

Склад

діюча речовина: levocetirizine;

1 таблетка містить левоцетиризину дигідрохлориду 5 мг;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, крохмаль кукурудзяний, повідон (К-30), кросповідон, кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат.

Лікарська форма

Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: овальні таблетки від білого до майже білого кольору.

Фармакотерапевтична група

Антигістамінні засоби для системного застосування. Похідні піперазину.

Код АТХ R06A E09.

Фармакодинаміка

Левоцетиризин – це активний стабільний R-енантіомер цетиризину, що належить до групи конкурентних антагоністів гістаміну. Фармакологічна дія зумовлена блокуванням H₁-гістамінових рецепторів. Спорідненість з H₁-гістаміновими рецепторами у левоцетиризину у 2 рази вища, ніж у цетиризину. 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 дії, практично не чинить антихолінергічної і антисеротонінової дії. У терапевтичних дозах практично не виявляє седативного ефекту.

Фармакокінетика

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

Абсорбція. Препарат швидко всмоктується при застосуванні внутрішньо, прийом їжі не впливає на ступінь усмоктування, але знижує його швидкість;

біодоступність – 100 %. У 50 % хворих дія препарату розвивається через 12 хв після приймання одноразової дози, а у 95 % – через 0,5-1 годину. Максимальна концентрація (C_{max}) у сироватці досягається через 50 хв після одноразового прийому внутрішньо терапевтичної дози та утримується протягом 2 днів. C_{max} становить 207 нг/мл після одноразового застосування і 308 нг/мл – після повторного застосування у дозі 5 мг відповідно.

Розподіл. Відсутня інформація щодо розподілу препарату у тканинах людини, а також щодо проникнення левоцетиризину крізь гематоенцефалічний бар'єр. Об'єм розподілу – 0,4 л/кг. Зв'язування з білками плазми крові – 90 %.

Біотрансформація. В організмі людини метаболізується близько 14 % левоцетиризину. Процес метаболізму включає оксидацію, N- та O-деалкілювання і сполучення з таурином. Деалкілювання у першу чергу відбувається з участю цитохрому CYP 3A4, тоді як у процесі оксидації беруть участь численні та (або) невизначені ізоформи CYP. Левоцетирин не впливає на активність цитохромних ізоферментів 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4 у концентраціях, що значно перевищують максимальні після прийняття дози 5 мг перорально. З огляду на низький ступінь метаболізму та відсутність здатності до пригнічення метаболізму, взаємодія левоцетиризину з іншими речовинами (і навпаки) малоімовірна.

Виведення. Екскреція препарату відбувається в основному за рахунок клубочкової фільтрації та активної каналцевої секреції. Період напіввиведення препарату з плазми крові у дорослих становить 7,9+1,9 години і є коротшим у маленьких дітей. Загальний кліренс у дорослих – 0,63 мл/хв/кг. В основному виведення левоцетиризину та його метаболітів з організму відбувається із сечею (виводиться у середньому 85,4 % застосованої дози). З фекаліями виводиться лише 12,9 % прийнятої дози.

Очевидний кліренс левоцетиризину корелює з кліренсом креатиніну. Тому пацієнтам із помірними та тяжкими порушеннями функції нирок інтервали між прийомами левоцетиризину визначають з урахуванням кліренсу креатиніну. У разі анурії при термінальній стадії захворювання нирок загальний кліренс зменшується приблизно на 80 % порівняно з таким у разі нормальної функції нирок. 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 або до будь-якої з допоміжних речовин препарату, або до похідних піперазину.

Тяжка форма хронічної ниркової недостатності (кліренс креатиніну < 10 мл/хв).

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій

Дослідження з левоцетиризином щодо взаємодії не проводилися. Дослідження з цетиризином (сполука рацемату) показали, що одночасне застосування з антипірином, псевдоефедриним, циметидином, кетоконазолом, еритроміцином, азитроміцином, гліпезидом або діазепамом не чинить клінічно значущих несприятливих взаємодій. Сумісне застосування з теофіліном (400 мг на добу) знижує на 16 % загальний кліренс цетиризину (кінетика теофіліну не змінюється). При дослідженні багаторазового введення ритонавіру (600 мг 2 рази на добу) та цетиризину (10 мг на добу) ступінь експозиції цетиризину збільшувався приблизно на 40 %, тоді як розподіл ритонавіру дещо змінювався (11 %) до паралельного застосування цетиризину. Немає даних щодо посилення ефекту седативних засобів при застосуванні у терапевтичних дозах. Але слід уникати застосування седативних засобів під час прийому препарату.

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 центральної нервової системи у вразливих пацієнтів може спричинити додаткове зниження пильності та здатності до виконання роботи.

Особливості застосування

З обережністю застосовувати пацієнтам із хронічною нирковою недостатністю (потрібна корекція режиму дозування) та пацієнтам літнього віку з нирковою недостатністю (можливе зниження клубочкової фільтрації). Під час застосування препарату слід утримуватися від вживання алкоголю (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

Призначаючи препарат за наявності у пацієнтів певних факторів, що провокують затримку сечі (наприклад, травми спинного мозку, гіперплазія передміхурової залози), необхідно брати до уваги, що левоцетирин збільшує ризик затримки сечі.

Антигістамінні препарати пригнічують відповідь на шкірну алергічну пробу, тому перед її проведенням прийом препарату необхідно припинити за 3 дні до дослідження (період виведення).

Свербіж може з'явитися після припинення застосування левоцетиризину, навіть якщо ці симптоми не були наявні до початку лікування. Симптоми можуть зникнути самостійно. У деяких випадках симптоми можуть бути інтенсивними і може знадобитися повторне застосування лікування після його припинення. Тільки у разі зникнення симптомів можна повторно розпочати лікування.

Препарат у вигляді таблеток не застосовувати дітям віком до 6 років, оскільки ця лікарська форма не дає змоги проводити необхідну корекцію режиму дозування. Даній категорії пацієнтів рекомендується застосування левоцетиризину у лікарській формі, придатній для застосування у педіатрії.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами

Слід утримуватися від керування автотранспортом або роботи з іншими механізмами на період лікування препаратом.

Застосування у період вагітності або годування груддю

Левоцетиризин протипоказаний у період вагітності.

Цетиризин проникає у грудне молоко, тому у разі необхідності застосування препарату годування груддю слід припинити.

Фертильність

Немає клінічних даних (включаючи дослідження на тваринах) щодо впливу левоцетиризину на фертильність.

Спосіб застосування та дози

Препарат застосовують дорослим і дітям віком від 6 років внутрішньо у добовій дозі 5 мг 1 раз на добу. Таблетки приймають незалежно від вживання їжі. Таблетку необхідно ковтати цілою, запиваючи невеликою кількістю води.

Хворим літнього віку з нормальною функцією нирок корекція дози препарату не потрібна. Хворим із порушеною функцією нирок розрахунок дози необхідно проводити з урахуванням кліренсу креатиніну відповідно до таблиці, представленої нижче.

Кліренс креатиніну (КК, мл/хв) потрібно оцінити за вмістом креатиніну в сироватці крові (мг/дл) за допомогою такої формули:

$$\text{КК} = \frac{[140 - \text{вік (роки)}] \times \text{маса тіла (кг)} (\times 0,85 \text{ для жінок})}{72 \times \text{креатинін сироватки крові (мг/дл)}}$$

Корекція дози препарату для хворих із порушеною функцією нирок

Функція нирок	Кліренс креатиніну, мл/хв	Доза та кількість прийомів
Нормальна функція нирок	≥ 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 2 доби
Порушення тяжкого ступеня	< 30	5 мг 1 раз на 3 доби
Кінцева стадія захворювання нирок Пацієнти, які перебувають на діалізі	< 10	Протипоказано

Дітям із 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 із печінковою та нирковою недостатністю коригувати режим дозування слід відповідно до наведеної вище таблиці.

Тривалість застосування. Пацієнтів із періодичним алергічним ринітом (тривалість симптомів захворювання становить < 4 дів на тиждень або протягом менше 4 тижнів) слід лікувати відповідно до захворювання та анамнезу; лікування можна припинити, якщо симптоми зникнуть, та можна відновити знову при повторному виникненні симптомів.

У разі стійкого алергічного риніту (тривалість симптомів захворювання становить > 4 дів на тиждень та протягом більше 4 тижнів) у період контакту з алергенами пацієнту може бути запропонована постійна терапія. При хронічних захворюваннях (хронічний алергічний риніт, хронічна кропив'янка) тривалість

лікування становить до 1 року (дані доступні з клінічних досліджень при застосуванні рацемату).

Діти

Препарат у вигляді таблеток не застосовувати дітям віком до 6 років, оскільки ця лікарська форма не дає змоги проводити необхідну корекцію режиму дозування. Даній категорії пацієнтів рекомендується застосування левоцетиризину у лікарській формі, придатній для використання у педіатрії.

Передозування

Симптоми. Симптоми передозування можуть включати сонливість у дорослих та початкове збудження і підвищену дратівливість з подальшою сонливістю у дітей.

Лікування. Специфічного антидоту до левоцетиризину немає. У разі появи симптомів передозування рекомендується симптоматична та підтримуюча терапія. Слід розглянути необхідність промивання шлунка через короткий час після застосування препарату. Гемодіаліз для виведення левоцетиризину з організму не ефективний.

Побічні реакції

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 гепатобіліарної системи: гепатит.

З боку сечовидільної системи: дизурія, затримка сечі.

З боку імунної системи: гіперчутливість, у тому числі анафілаксія.

З боку дихальної системи: задишка.

З боку травного 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 кістково-м'язової системи: міалгія, артралгія.

Лабораторні показники: збільшення маси тіла, відхилення функціональних печінкових проб від норми.

З боку обміну речовин: підвищений апетит.

Загальні порушення та стан у місці введення: набряк.

Опис окремих побічних реакцій

Повідомлялось про свербіж після припинення застосування левоцетиризину.

Термін придатності

2 роки.

Умови зберігання

Зберігати при температурі не вище 25°C в оригінальній упаковці.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка

По 10 таблеток у блістері, по 1 блістеру в картонній упаковці.

Категорія відпуску

Без рецепта.

Виробник

Сімпекс Фарма Пвт. Лтд.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності

C7 по C13 та C59 по C64, Центр Розвитку Сіггаді (СІДКУЛ), Сіггаді, Котдвар-246149 Дістт. Паурі Гархавал, Уттараканд, Індія.

Джерело інструкції

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