

## **Состав**

*действующее вещество:* levocetirizine;

1 таблетка содержит левоцетиризина дигидрохлорида 5 мг;

*вспомогательные вещества:* целлюлоза микрокристаллическая, крахмал кукурузный, (К-30), кросповидон, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

## **Лекарственная форма**

Таблетки.

*Основные физико-химические свойства:* овальные таблетки от белого до почти белого цвета.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Антигистаминные средства для системного применения. Производные пиперазина.

Код АТХ R06A E09.

## **Фармакодинамика**

Левоцетиризин - это активный стабильный R-энантиомер цетиризина, относится к группе конкурентных антагонистов гистамина. Фармакологическое действие обусловлено блокированием H<sub>1</sub>-рецепторов. Родство с H<sub>1</sub>-рецепторов в левоцетиризина в 2 раза выше, чем в цетиризина. Влияет на гистаминзависимую стадию развития аллергической реакции, уменьшает миграцию эозинофилов, сосудистую проницаемость, ограничивает высвобождение медиаторов воспаления. Предупреждает развитие и облегчает течение аллергических реакций, оказывает антиэкссудативное, противоаллергическое, противовоспалительное действие, практически не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия. В терапевтических дозах практически не оказывает седативного эффекта.

## **Фармакокинетика**

Фармакокинетические параметры левоцетиризина имеют линейную зависимость и почти не отличаются от таковых у цетиризина.

*Абсорбция.* Препарат быстро всасывается при приеме внутрь, прием пищи не влияет на степень всасывания, но снижает его скорость; биодоступность - 100%. У 50% больных действие препарата развивается через 12 мин после приема однократной дозы, а в 95% - через 0,5-1 час. Максимальная концентрация (С<sub>max</sub>) в сыворотке достигается через 50 мин после однократного приема внутрь терапевтической дозы и сохраняется в течение 2 дней. С<sub>max</sub> составляет 207 нг / мл после однократного применения и 308 нг / мл - после повторного применения в дозе 5 мг соответственно.

*Распределение.* Отсутствует информация о распределении препарата в тканях человека, а также о проникновении левоцетиризина сквозь гематоэнцефалический барьер. Объем распределения - 0,4 л / кг. Связывание с белками плазмы крови - 90%.

*Метаболизм.* В организме человека метаболизируется около 14% левоцетиризина. Процесс метаболизма включает оксидацию, N- и O-деалкилирования и сообщения с таурином. Деалкилирования в первую очередь происходит с участием цитохрома СYP 3A4, тогда как в процессе окисления участвуют многочисленные и (или) неопределенные изоформы СYP. Левоцетиризин не влияет на активность цитохромных изоферментов 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4 в концентрациях, значительно превышающих максимальные после принятия дозы 5 мг перорально. Учитывая низкую степень метаболизма и отсутствие способности к подавлению метаболизма, взаимодействие левоцетиризина с другими веществами (и наоборот) маловероятно.

*Вывод.* Экскреция препарата происходит в основном за счет клубочковой фильтрации и активной канальцевой секреции. Период полувыведения препарата из плазмы крови у взрослых составляет 7,9 + 1,9 часа и короче у маленьких детей. Общий клиренс у взрослых - 0,63 мл / мин / кг. В основном вывода левоцетиризина и его метаболитов из организма с мочой (выводится в среднем 85,4% дозы). С фекалиями выводится 12,9% принятой дозы.

Очевидный клиренс левоцетиризина коррелирует с клиренсом креатинина. Поэтому пациентам с умеренными и тяжелыми нарушениями функции почек интервалы между приемами левоцетиризина определяют с учетом клиренса креатинина. В случае анурии при терминальной стадии заболевания почек общий клиренс уменьшается примерно на 80% по сравнению с таким при нормальной функции почек. Количество левоцетиризина, что выводится при стандартной 4-часовой процедуры гемодиализа, составила <10%.

## **Показания**

Симптоматическое лечение аллергического ринита (в том числе круглогодичного аллергического ринита) и крапивницы.

## **Противопоказания**

Повышенная чувствительность к левоцетиризину или к любой из вспомогательных веществ препарата или к производным пиперазина.

Тяжелая форма хронической почечной недостаточности (клиренс креатинина <10 мл/мин).

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

Исследования по левоцетиризину по взаимодействию не проводились. Исследования по цетиризину (соединение рацемата) показали, что одновременное применение с антипирином, псевдоэфедрина, циметидином, кетоконазолом, эритромицином, азитромицином, глипезидом или диазепамом не оказывает клинически значимых неблагоприятных взаимодействий. Совместное применение с теофиллином (400 мг в сутки) снижает на 16% общий клиренс цетиризина (кинетика теофиллина не изменяется). При исследовании многократного введения ритонавира (600 мг 2 раза в сутки) и цетиризина (10 мг в сутки) степень экспозиции цетиризина увеличивался примерно на 40%, тогда как распределение ритонавира несколько менялся (11%) к параллельному применению цетиризина. Нет данных по усилению эффекта седативных средств при применении в терапевтических дозах. Но следует избегать применения седативных средств во время приема препарата.

Прием пищи не влияет на степень всасывания препарата, но одновременное употребление пищи снижает скорость абсорбции.

Одновременное применение цетиризина или левоцетиризина и алкоголя или других депрессантов центральной нервной системы в уязвимых пациентов может вызвать дополнительное снижение бдительности и способности к выполнению работы.

## **Особенности применения**

С осторожностью применять пациентам с хронической почечной недостаточностью (требуется коррекция режима дозирования) и пациентам пожилого возраста с почечной недостаточностью (возможно снижение клубочковой фильтрации). Во время применения препарата следует воздерживаться от употребления алкоголя (см. Раздел «Взаимодействие с

другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Назначая препарат при наличии у пациентов определенных факторов, провоцирующих задержку мочи (например, травмы спинного мозга, гиперплазия предстательной железы), необходимо принимать во внимание, что левоцетиризин увеличивает риск задержки мочи.

Антигистаминные препараты подавляют ответ на кожную аллергическую пробу, поэтому перед ее проведением прием препарата необходимо прекратить за 3 дня до исследования (период вывода).

Зуд может появиться после отмены левоцетиризина, даже если эти симптомы не присутствовали до начала лечения. Симптомы могут исчезнуть самостоятельно. В некоторых случаях симптомы могут быть интенсивными и может потребоваться повторное применение лечения после его прекращения. Только в случае исчезновения симптомов можно повторно начать лечение.

Препарат в виде таблеток не применять детям до 6 лет, поскольку эта лекарственная форма не позволяет проводить необходимую коррекцию режима дозирования. Данной категории пациентов рекомендуется применение левоцетиризина в лекарственной форме, пригодной для применения в педиатрии.

### **Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами**

Следует воздерживаться от управления автотранспортом или работы с механизмами на период лечения.

### **Применение в период беременности или кормления грудью**

Левоцетиризин противопоказан в период беременности.

Цетиризин проникает в грудное молоко, поэтому при необходимости применения препарата кормление грудью следует прекратить.

### **Фертильность**

Нет клинических данных (включая исследования на животных) по влиянию левоцетиризина на фертильность.

### **Способ применения и дозы**

Препарат применяют взрослым и детям старше 6 лет внутрь в дозе 5 мг 1 раз в сутки. Таблетки принимают независимо от приема пищи. Таблетку необходимо глотать целиком, запивая небольшим количеством воды.

Больным пожилого возраста с нормальной функцией почек коррекция дозы препарата не требуется. Больным с нарушенной функцией почек расчет дозы необходимо проводить с учетом клиренса креатинина согласно таблице, представленной ниже.

Клиренс креатинина (КК, мл/мин) нужно оценить по содержанию креатинина в сыворотке крови (мг/дл) с помощью следующей формулы:

$$\text{КК} = \frac{[140 - \text{возраст (года)}] \times \text{масса тела (кг)} (\times 0,85 \text{ для женщин})}{72 \times \text{креатинин сыворотки крови (мг/дл)}}$$

Коррекция дозы для больных с нарушенной функцией почек

<b>Функция почек</b>	<b>Клиренс креатинина, мл/мин</b>	<b>Доза и количество приемов</b>
Нормальная функция почек	≥ 80	5 мг 1 раз в сутки
Нарушение легкой степени	50-79	5 мг 1 раз в сутки
Нарушение умеренной степени	30-49	5 мг 1 раз в 2 суток
Нарушение тяжелой степени	< 30	5 мг 1 раз в 3 суток
Конечная стадия заболевания почек Пациенты, находящиеся на диализе	< 10	противопоказано

Детям с нарушениями функции почек дозу следует корректировать индивидуально с учетом почечного клиренса и массы тела.

Больным только с печеночной недостаточностью коррекция режима дозирования не требуется. Больным с печеночной и почечной недостаточностью корректировать режим дозирования следует в соответствии с приведенной выше таблицы.

Длительность применения. Пациентов с периодическим аллергическим ринитом (продолжительность симптомов заболевания составляет <4 дней в неделю или в течение менее 4 недель) следует лечить в соответствии с заболеванием и анамнеза; лечение можно прекратить, если симптомы исчезнут, и можно восстановить снова при повторном возникновении симптомов.

В случае устойчивого аллергического ринита (продолжительность симптомов заболевания составляет > 4 дней в неделю и в течение более 4 недель) в период контакта с аллергенами пациенту может быть предложена постоянная терапия. При хронических заболеваниях (хронический аллергический ринит, хроническая крапивница) продолжительность лечения составляет до 1 года (данные доступны по клиническим исследованиям при применении рацемата).

## **Дети**

Препарат в виде таблеток не применять детям до 6 лет, поскольку эта лекарственная форма не позволяет проводить необходимую коррекцию режима дозирования. Данной категории пациентов рекомендуется применение левоцетиризина в лекарственной форме, пригодной для использования в педиатрии.

## **Передозировка**

*Симптомы.* Симптомы передозировки могут включать сонливость у взрослых и первоначальное возбуждение и повышенную раздражительность с последующей сонливостью у детей.

*Лечение.* Специфического антидота к левоцетиризину нет. В случае появления симптомов передозировки рекомендуется симптоматическая и поддерживающая терапия. Следует рассмотреть необходимость промывание желудка через короткое время после применения препарата. Гемодиализ для выведения левоцетиризина из организма не эффективен

## **Побочные реакции**

*Со стороны нервной системы:* сонливость, головная боль, повышенная утомляемость, слабость, астения, судороги, парестезии, головокружение, обморок, тремор, дисгевзия.

*Со стороны психики:* нарушение сна, возбуждение, галлюцинации, депрессия, агрессия, бессонница, суицидальные мысли.

*Со стороны сердца:* тахикардия, тахикардия.

*Со стороны органа зрения: нарушение зрения, нечеткость зрения.*

*Со стороны органов слуха и равновесия: вертиго.*

*Со стороны пищеварительной системы: гепатит.*

*Со стороны мочевыделительной системы: дизурия, задержка мочи.*

*Со стороны иммунной системы: гиперчувствительность, в том числе анафилаксия.*

*Со стороны дыхательной системы: одышка.*

*Со стороны пищеварительного тракта: диарея, рвота, запор, сухость во рту, тошнота, боль в животе.*

*Со стороны кожи и подкожных тканей: ангионевротический отек, устойчивые медикаментозные высыпания, зуд, сыпь, крапивница.*

*Со стороны костно-мышечной системы: миалгия, артралгия.*

*Лабораторные показатели: увеличение массы тела, отклонения функции печени от нормы.*

*Со стороны обмена веществ: повышенный аппетит.*

*Общие нарушения и состояние в месте введения: отек.*

#### Описание отдельных побочных реакций

Сообщалось о зуд после отмены левоцетиризина.

#### **Срок годности**

2 года.

#### **Условия хранения**

Хранить при температуре не выше 25 °С в оригинальной упаковке.

Хранить в недоступном для детей месте.

#### **Упаковка**

По 10 таблеток в блистере, по 1 блистеру в картонной упаковке.

**Категория отпуска**

Без рецепта.

**Производитель**

Симпекс Фарма Пвт. Лтд.

**Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

С7 по С13 и С59 по С64, Центр Развития Сиггади (СИДКУЛ), Сиггади, Котдвара-246149 Дистт. Паури Гархавал, Уттараканд, Индия.

**Источник инструкции**

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).