

## **Склад**

*діюча речовина:* левоцетиризину дигідрохлорид;

1 таблетка містить левоцетиризину дигідрохлориду 5 мг;

*допоміжні речовини:* целюлоза мікрокристалічна, натрію кроскармелоза, лактози моногідрат, кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат, покриття Instacoat Universal White A05G10679: гіпромелоза, поліетиленгліколь, титану діоксид (E 171).

## **Лікарська форма**

Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

*Основні фізико-хімічні властивості:* двоопуклі таблетки овальної форми, вкриті плівковою оболонкою, від білого до майже білого кольору з маркуванням M і 17, розділеним лінією розлому на одній стороні і з лінією розлому на іншій стороні.

## **Фармакотерапевтична група**

Антигістамінні засоби для системного застосування. Похідні піперазину. Левоцетиризин. Код АТХ R06A E09.

## **Фармакодинаміка**

Левоцетиризин – це активний енантіомер цетиризину, що належить до групи антигіста-мінних препаратів. Фармакологічна дія зумовлена блокуванням  $H_1$ -гістамінових рецепторів. Антигістамінна активність левоцетиризину була описана в дослідженнях на тваринах і за участю людини.

*In vitro* дослідження показали, що левоцетиризин має спорідненість з людським рецептором  $H_1$  у 2 рази вищу, ніж цетиризин ( $K_i = 3$  нмоль/л проти 6 нмоль/л, відповідно).

Впливає на гістамінозалежну 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.

## **Фармакокінетика**

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

### *Абсорбція.*

Левоцетиризин швидко та інтенсивно всмоктується після перорального застосування. У дорослих пікові концентрації в плазмі досягаються приблизно через 50 хвилин після прийому таблетки перорально. Рівноважна концентрація у крові досягається після 2 днів прийому препарату.

Пікові концентрації, як правило, становлять 270 нг/мл і 308 нг/мл після одноразового і повторного застосування 5 мг один раз на добу відповідно.

Їжа не впливає на ступінь всмоктування (AUC) левоцетиризину таблеток, але  $T_{max}$  становить 1,25 год і  $C_{max}$  була знижена на 36% після введення їжі з високим вмістом жиру; тому левоцетиризин можна застосовувати з їжею або без.

*Розподіл.* Середнє зв'язування левоцетиризину з білками плазми *in vitro* в діапазоні від 91 до 92%. Після перорального прийому середній об'єм розподілу становить приблизно

0,4 л/кг.

*Метаболізм.* Ступінь метаболізму левоцетиризину у людей менше 14%. Процес метаболізму включає оксидацію, N- та O-деалкілування і сполучення з таурином. Деалкілування, у першу чергу, відбувається з участю цитохрому CYP 3A4, тоді як у процесі оксидації беруть участь численні та (або) невизначені ізоформи CYP.

*Виведення.* Період напіввиведення препарату з плазми у дорослих здорових добровольців становить від 8 до 9 годин після прийому таблетки перорально, і загальний кліренс у дорослих становить приблизно 0,63 мл/хв/кг. В основному виведення левоцетиризину та його метаболітів з організму відбувається із сечею (виводиться у середньому 85,4 % застосованої дози препарату). З калом виводиться лише 12,9 % застосованої дози. Левоцетиризин виділяється як шляхом клубочкової фільтрації, так і завдяки активній канальцевій секреції. Нирковий кліренс левоцетиризину корелює з кліренсом креатиніну. У хворих з нирковою недостатністю кліренс левоцетиризину знижується.

### **Показання**

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

### **Протипоказання**

- Підвищена чутливість до левоцетиризину або до будь-якого іншого компонента препарату, або до будь-яких похідних піперазину.
- Тяжка форма хронічної ниркової недостатності (кліренс креатиніну < 10 мл/хв). Необхідність гемодіалізу.
- Рідкісні спадкові стани непереносимості галактози, лактазної недостатності або порушення засвоєння глюкози і галактози.

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

Дані *in vitro* показують, що застосування левоцетиризину навряд чи призведе до фармакокінетичних взаємодій через інгібування або індукцію ферментів печінки, що метаболізують лікарські засоби.

Фармакокінетичні дослідження взаємодії, виконані з рацемічним цетиризином, показали, що цетиризин не виявляє клінічно значущих несприятливих взаємодій з *антипірином, псевдоефедрином, еритроміцином, азитроміцином, кетоконазолом і циметидином.*

Відзначалось зниження (~ 16%) кліренсу цетиризину, викликаного сумісним застосуванням із 400 мг *теофіліну*. Цілком можливо, що більш високі дози теофіліну можуть мати більший ефект.

*Ритонавір* збільшував ступінь експозиції цетиризину приблизно на 42%, що супроводжується збільшенням періоду напіввиведення (53%) та зменшенням кліренсу (29%) цетиризину. Розподіл ритонавіру не зазнав змін у разі сумісного застосування із цетиризином.

Ступінь поглинання левоцетиризину не зменшується з *їжею*, хоча знижується швидкість абсорбції.

### **Особливості застосування**

Не перевищувати зазначену дозу. З обережністю застосовувати пацієнтам із хронічною нирковою недостатністю (потрібна корекція режиму дозування) та пацієнтам літнього віку з нирковою недостатністю (можливе зниження клубочкової фільтрації). Наявність у пацієнтів певних факторів, що провокують затримку сечі (таких як травми спинного мозку, гіперплазія передміхурової залози), необхідно брати до уваги при призначенні препарату, оскільки левоцетиризин може збільшити ризик затримки сечі.

Одночасного застосування левоцетиризину з алкоголем або іншими депресантами центральної нервової системи слід уникати, оскільки можливі додаткові порушення центральної нервової системи та зниження уваги. Під час

застосування препарату слід утримуватися від вживання алкоголю. З обережністю слід призначати левоцетиризин хворим на епілепсію і пацієнтам із ризиком судом.

### **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 для застосування у період вагітності. Цетиризин проникає у грудне молоко, тому при необхідності застосування препарату годування груддю слід припинити.

### **Спосіб застосування та дози**

Приймати незалежно від вживання їжі, запиваючи невеликою кількістю води.

#### Дорослі та діти віком від 12 років

5 мг 1 раз на добу (1 таблетка 1 раз на добу) ввечері. Деяким пацієнтам може бути достатньо 2,5 мг один раз на добу у вечірній час.

#### Діти віком від 6 до 11 років

Рекомендована доза левоцетиризину становить 2,5 мг один раз на добу у вечірній час. Дозу 2,5 мг не слід перевищувати, оскільки системний вплив 5 мг приблизно в два рази більший, ніж у дорослих.

#### Пацієнти літнього віку

За умови нормальної функції нирок немає потреби знижувати дозу пацієнтам літнього віку.

#### Пацієнти з порушеннями функції нирок

Для хворих із хронічною нирковою недостатністю розрахунок дози необхідно проводити з урахуванням кліренсу креатиніну відповідно до таблиці.

Ступінь порушення функції нирок	Кліренс креатиніну (мл/хв)	Доза та частота

Порушення легкого ступеня	50 - 80	2,5 мг 1 раз на до
Порушення помірного ступеня	30 - 50	2,5 мг 1 раз на 2 д
Тяжкий ступінь	<30	2,5 мг 1 раз на 3 -
Термінальна стадія - пацієнти, які підлягають діалізу	<10	5 мг 1 раз на 3 до Протипоказано

### Пацієнти з порушеннями функції печінки

Пацієнтам, які мають лише порушення функції печінки, немає потреби коригувати дозу.

### Пацієнти з порушеннями функції печінки і нирок

Пацієнтам, які мають порушення функції і печінки, і нирок, рекомендується коригувати дозу відповідно до наведеної вище таблиці.

Тривалість лікування пацієнтів із періодичним алергічним ринітом (тривалість симптомів захворювання становить < 4 днів на тиждень або протягом менше 4 тижнів) залежить від захворювання та анамнезу; лікування можна припинити, якщо симптоми зникнуть, та можна відновити при повторному виникненні симптомів. У разі стійкого алергічного риніту (тривалість симптомів захворювання становить > 4 днів на тиждень та протягом більше 4 тижнів) у період контакту з алергенами пацієнту можна запропонувати постійну терапію. 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 застосовують дітям від 6 років.

### **Передозування**

#### Симптоми.

Симптоми передозування можуть включати сонливість у дорослих та нервово збудження і неспокій у дітей, що змінюється сонливістю.

#### 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**

Побічні реакції подано за класами систем органів та частотою виникнення: дуже часто ( $\geq 1/10$ ), часто ( $\geq 1/100 - < 1/10$ ), нечасто ( $\geq 1/1000 - < 1/100$ ), рідко ( $\geq 1/10000 - < 1/1000$ ), дуже рідко ( $< 1/10\ 000$ ).

*З боку крові та лімфатичної системи:* дуже рідко – тромбоцитопенія.

*З боку імунної системи:* рідко – гіперчутливість; дуже рідко – анафілактичний шок.

*Психічні порушення:* часто – сонливість, нечасто – збудження, рідко – агресія, запаморочення, депресія, безсоння, дуже рідко – тик, галюцинації, суїцидальні думки.

*З боку нервової системи:* часто – головний біль, запаморочення; нечасто – парестезії; рідко – судоми, розлади руху; дуже рідко – сонливість, втомлюваність; дуже рідко – дисгевзія, непритомність, тремор, вертиго.

*З боку органів зору:* дуже рідко – порушення зору, нечіткість зору.

*З боку серця:* рідко – тахікардія, посилене серцебиття.

*З боку дихальної системи, органів грудної клітки та середостіння:* часто – фарингіт і

нежить у дітей, рідко – задишка.

*З боку травної системи:* часто – нудота, біль у животі, сухість у роті, дуже рідко – діарея, блювання, запор, підвищений апетит.

*З боку гепатобіліарної системи:* рідко – аномальні функції печінки (збільшення трансаміназ, лужної фосфатази,  $\gamma$ -GT і білірубину), гепатит.

*З боку шкіри та підшкірної клітковини:* нечасто – свербіж, висипання; рідко – кропив'янка; дуже рідко – ангіоневротичний набряк, стійкий медикаментозний висип.

*З боку нирок та сечовидільної системи:* дуже рідко – дизурія, затримка сечі, енурез.

*Загальні порушення:* часто – втома, нечасто – астенія, нездужання, міалгія, рідко – набряки.

*Результати досліджень:* збільшення маси тіла.

### **Термін придатності**

2 роки.

### **Умови зберігання**

Зберігати при температурі не вище 30°C в оригінальній упаковці.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

### **Упаковка**

По 30 таблеток у флаконі, по 1 флакону у картонній упаковці.

### **Категорія відпуску**

Без рецепта.

### **Виробник**

МАКЛЕОДС ФАРМАСЬЮТИКАЛС ЛІМІТЕД.

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

Віледж Тхеда, ПО Лодхімайра, Техсіл Бадді, Дістрікт Солан, Хімачал Прадеш, 174101, Індія.

### **Джерело інструкції**

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