

## **Состав**

*действующее вещество:* левоцетиризина дигидрохлорид;

1 таблетка содержит левоцетиризина дигидрохлорида 5 мг;

*вспомогательные вещества:* целлюлоза микрокристаллическая, натрия кроскармеллоза, лактоза, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, покрытие Instacoat Universal White A05G10679: гипромеллоза, полиэтиленгликоль, титана диоксид (E 171).

## **Лекарственная форма**

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

*Основные физико-химические свойства:* таблетки овальной формы, покрытые пленочной оболочкой, от белого до почти белого цвета с маркировкой М и 17 разделенным линией разлома на одной стороне и с линией разлома на другой стороне.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Антигистаминные средства для системного применения. Производные пиперазина. Левоцетиризин. 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 подавляет 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 цетиризина.

## *Абсорбция.*

Левосетиризин быстро и интенсивно всасывается после приема внутрь. У взрослых пиковые концентрации в плазме крови достигается примерно через 50 минут после приема таблетки перорально. Равновесная концентрация в крови достигается после 2 дней приема препарата.

Максимальная концентрация, как правило, составляют 270 нг / мл и 308 нг / мл после однократного и повторного применения 5 мг один раз в сутки соответственно.

Пища не влияет на степень всасывания (AUC) левосетиризина таблеток, но  $T_{max}$  составляет 1,25 ч и  $C_{max}$  была снижена на 36% после введения пищи с высоким содержанием жира; поэтому левосетиризин можно применять с пищей или без.

*Распределение.* Среднее связывания левосетиризина с белками плазмы *in vitro* в диапазоне от 91 до 92%. После приема средний объем распределения составляет примерно 0,4 л / кг.

*Метаболизм.* Степень метаболизма левосетиризина у людей меньше 14%. 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.

*Выведение.* Период полувыведения препарата из плазмы у взрослых здоровых добровольцев составляет от 8 до 9:00 после приема внутрь, и общий клиренс у взрослых составляет примерно 0,63 мл / мин / кг. В основном вывода левосетиризина и его метаболитов из организма с мочой (выводится в среднем 85,4% дозы препарата). С калом выводится 12,9% принятой дозы. Левосетиризин выделяется как путем клубочковой фильтрации, так и благодаря активной канальцевой секреции. Почечный клиренс левосетиризина коррелирует с клиренсом креатинина. У больных с почечной недостаточностью клиренс левосетиризина снижается.

## **Показания**

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

## **Противопоказания**

- Повышенная чувствительность к левоцетиризину или к любому другому компоненту препарата или к любым производным пиперазина.
- Тяжелая форма хронической почечной недостаточности (клиренс креатинина <10 мл / мин). Необходимость гемодиализа.
- Редкие наследственные состояния непереносимости галактозы, лактазной недостаточности или нарушения усвоения глюкозы и галактозы.

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

Данные *in vitro* показывают, что применение левоцетиризина вряд ли приведет к фармакокинетическим взаимодействиям через ингибирование или индукцию ферментов печени, метаболизируются лекарственные средства.

Фармакокинетические исследования взаимодействия, выполненные из рацемическим цетиризином, показали, что цетиризин не оказывает клинически значимых неблагоприятных взаимодействий с антипирином, псевдоэфедрина, эритромицин, азитромицин, кетоконазолом и циметидином.

Отмечалось снижение (~ 16%) клиренса цетиризина, вызванного совместным применением с 400 мг теофиллина. Вполне возможно, что более высокие дозы теофиллина могут иметь больший эффект.

Ритонавир увеличивал степень экспозиции цетиризина примерно на 42%, что сопровождается увеличением периода полувыведения (53%) и уменьшением клиренса (29%) цетиризина. Распределение ритонавира не претерпел изменений в случае совместного применения с цетиризином.

Степень поглощения левоцетиризина не уменьшается с пищей, хотя снижается скорость абсорбции.

## **Особенности применения**

Не превышать указанную дозу. С осторожностью применять пациентам с хронической почечной недостаточностью (требуется коррекция режима дозирования) и пациентам пожилого возраста с почечной недостаточностью (возможно снижение клубочковой фильтрации). Наличие у пациентов определенных факторов, провоцирующих задержку мочи (таких как травмы спинного мозга, гиперплазия предстательной железы), необходимо принимать во внимание при назначении препарата, поскольку левоцетиризин может увеличить риск задержки мочи.

Одновременного применения левоцетиризина с алкоголем или другими депрессантами центральной нервной системы следует избегать, так как возможны дополнительные нарушения центральной нервной системы и снижение внимания. Во время применения препарата следует воздерживаться от употребления алкоголя. С осторожностью следует назначать левоцетиризин больным эпилепсией и пациентам с риском судом.

### **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.

### **Способ применения и дозы**

Принимать независимо от приема пищи, запивая небольшим количеством воды.

#### Взрослые и дети старше 12 лет

5 мг 1 раз в сутки (1 таблетка 1 раз в сутки) вечером. Некоторые пациенты может быть достаточно 2,5 мг один раз в сутки в вечернее время.

#### Дети в возрасте от 6 до 11 лет

Рекомендуемая доза левоцетиризина составляет 2,5 мг один раз в сутки в вечернее время. Дозу 2,5 мг не следует превышать, поскольку системное воздействие 5 мг примерно в два раза больше, чем у взрослых.

#### Пациенты пожилого возраста

При нормальной функции почек нет необходимости снижать дозу пациентам пожилого возраста.

#### Пациенты с нарушениями функции почек

Для больных с хронической почечной недостаточностью расчет дозы необходимо проводить с учетом клиренса креатинина в соответствии с таблицей.

Степень нарушения функции почек	Клиренс креатинина (мл/мин)	Доза и частота
Нарушение легкой степени	50 - 80	2,5 мг 1 раз в сут
Нарушение умеренной степени	30 - 50	2,5 мг 1 раз в 2 су
Тяжелая степень	<30	2,5 мг 1 раз в 3 - 4
Терминальная стадия - пациенты, которые подлежат диализа	<10	5 мг 1 раз в 3 сут противопоказано

### *Пациенты с нарушениями функции печени*

Пациентам, имеющим только нарушение функции печени, нет необходимости корректировать дозу.

### *Пациенты с нарушениями функции печени и почек*

Пациентам, имеющим нарушения функции и печени, и почек, рекомендуется корректировать дозу согласно приведенной выше таблицы.

Продолжительность лечения пациентов с периодическим аллергическим ринитом (продолжительность симптомов заболевания составляет <4 дней в неделю или в течение менее 4 недель) зависит от заболевания и анамнеза; лечение можно прекратить, если симптомы исчезнут, и можно восстановить 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 можно предложить постоянную терапию. При хронических заболеваниях (хронический аллергический ринит, хроническая крапивница) продолжительность лечения составляет до 1 года (данные доступны по клиническим исследованиям при применении рацемата).

### **Дети**

Препарат применяют детям от 6 лет.

### **Передозировка**

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

*Лечение:* специфического антидота для левоцетиризина пока нет. При проявлении симптомов передозировки рекомендуется симптоматическая и поддерживающая терапия. Следует рассмотреть необходимость промывание желудка через короткое время после применения препарата. Гемодиализ неэффективен.

## **Побочные реакции**

*Побочные реакции представлены по классам систем органов и частоте возникновения:* очень часто ( $\geq 1/10$ ), часто ( $\geq 1/100 - <1/10$ ), нечасто ( $\geq 1/1000 - <1/100$ ), редко ( $\geq 1 / 10000 - <1/1000$ ), очень редко ( $<1/10\ 000$ ).

*Со стороны крови и лимфатической системы:* очень редко - тромбоцитопения.

*Со стороны иммунной системы:* редко - гиперчувствительность; очень редко - анафилактический шок.

*Психические нарушения:* часто - сонливость, редко - возбуждение, редко - агрессия, головокружение, депрессия, бессонница, очень редко - тик, галлюцинации, суицидальные мысли.

*Со стороны нервной системы:* часто - головная боль, головокружение нечасто - парестезии редко - судороги, расстройства движения; очень редко - сонливость, утомляемость; очень редко - дисгевзия, обморок, тремор, вертиго.

*Со стороны органов зрения:* очень редко - нарушение зрения, нечеткость зрения.

*Со стороны сердца:* редко - тахикардия, усиленное сердцебиение.

*Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:* часто - фарингит и насморк у детей, редко - одышка.

*Со стороны пищеварительной системы:* часто - тошнота, боль в животе, сухость во рту, очень редко - диарея, рвота, запор, повышенный аппетит.

*Со стороны пищеварительной системы:* редко - аномальные функции печени (увеличение трансаминаз, щелочной фосфатазы,  $\gamma$ -ГТ и билирубина), гепатит.

*Со стороны кожи и подкожной клетчатки:* нечасто - зуд, сыпь, редко - крапивница очень редко - ангионевротический отек, устойчивый

медикаментозный сыпь.

*Со стороны почек и мочевыделительной системы:* очень редко - дизурия, задержка мочи, энурез.

*Общие нарушения:* часто - усталость, часто - астения, недомогание, миалгия, редко - отеки.

*Результаты исследований:* увеличение массы тела.

### **Срок годности**

2 года.

### **Условия хранения**

Хранить при температуре не выше 30 ° С в оригинальной упаковке.

Хранить в недоступном для детей месте.

### **Упаковка**

По 30 таблеток во флаконе, по 1 флакону в картонной упаковке.

### **Категория отпуска**

Без рецепта.

### **Производитель**

Маклеодс ФАРМАСЬЮТИКАЛС ЛИМИТЕД.

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

Виледж Тхеда, ПО Лодхимайра, Техсил Бадди, Дистрикт Солан, Химачал-Прадеш, 174101, Индия.

### **Источник инструкции**

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