

## **Состав**

*действующее вещество:* левоцетиризина дигидрохлорид;

1 таблетка содержит 5 мг левоцетиризина дигидрохлорида (что соответствует 4,21 мг левоцетиризина);

*вспомогательные вещества:* целлюлоза кремниевая микрокристаллическая, гидроксипропилцеллюлоза низкозамещенная, лактоза, магния стеарат;

состав оболочки: Opadry II 33G28523 белый (гипромеллоза, титана диоксид (E 171), макрогол 3350, триацетилглицерин, лактоза).

## **Лекарственная форма**

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

*Основные физико-химические свойства:* белого или почти белого цвета круглые, умеренно двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, без запаха или почти без запаха, с гравировкой стилизованной буквы «E» с одной стороны и номером «281» - с другой.

## **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. Сродство к 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, почти не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия.

## **Фармакокинетика**

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

*Абсорбция.* Препарат после перорального применения быстро и интенсивно поглощается. Степень всасывания препарата не зависит от дозы и не меняется с приемом пищи, но максимальная концентрация (С<sub>мах</sub>) препарата уменьшается и достигает своего максимального значения позже. Биодоступность достигает 100%.

У 50% больных действие препарата развивается через 12 мин после приема однократной дозы, а в 95% - через 0,5-1 час. С<sub>мах</sub> в сыворотке крови достигается через 50 мин после однократного приема внутрь терапевтической дозы и сохраняется в течение 2 дней. С<sub>мах</sub> составляет 270 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. 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 метаболизм подвергается около 14% левоцетиризина. Процесс метаболизма включает оксидацию, N- и O-деалкилирования и сообщения с таурином. Деалкирования прежде всего 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 (T<sub>1/2</sub>) составляет 7,9 + 1,9 часа. T<sub>1/2</sub> 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% введенной дозы препарата). С фекалиями выводится только 12,9% дозы препарата.

Особые популяции

## *Нарушение функции почек*

Очевидный клиренс левоцетиризина для организма коррелирует с клиренсом креатинина. Поэтому для пациентов с умеренными и тяжелыми нарушениями функции почек рекомендуется подбирать интервалы между приемами левоцетиризина с учетом клиренса креатинина. При 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 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, цетиризина, гидроксизина, к любым другим производным пиперазина или к любой другой вспомогательного вещества препарата.

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

Редкие наследственные заболевания непереносимости галактозы, лактазная недостаточность или нарушение усвоения глюкозы и галактозы.

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

Исследования по левоцетиризин по взаимодействию (включая исследования с индукторами CYP3A4) не проводились.

Исследования по цетиризином (соединение рацемата) показали, что одновременное применение с антипирином, азитромицином, циметидином, диазепамом, эритромицин, глипизидом, кетоконазолом или псевдоэфедриом не оказывает клинически значимых неблагоприятных взаимодействий. Совместное применение с теофиллином (400 мг в сутки) снижает на 16% общий клиренс левоцетиризина (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%) до параллельного

введения цетиризина.

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

Левосетиризин не усиливает эффект алкоголя, однако у чувствительных пациентов одновременное применение Алерзина и алкоголя или других препаратов, угнетающих функцию центральной нервной системы, может влиять на функцию центральной нервной системы.

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

### **Особенности применения**

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

При наличии у пациентов определенных факторов, провоцирующих задержку мочи (например, травмы спинного мозга, гиперплазия предстательной железы) необходимо уделить внимание при определении дозы препарата, поскольку левосетиризин может увеличить риск задержки мочи.

Левосетиризин следует с осторожностью применять пациентам с эпилепсией и риском возникновения судорог, поскольку его применение может привести к усилению нападения.

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

Возможно появление зуда после отмены левосетиризина, даже если эти симптомы не присутствовали до начала лечения. Симптомы могут исчезнуть самостоятельно. В некоторых случаях симптомы могут быть интенсивными и может потребоваться повторное лечение. Только в случае исчезновения симптомов можно повторно начать лечение.

Препарат в виде таблеток не назначают детям в возрасте до 6 лет, поскольку эта лекарственная форма не позволяет проводить необходимую коррекцию режима дозирования. Данной категории пациентов рекомендуется назначить

левоцетиризин 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 во время лечения.

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

Левоцетиризин противопоказан в период беременности. Левоцетиризин 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 назначать взрослым и детям старше 6 лет.

Рекомендуемые дозы:

Взрослые и дети старше 12 лет: суточная доза составляет 5 мг (1 таблетка, покрытая оболочкой) 1 раз в сутки.

### *Пациенты пожилого возраста*

Больным пожилого возраста с нормальной функцией почек коррекция дозы препарата не требуется. Корректировка дозы рекомендуется пациентам пожилого возраста с нарушениями функции почек умеренной и тяжелой степени (см. Раздел «Почечная недостаточность»).

### *Почечная недостаточность*

Больным с нарушениями функции почек расчет дозы необходимо проводить с учетом клиренса креатинина в соответствии с таблицей.

Для применения этой таблицы дозировку необходимо оценить клиренс креатинина (КЛкр) пациента в миллилитрах в минуту. КЛкр (мл/мин) оценивают по содержанию креатинина в сыворотке крови (мг/дл) с помощью следующей формулы:

**КЛкр = [140 - возраст (годы)] x масса тела (кг) / 72 x креатинин сыворотки крови (мг/дл) (x 0,85 для женщин)**

Коррекция дозы для больных с нарушениями функции почек

Функция почек	КК, мл/мин	Доза и количество приемов
Нормальная функция почек	$\geq 80$	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 раза в 2 суток
Нарушение тяжелой степени	$< 30$	5 мг 1 раза в 3 суток
Конечная стадия заболевания почек. Пациенты, находящиеся на диализе $< 10$	$< 10$	Противопоказано

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

Специфических данных по применению детям с нарушениями функции почек нет.

*Печеночная недостаточность*

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

### *Педиатрическая популяция*

Дети в возрасте от 6 до 12 лет: рекомендуемая суточная доза - 5 мг (1 таблетка, покрытая оболочкой).

Для детей от 2 до 6 лет невозможно корректировать дозы препарата в лекарственной форме таблетка, покрытая оболочкой. Рекомендуется назначать левоцетиризин в лекарственной форме, пригодной для применения в педиатрии.

### Способ применения

Принимать таблетку внутрь, независимо от приема пищи. Таблетку необходимо глотать целиком, запивая небольшим количеством воды. Рекомендуется применять суточную дозу за один прием.

### *Длительность применения*

Пациентов с периодическим аллергическим ринитом (длительность проявлений симптомов заболевания составляет менее 4 суток в неделю или в течение менее 4 недель в году) 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 более 4 суток в неделю и в течение более 4 недель в году) в период контакта с аллергенами пациенту может быть предложена постоянная терапия. Существует клинический опыт применения левоцетиризина в течение не менее 6-месячного периода лечения.

При хронических заболеваниях (хронический аллергический ринит, хроническая крапивница) продолжительность лечения составляет до 1 года (данные доступны по клиническим исследованиям при применении цетиризина (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 применения 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 приема 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, жажливи сновидения.

*Со стороны сердца:* тахикардия, тахикардия.

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

*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 желудочно-кишечного 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, соединительной ткани и костей:*  
миалгия, артралгия.

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

*Нарушение питания и обмена веществ:* повышенный аппетит.

*Общие нарушения:* отек.

Прием препарата следует прекратить при появлении любого из вышеперечисленных побочных эффектов и когда причина его развития не может быть установлена однозначно.

#### Описание отдельных побочных реакций

Сообщалось о зуд после отмены левоцетиризина.

#### Сообщение о подозрения побочных реакции

Сообщение о подозреваемых побочных реакции после утверждения лекарственного средства является очень важным. Это позволяет наблюдать за соотношением польза/риск лекарственного средства. Медицинских работников просят сообщать о подозреваемых побочных реакции.

#### **Срок годности**

5 лет.

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

#### **Условия хранения**

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 30 ° C в недоступном для детей месте.

#### **Упаковка**

По 7 таблеток в блистере, по 2 блистера в картонной коробке.

#### **Категория отпуска**

Без рецепта.

#### **Производитель**

ЗАО Фармацевтический завод ЭГИС.

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

1165, г. Будапешт, ул. Бекеньфелди, 118-120, Венгрия.

**Источник инструкции**

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