significant verschilt in vergelijking met patiënten met een normale leverfunctie. De eliminatiehalfwaardetijden van loratadine en zijn metaboliet bedragen respectievelijk 24 uur en 37 uur en nemen toe naargelang van de ernst van de leveraandoening.

Loratadine en zijn actieve metaboliet worden uitgescheiden in de moedermelk.

5.3 Gegevens uit het preklinisch veiligheidsonderzoek

Preklinische gegevens, gebaseerd op conventionele onderzoeken naar veiligheid, farmacologie, toxiciteit bij herhaalde dosering, genotoxiciteit en carcinogeen potentieel, duiden niet op een speciaal risico voor mensen.

Bij onderzoeken naar reproductietoxiciteit werd geen teratogeen effect waargenomen. Nochtans werden bij ratten een langdurige bevalling en verminderde levensvatbaarheid van de jongen waargenomen bij plasmaconcentraties (AUC) die 10 maal hoger lagen dan die bij klinische doses.

Bij hamsters werd er geen enkel bewijs van irritatie van het slijmvliesmembraan in de wangen waargenomen na een dagelijkse toediening van maximal 12 tabletten (120 mg) lyophilisaat voor oraal gebruik gedurende vijf dagen.

6. FARMACEUTISCHE GEGEVENS

6.1 Lijst van hulpstoffen

Povidone
Crospovidone
Maïszetmeel
Lactose monohydraat
Magnesiumstearaat

6.2 Gevallen van onverenigbaarheid

Niet van toepassing.

6.3 Houdbaarheid

2 jaar

6.4 Speciale voorzorgsmaatregelen bij bewaren

Voor dit geneesmiddel zijn er geen speciale bewaarcondities

6.5 Aard en inhoud van de verpakking

Blisterverpakking in PVC/Al in een kartonnen doos met 10, 20, 30 en 100 tabletten.
Niet alle genoemde verpakkingsgrootten worden in de handel gebracht.

6.6 Speciale voorzorgsmaatregelen voor het verwijderen en andere instructies

Geen bijzondere vereisten.

7. HOUDER VAN DE VERGUNNING VOOR HET IN DE HANDEL BRENGEN

Laboratoires SMB N.V.
Herdersliedstraat 26-28
B-1080 Brussel
België
Tel: +32 2 411 48 28
Fax: +32 2 411 28 28

8. NUMMER VAN DE VERGUNNING VOOR HET IN DE HANDEL BRENGEN

BE260626

9. DATUM VAN DE EERSTE VERGUNNING/VERNIEUWING VAN DE VERGUNNING

Eerste vergunning : 08 maart 2004
Vernieuwing van de vergunning : 08 maart 2009

10. DATUM VAN HERZIENING VAN DE TEKST

Goedkeuringsdatum: 02/2018