

## **Состав**

*действующее вещество:* левоцетиризин;

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

*вспомогательные вещества:* целлюлоза микрокристаллическая (тип 102), лактоза, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат;

*оболочка:* опадри белый (гипромеллоза (E 464), титана диоксид (E 171), макрогол 400).

## **Лекарственная форма**

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

*Основные физико-химические свойства:* белого или почти белого цвета продолговатые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, с гравировкой «R23» с одной стороны. Длина около 8 мм, ширина около 4,5 мм.

## **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 и селективных антагонистов H<sub>1</sub>-рецепторов.

Фармакологическое действие обусловлено блокированием H<sub>1</sub>-рецепторов.

Сродство к H<sub>1</sub>-рецепторам 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.

Данные ЭКГ не показали соответствующего влияния левоцетиризина на интервал QT.

## **Фармакокинетика**

Фармакокинетические параметры левоцетиризина имеют линейную зависимость, не зависят от дозы и времени и имеют низкую вариабельность у разных пациентов. Фармакокинетический профиль при введении единого энантиомера такой же, как и при применении цетиризина. В процессе абсорбции или вывода не наблюдается хоральная инверсия.

*Всасывание.* Левоцетиризин быстро и интенсивно всасывается после приема внутрь. 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<sub>max</sub>) 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 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 ходе исследований 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 человека - 90%.

*Метаболизм.* В организме человека уровень метаболизма составляет менее 14% от дозы левоцетиризина, и поэтому разница в результате генетического полиморфизма или сопутствующего приема ферментных ингибиторов, как ожидается, будет незначительной.

Процесс метаболизма включает ароматическую оксидации, N- и O-деалкилирования и сообщения с таурином. Деалкилирования, в первую очередь, происходит при участии цитохрома CYP 3A4, в то время как в процессе ароматического окисления задействован целый ряд цитохромных изоформ 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 (и наоборот) маловероятно.

*Выведение.* Экскреция препарата происходит двумя путями - за счет клубочковой фильтрации и активной канальцевой секреции. Период полувыведения ( $T_{1/2}$ ) у взрослых составляет 7,9 + 1,9 часа. Средний очевиден общий клиренс - 0,63 мл / мин / кг. В основном вывода левоцетиризина и его метаболитов из организма с мочой, что составляет в среднем 85,4% 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 у 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 аллергических ринитов, в том числе круглогодичных аллергических ринитов; хроническая идиопатическая крапивница.

### **Противопоказания**

- Повышенная чувствительность к левоцетиризину, цетиризину, гидроксизину и другим производным пиперазина или к любому другому компоненту препарата.
- Тяжелая почечная недостаточность при КК менее 10 мл / мин.
- Тяжелая наследственная непереносимость галактозы, дефицит фермента лактазы ( $\beta$ -галактозидазы) или нарушение усвоения глюкозы и галактозы.
- Беременность и период кормления грудью.
- Возраст до 6 лет.

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

Одновременное применение с феназином, псевдоэфедрином, циметидином, кетоконазолом, эритромицином, азитромицином, глипезидом или диазепамом не проявляет клинически значимых неблагоприятных взаимодействий. При совместном применении с теофиллином (400 мг / сут) наблюдалось небольшое

снижение на 16% общего клиренса левоцетиризина, при этом кинетика теофиллина не меняется. При совместном введении ритонавира и цетиризина степень экспозиции цетиризина увеличивался, тогда как распределение ритонавира несколько менялся (-11%).

Одновременное применение левоцетиризина и алкоголя или других препаратов, угнетающих функцию центральной нервной системы у чувствительных пациентов может вызвать дополнительное снижение бдительности и способности к выполнению работы. Следует воздерживаться от применения седативных средств во время проведения терапии.

### **Особенности применения**

С осторожностью применять пациентам с хронической почечной недостаточностью (требуется коррекция режима дозирования), пациентам пожилого возраста (возможно снижение клубочковой фильтрации).

Во время применения препарата следует воздерживаться от употребления алкоголя (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

При наличии у пациентов определенных факторов, провоцирующих задержку мочи (например, травмы спинного мозга, гиперплазия предстательной железы) необходимо обратить на это внимание при назначении препарата, поскольку левоцетиризин может увеличить риск задержки мочи.

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

Следует воздерживаться от управления автотранспортом или работы с потенциально опасными механизмами во время лечения.

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

Левоцетиризин противопоказан для применения в период беременности. Препарат проникает в грудное молоко, поэтому при необходимости применения препарата в период кормления грудью следует прекратить.

### **Фертильность**

Нет данных о влиянии левоцетиризина на фертильность.

### **Способ применения и дозы**

Препарат назначают взрослым и детям старше 6 лет.

Взрослые и дети старше 6 лет: рекомендуемая суточная доза составляет 5 мг (1 таблетка, покрытая оболочкой).

Больным пожилого возраста при нормальной функции почек снижение дозы не требуется.

Коррекция дозы рекомендуется у пациентов пожилого возраста с умеренной и тяжелой почечной недостаточностью (см. «Пациенты с нарушенной функцией почек»).

Взрослые пациенты с нарушением функции почек

Интервалы дозирования должны быть индивидуализированы в зависимости от степени нарушения функции почек.

*Коррекция дозы для больных с нарушенной функцией почек:*

Функция почек	Клиренс креатинина, мл/мин	Доза и количество пр
Нормальная функция почек	$\geq 80$	5 мг 1 раз в сутки
Нарушения функции почек легкой степени	50-79	5 мг 1 раз в сутки
Нарушения функции почек умеренной степени	30-49	5 мг 1 раз в 2 суток
Нарушения функции почек тяжелой степени	$< 30$	5 мг 1 раз в 3 суток
Терминальная стадия почечной недостаточности Пациенты, находящиеся на гемодиализе	$< 10$	Противопоказано

Больным с печеночной недостаточностью коррекция режима дозирования не требуется. Больным с печеночной и почечной недостаточностью следует корректировать режим дозирования в соответствии с таблицей, приведенной выше, после консультации с врачом.

У детей с почечной недостаточностью коррекцию дозы необходимо проводить индивидуально, исходя из показателя клиренса креатинина и массы тела пациента. Специальные данные о режиме приема препарата детьми с почечной недостаточностью отсутствуют.

### *Длительность применения*

Пациентов с периодическим аллергическим ринитом (длительность проявления симптомов заболевания составляет менее 4 дней в неделю или менее 4 недель в году) следует лечить в соответствии с течением заболевания 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 дней в неделю или более 4 недель в году) 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.

### *Способ применения*

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

### **Дети**

Препарат у вигляді таблеток не застосовувати дітям віком до 6 років, оскільки ця лікарська форма не дає змоги проводити необхідну корекцію режиму дозування. Для цієї категорії пацієнтів рекомендується левоцетиризин у лікарській формі, придатній для застосування у педіатрії.

### **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. Можно рассмотреть необходимость промывания желудка через короткое время после применения препарата. Гемодиализ для выведения левоцетиризина из организма не эффективен.

## **Побочные реакции**

*Побочные реакции, выявленные во время применения препарата, указанные ниже.*

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

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

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

*Со стороны органов слуха и равновесия:* вертиго.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* сердцебиение, тахикардия.

*Со стороны органов дыхания:* одышка.

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

*Со стороны пищеварительной системы:* гепатит.

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

*Со стороны опорно-двигательного аппарата:* боль в мышцах, артралгия.

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

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

*Со стороны питания и обмена веществ:* повышенный аппетит.

*Общие нарушения и состояние места введения:* отек.

*Результаты исследований:* увеличение массы тела, отклонения функциональных показателей печеночных проб от нормы.

Прием препарата следует прекратить при появлении любого из вышеупомянутых побочных эффектов и обратиться к врачу.

Сообщение о подозреваемых побочных реакциях

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

### **Срок годности**

2 года.

### **Условия хранения**

Это лекарственное средство не требует специальных температурных условий хранения. Хранить в недоступном для детей месте.

### **Упаковка**

По 7 таблеток в блистере, по 4 блистера в пачке.

### **Категория отпуска**

Без рецепта.

### **Производитель**

ТОВ «Гедеон Ріхтер Польща».

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

ул. Предельная, 35, Гродзиск Мазовецкий, 05-825, Польша.

ул. кн. Ю. Понятовского, 5, Гродзиск Мазовецкий, 05-825, Польша.

### **Источник инструкции**

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