

Состав

действующее вещество: levocetirizine;

1 таблетка, покрытая оболочкой, содержит левоцетиризина дигидрохлорида 5 мг;

вспомогательные вещества: натрия кроскармеллоза, целлюлоза микрокристаллическая, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат пленочная оболочка Opadry white (03K58884): гипромеллоза, титана диоксид (E 171), триацетин.

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства: белого или почти белого цвета, овальные, плоские с обеих сторон таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Фармакотерапевтическая группа

Антигистаминные средства для системного применения. Производные пиперазина.

Код АТХ R06A E09.

Фармакодинамика

Левецетиризин - это активный стабильный R-энантиомер цетиризина, относится к группе конкурентных антагонистов гистамина. Фармакологическое действие обусловлено блокированием H₁гистаминовых рецепторов. Родство с H₁-рецепторов в левецетиризина в 2 раза выше, чем в цетиризина. Он влияет на гистаминзависимую стадию развития аллергической реакции, уменьшает миграцию эозинофилов, сосудистую проницаемость, ограничивает высвобождение медиаторов воспаления. Предупреждает развитие и ослабляет проявления аллергических реакций, оказывает противоотечное, противоаллергическое, противовоспалительное действие, почти не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия.

Фармакокинетика

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

Абсорбция.

Препарат быстро абсорбируется после перорального применения. Степень всасывания препарата не зависит от дозы и не меняется с приемом пищи, но скорость абсорбции снижается, максимальная концентрация (C_{max}) достигает своего максимального значения позже. Равновесная концентрация в крови достигается после 2 дней приема препарата. C_{max} в плазме крови достигается через 50 минут и составляет 270 нг/мл после однократного применения и 308 нг/мл - после повторного применения в дозе 5 мг в сутки. У 50% больных действие препарата развивается через 12 минут после приема однократной дозы, а в 95% - через 0,5-1 час. Биодоступность достигает 100%.

Распределение.

Отсутствует информация о распределении препарата в тканях человека, а также о проникновении левоцетиризина сквозь гематоэнцефалический барьер. В исследованиях наибольшая концентрация зафиксирована в печени и почках, а самая низкая - в тканях центральной нервной системы. Объем распределения - 0,4 л/кг. Связывание с белками плазмы крови - 90%.

Метаболизм.

В организме человека метаболизму подвергается около 14% левоцетиризина. Процесс метаболизма включает оксидацию, N- и O-деалкилирования и сообщения с таурином. Деалкилирования, в первую очередь, происходит при участии цитохрома CYP 3A4, тогда как в процессе окисления участвуют многочисленные и (или) неопределенные изоформы CYP. Левоцетирин не влияет на активность цитохромных изоферментов 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4 в концентрациях, значительно превышающих максимальные после приема дозы 5 мг перорально. Учитывая низкую степень метаболизма и отсутствие способности к подавлению других процессов 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 (T_{1/2}) составляет 7,9 ± 1,9 часа. 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 препарата). С фекалиями выводится только 12,9% дозы препарата.

Клиренс левоцетиризина коррелирует с клиренсом креатинина. Поэтому для пациентов с умеренными и тяжелыми нарушениями функции почек рекомендуется подбирать режим дозирования левоцетиризина с учетом клиренса креатинина. В случае анурии при конечной терминальной стадии заболевания почек общий клиренс организма пациентов по сравнению с общим клиренсом организма у лиц без таких нарушений уменьшается примерно на 80%. Количество левоцетиризина, что выводился 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, цетиризину, гидроксизину или к любым другим производным пиперазина, или к любому другому компоненту препарата.

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

Редкая наследственная непереносимость галактозы, лактазная недостаточность или нарушение усвоения глюкозы и галактозы.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Исследование левоцетиризина по взаимодействию с другими препаратами не проводилось. Исследование рацемата цетиризина показали, что одновременное применение с антипирином, псевдоэфедрина, циметидином, кетоконазолом, эритромицином, азитромицином, глипизидом или диазепамом не вызывает клинически значимых неблагоприятных взаимодействий.

Совместное применение с теофиллином (400 мг в сутки) снижает на 16% общий клиренс левоцетиризина (кинетика теофиллина не изменяется). В исследовании многократного применения 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%) при одновременном применении с цетиризином.

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

Нет данных по усилению эффектов седативных средств при применении в терапевтических дозах. Но следует избегать применения седативных средств во время приема препарата.

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 (необходима коррекция режима дозирования) и пациентам пожилого возраста (из-за возможного снижения клубочковой фильтрации).

Во время применения препарата следует воздерживаться от употребления алкоголя.

Назначая препарат, необходимо обратить внимание на наличие у пациентов определенных факторов, провоцирующих задержку мочи (таких как травмы спинного мозга, гиперплазия предстательной железы), поскольку левоцетиризин увеличивает риск задержки мочи.

Следует избегать применения седативных средств во время приема препарата.

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

Следует воздерживаться от управления автотранспортом или другими механизмами во время лечения.

Применение в период беременности или кормления грудью

Левоцетиризин противопоказан в период беременности. Препарат проникает в грудное молоко и поэтому, при необходимости применения, кормление грудью следует прекратить.

Способ применения и дозы

репарат назначают взрослым и детям старше 6 лет по 1 таблетке 1 раз в сутки. Принимать независимо от приема пищи; таблетку следует глотать не

разжевывая, запивая небольшим количеством воды.

Для больных пожилого возраста с нормальной функцией почек коррекция дозы препарата не требуется.

Пациентам с нарушенной функцией почек расчет дозы необходимо проводить с учетом клиренса креатинина, согласно таблице приведенной ниже.

Коррекция дозы для больных с нарушенной функцией почек

Функция почек	Клиренс креатинина, мл/мин	Доза и количество приемов
Нормальная функция почек	≥ 80	5 мг 1 раз в сутки
Нарушение легкой степен	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 препарата необходимо скорректировать индивидуально с учетом почечного клиренса и массы тела.

Пациентам с печеночной недостаточностью коррекция режима дозирования не требуется.

Больным с печеночной и почечной недостаточностью необходимо корректировать режим дозирования в соответствии с приведенной выше таблицы.

Длительность применения.

Пациентам с периодическим аллергическим ринитом (длительность проявления симптомов заболевания составляет <4 дней в неделю или менее 4 недель) следует применять препарат 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 (длительность проявления симптомов заболевания составляет > 4 дней в неделю или более 4 недель) в период контакта с аллергенами врач может назначить постоянную терапию. При хронических заболеваниях (хронический аллергический ринит, хроническая крапивница) продолжительность лечения составляет до 1 года.

Дети

Препарат в виде таблеток не следует применять детям до 6 лет, поскольку эта лекарственная форма не позволяет проводить необходимую коррекцию режима дозирования. Этой категории пациентов рекомендуется применять левоцетиризин в другой лекарственной форме.

Передозировка

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 приема препарата. Гемодиализ для выведения левоцетиризина из организма не является эффективным.

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 печени и желчевыводящих путей: гепатит.

Со стороны почек и мочевыделительной системы: дизурия, задержка мочи.

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

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: одышка.

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

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

Со стороны костно-мышечной системы: миалгия, артралгия.

Результаты исследований: увеличение массы тела, отклонения функции печени от нормы.

Нарушение питания и обмена веществ: повышенный аппетит.

Общие нарушения: отек.

Срок годности

2 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 ° С. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере, по 3 блистера в картонной пачке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

Эвертоджен Лайф Саенсиз Лимитед.

Evertogen Life Sciences Limited.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Плот №: Эс-8, Эс-9, Эс-13 / Пи и Эс-14 / Пи Те Ес Ай Ай Си, Фарма Эс И Зет, Грин Индастриал Парк Полепалли (Ви), Едчерла (Эм), Махабубнагар, Телангана , ИН-509301, Индия/

Plot No: S-8, S-9, S-13 / P & S-14 / P TSIIC, Pharma SEZ, Green Industrial Park, Polepally (V), Jadcherla (M), Mahabubnagar, Telangana, IN-509301, India

Источник инструкции

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