

## **Склад**

*діюча речовина:* levocetirizine dihydrochloride;

1 таблетка, вкрита плівковою оболонкою містить левоцетиризину дигідрохлориду 5 мг;

*допоміжні речовини:* лактози моногідрат, целюлоза мікрокристалічна, кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат, Opadry White OY-58900 (містить гіпромелозу (E 464), титану діоксид (E 171), макрогол (E1521)).

## **Лікарська форма**

Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

*Основні фізико-хімічні властивості:* овальні таблетки від білого до майже білого кольору, вкриті плівковою оболонкою, двоопуклі, з гравіруванням «R 5» з одного боку та гладкі з іншого.

## **Фармакотерапевтична група**

Антигістамінні препарати для системного застосування. Похідні піперазину. Код АТХ R06A E09.

## **Фармакодинаміка**

Левоцетиризин - активний стабільний R-енантіомер цетиризину, який належить до групи конкурентних антагоністів гістаміну. Його фармакологічна дія зумовлена блокуванням  $H_1$ -гістамінових рецепторів. Спорідненість до  $H_1$ -гістамінових рецепторів у левоцетиризину в 2 рази вища, ніж у цетиризину. Левоцетиризин впливає на гістамінзалежну стадію розвитку алергічної реакції, зменшує міграцію еозинофілів, судинну проникність, обмежує вивільнення медіаторів запалення, попереджає розвиток та полегшує перебіг алергічних реакцій, чинить антиексудативну, протисвербіжну, протизапальну дію. Майже не чинить антихолінергічної та антисеротонінової дії.

Фармакокінетичні параметри левоцетиризину мають лінійну залежність і майже не відрізняються від таких у цетиризину.

## **Фармакокінетика**

*Абсорбція.* Препарат швидко та інтенсивно всмоктується після перорального введення. Ступінь всмоктування не залежить від дози та не змінюється з

прийомом їжі, але максимальна концентрація ( $C_{\max}$ ) зменшується та досягає свого максимального значення пізніше. Біодоступність становить 100 %.

У 50% хворих дія препарату розвивається через 12 хвилин після прийому одноразової дози, а у 95% - через півгодини - годину.  $C_{\max}$  у сироватці крові досягається через 50 хвилин після внутрішнього одноразового прийому терапевтичної дози. Рівноважна концентрація у крові досягається після 2 днів прийому препарату.  $C_{\max}$  становить 270 нг/мл після одноразового прийому і 308 нг/мл - після повторного застосування у дозі 5 мг.

*Розподіл.* Інформація щодо розподілу препарату у тканинах, а також проникнення через гематоенцефалічний бар'єр у людини на цей час відсутня. Зв'язування з білками плазми крові становить 90%.

*Біотрансформація.* В організмі людини метаболізується близько 14% левоцетиризину. Процес метаболізму включає оксидацію, N-та O-деалкілування та сполучення з таурином. Деалкілування у першу чергу відбувається за участю цитохрому CYP 3A4, а у процесі оксидації беруть участь численні ізоформи ферментів CYP. Левоцетиризин не впливає на активність цитохромних ізоферментів 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4 у концентраціях, що значно перевищують максимальні після прийняття пероральної дози по 5 мг. Враховуючи низький ступінь метаболізму та відсутність здатності до пригнічення метаболізму, взаємодія левоцетиризину з іншими речовинами мало ймовірна.

*Виведення.* Екскреція левоцетиризину відбувається в основному за рахунок клубочкової фільтрації та активної каналцевої секреції. Період напіввиведення препарату з плазми крові у дорослих ( $T_{1/2}$ ) становить  $7,9 \pm 1,9$  год. Період напіввиведення препарату коротший у маленьких дітей. Загальний кліренс у дорослих - 0,63 мл/хв/кг. В основному виведення левоцетиризину та його метаболітів з організму відбувається з сечею - у середньому 85,4% прийнятої дози, з калом виводиться 12,9% прийнятої дози.

Кліренс левоцетиризину корелює з кліренсом креатиніну. Таким чином, пацієнтам з помірними та тяжкими порушеннями функціями нирок рекомендовано підбирати інтервали між прийомами левоцетиризину з урахуванням кліренсу креатиніну. При анурії в кінцевій термінальній стадії захворювання нирок загальний кліренс організму пацієнтів, порівняно із загальним кліренсом організму у осіб без таких порушень, зменшується приблизно на 80%. Кількість левоцетиризину, що виводиться під час стандартної 4-годинної процедури гемодіалізу, становила  $< 10\%$ .

## **Показання**

Симптоматичне лікування алергічного риніту (у тому числі цілорічного алергічного риніту) та кропив'янки.

## **Протипоказання**

Підвищена чутливість до левоцетиризину, похідних піперазину або до будь-якого іншого компонента препарату. Тяжка форма хронічної ниркової недостатності (кліренс креатиніну <math>\leq 10</math> мл/хв). Рідкісні спадкові захворювання непереносимості галактози, недостатність лактази або порушення всмоктування глюкози та галактози.

## **Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій**

Спеціальні дослідження з левоцетиризином щодо взаємодії з іншими лікарськими засобами не проводилися. Дослідження з цетиризином (сполуки рацемату) показали, що одночасне застосування з антипірином, псевдоефедриним, циметидином, кетоконазолом, еритроміцином, азитроміцином, гліпезидом або діазепамом не чинить клінічно значущих несприятливих взаємодій. Одночасне застосування з теофіліном (400 мг/добу) знижує на 16% загальний кліренс цетиризину (кінетика теофіліну не змінюється). У дослідженнях при багаторазовому введенні ритонавіру (600 мг 2 рази на добу) та цетиризину (10 мг на добу) ступінь експозиції цетиризину збільшувався приблизно на 40%, в той час як розподіл ритонавіру дещо змінювався (-11%) до одночасного застосування цетиризину. Немає даних щодо посилення ефекту седативних засобів при застосуванні у терапевтичних дозах. Проте рекомендується уникати застосування прийому седативних засобів одночасно з прийомом левоцетиризину. Прийом їжі не впливає на ступінь всмоктування препарату, але одночасне вживання їжі знижує швидкість його абсорбції.

Одночасне застосування цетиризину або левоцетиризину і алкоголю або інших депресантів ЦНС уразливими пацієнтами може спричинити у них додаткове зниження пильності та порушення виконання роботи.

## **Особливості застосування**

Левоцетиризин, таблетки, вкриті плівковою оболонкою не рекомендується застосовувати у дітей віком до 6 років, тому що ця лікарська форма не передбачає належного корегування дози. Дітям до 6 років слід застосовувати лікарську форму для педіатричного застосування.

Слід проявляти обережність при застосуванні сумісно з прийомом алкоголю.

## **Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами**

Слід утримуватись від керування автотранспортом та роботи з іншими механізмами при застосуванні препарату.

## **Застосування у період вагітності або годування груддю**

Левоцетиризин протипоказаний жінкам у період вагітності. Цетиризин проникає у грудне молоко, тому у разі застосування препарату годування груддю слід припинити.

## **Спосіб застосування та дози**

Застосовують дорослим та дітям віком від 6 років у дозі 5 мг левоцетиризину 1 раз на добу незалежно від прийому їжі. Таблетку необхідно ковтати не розжовуючи, запиваючи невеликою кількістю чистої води.

Хворим літнього віку з нормальною функцією нирок корекція дози препарату не потрібна.

Хворим з порушеннями функцій нирок розрахунок дози необхідно проводити з урахуванням кліренсу креатиніну відповідно до представленої нижче таблиці.

*Таблиця 1. Корекція дози препарату для хворих із порушеною функцією нирок*

<i>Функція нирок</i>	<i>Кліренс креатиніну, мл/хв</i>	<i>Доза та кількість прийомів</i>
Нормальна функція нирок	$\geq 80$	5 мг 1 раз на добу
Порушення легкого ступеня	50-79	5 мг 1 раз на добу
Порушення помірного ступеня	30-49	5 мг 1 раз на добу
Порушення тяжкого ступеня	$< 30$	5 мг 1 раз на добу
Кінцева стадія захворювання нирок Пацієнти, які перебувають на діалізі	$< 10$	Протипоказано

Дітям з порушеннями функції нирок дозу препарату слід коригувати індивідуально з урахуванням ниркового кліренсу та маси тіла.

Хворим тільки з печінковою недостатністю корекція режиму дозування не потрібна.

Хворим з печінковою та нирковою недостатністю слід коригувати режим дозування відповідно до таблиці 1.

Тривалість застосування левоцетиризину є такою:

*Пацієнтам з періодичним алергічним ринітом* (симптоми захворювання проявляються протягом  $\leq 4$  днів на тиждень або симптоми тривають менше 4 тижнів) слід застосовувати левоцетиризин відповідно до захворювання та анамнезу; лікування можна припинити при зникненні симптомів та відновити при повторному виникненні симптомів.

*У пацієнтів зі стійким алергічним ринітом* (симптоми захворювання проявляються протягом  $> 4$  днів на тиждень або симптоми тривають більше 4 тижнів) у період контакту з алергенами може бути запропонована постійна терапія.

*У пацієнтів з хронічним алергічним ринітом та кропив'янкою* тривалість застосування може становити до 1 року.

## **Діти**

Препарат не застосовується дітям віком до 6 років.

## **Передозування**

*Симптоми:* можуть включати сонливість у дорослих і початкове збудження та підвищену дратівливість з наступною сонливістю у дітей.

*Лікування:* специфічного антидоту для левоцетиризину наразі немає. При прояві симптомів передозування рекомендується симптоматична та підтримувальна терапія. Слід розглянути необхідність промивання шлунка через короткий час після застосування препарату. Гемодіаліз є неефективним.

## **Побічні реакції**

При застосуванні левоцетиризину можливе виникнення таких побічних реакцій:

*з боку нервової системи: сонливість, головний біль, підвищена втомлюваність, слабкість, астенія, судоми, парестезія, запаморочення, непритомність, тремор, дисгевзія;*

*з боку психіки: порушення сну, збудження, галюцинації, депресія, агресія, безсоння, суїцидальні думки;*

*з боку серця: посилене серцебиття, тахікардія;*

*з боку органів зору: порушення зору, нечіткість зору;*

*з боку органів слуху та рівноваги: вертиго;*

*з боку печінки та жовчовивідних шляхів: гепатит;*

*з боку нирок та сечовидільної системи: дизурія, затримка сечі;*

*з боку імунної системи: гіперчутливість, у тому числі анафілаксія;*

*з боку дихальної системи, органів грудної клітки та середостіння: задишка;*

*з боку шлунково-кишкового тракту: діарея, блювання, запор, сухість у роті, нудота, біль у животі;*

*з боку шкіри та підшкірних тканин: ангіоневротичний набряк, стійкі медикаментозні висипання, свербіж, висипання, кропив'янка;*

*з боку скелетно-м'язової системи, сполучної тканини та кісток: міалгія, артралгія;*

*дані досліджень: збільшення маси тіла, відхилення функціональних печінкових проб від норми;*

*порушення харчування та обміну речовин: підвищений апетит.*

*загальні порушення: набряк.*

### **Термін придатності**

2 роки.

### **Умови зберігання**

Зберігати у недоступному для дітей, сухому, захищеному від світла місці при температурі нижче 25 °С.

**Упаковка**

По 10 таблеток у блістері. По 1 блістеру в картонній коробці.

**Категорія відпуску**

Без рецепта.

**Виробник**

Д-р Редді'с Лабораторіс Лтд, Індія.

**Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності**

Дільниця № 41, с. Бачупалі, Бачупалі Мандал, округ Медчал Малкайгірі, Телангана 500090, Індія.

**Джерело інструкції**

Інструкцію лікарського засобу взято з офіційного джерела — [Державного реєстру лікарських засобів України](#).