

Состав

действующее вещество: levocetirizine;

1 таблетка содержит левоцетиризина дигидрохлорида 5 мг;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, лактоза, магния стеарат;

смесь для нанесения пленочной оболочки: гипромеллоза (Е 464), макрогол 400, титана диоксид (Е 171).

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства: таблетки, покрытые пленочной оболочкой, белого цвета, двояковыпуклые, продолговатые (длина 8 мм, ширина 4,5 мм), с одной стороны гравировка "Λ 11".

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 H₁-рецепторов. Сродство к H₁-рецепторов в левецетиризина 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 подавляет течение аллергических реакций, оказывает антиэкссудативное, противоаллергическое, противовоспалительное действие, почти не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия. В терапевтических дозах практически не оказывает седативного эффекта.

Фармакокинетика

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

Абсорбция.

Препарат после перорального введения быстро и интенсивно поглощается. Степень всасывания препарата не зависит от дозы и не меняется с приемом пищи, но максимальная концентрация (max) препарата уменьшается и достигает своего максимального значения позже. Биодоступность достигает 100%.

У 50% больных действие препарата развивается через 12 минут после приема однократной дозы, а в 95% - через 0,5 - 1 час. Максимальная концентрация (C_{max}) в сыворотке крови достигается через 50 минут после однократного приема внутрь терапевтической дозы. Равновесная концентрация в крови достигается после 2 дней приема препарата. Максимальная концентрация (C_{max}) 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 на животных 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 метаболизируется около 14% левоцетиризина. Процесс метаболизма включает оксидацию, N- и O-деалкилирования и сообщения с таурином. Деалкилирования в первую очередь происходит с участием цитохрома CYP 3A4, тогда как в процессе окисления участвуют многочисленные и (или) неопределенные изоформы CYP. 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 маловероятно.

Выведение.

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. Период полувыведения короче у маленьких детей. Общий клиренс у взрослых - 0,63 мл/мин/кг. В основном выведение левоцетиризина и его метаболитов из организма с мочой (выводится в среднем 85,4% дозы препарата). С фекалиями выводится только 12,9% дозы

препарата.

Средний общий клиренс составляет 0,63 мл/мин/кг. Поэтому у пациентов с умеренными и тяжелыми нарушениями функции почек рекомендуется подбирать интервалы между приемами 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 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 другой составляющей лекарственного препарата, а также к любым производным пиперазина.

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

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

Особые меры безопасности.

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 пациенту, необходимо обратить внимание на наличие определенных факторов, провоцирующих задержку мочи (например, травмы спинного мозга, гиперплазия предстательной железы) так левоцетиризин увеличивает риск задержки мочи.

Левоцетиризин следует с осторожностью применять у пациентов с эпилепсией и риском возникновения судорог, поскольку его применение может привести к

усилению нападения.

Антигистаминные препараты подавляют ответ на кожную аллергическую пробу, прием препарата необходимо прекратить за 3 дня до ее проведения (период выведение).

Возможно появление зуда после отмены левоцетиризина, даже если этот симптом присутствовал до начала лечения. Симптом может исчезнуть самостоятельно. В некоторых случаях симптом может быть интенсивным и может возникнуть потребность в повторном лечении. Симптом должен исчезнуть после начала повторного лечения.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Исследования с левоцетиризином 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 псевдоэфедрина не оказывает клинически значимых неблагоприятных взаимодействий. При совместном применении с теофиллином (400 мг/сут) наблюдалось небольшое снижение (на 16%) общего клиренса левоцетиризина (распределение теофиллина не менялся). 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 применения 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.

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

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

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 нарушением функции почек умеренной и тяжелой степени (см. Раздел «Почечная недостаточность»).

Почечная недостаточность

Больным с нарушенной функцией почек расчет дозы необходимо проводить с учетом степени нарушения функции почек (КК) в соответствии с таблицей ниже.

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

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 степени	50 - 79	5 мг 1 раз в сутки

Нарушение умеренной степени	30 - 49	5 мг 1 раз в 2 суток
Нарушение тяжкого степеням	< 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 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 (продолжительность симптомов заболевания составляет <4 дней в неделю или 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 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 левоцетиризин 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 применения препарата. Гемодиализ для выведения левоцетиризина из организма не эффективен.

Побочные реакции

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

Нарушение питания и обмена веществ: повышенный аппетит.

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, кошмарные сновидения.

Со стороны сердца: тахикардия, тахикардия.

Со стороны органа зрения: нарушение зрения, нечеткость зрения, вращательные движения глаз.

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 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.

Общие нарушения и состояние в месте введения отек.

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

Описание отдельных побочных реакций

Сообщалось про зуд после отмены левоцетиризина.

Сообщение о подозреваемых побочных реакций

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

Срок годности

3 года.

Условия хранения

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

Упаковка

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

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

АО «Адамед Фарма».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

ул. Марш. Дж. Пилсудского 5, 95-200, Пабьянице, Польша.

Источник инструкции

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