

Состав

действующее вещество: левоцетиризина дигидрохлорид;

1 мл 5 мг левоцетиризина дигидрохлорида (что соответствует 4,21 мг левоцетиризина)

вспомогательные вещества: глицерин 85%, пропиленгликоль, натрия сахарин, натрия ацетат тригидрат, метилпарагидроксибензоат (Е 218), пропилпарагидроксибензоат (Е 216), кислота уксусная ледяная, вода очищенная.

Лекарственная форма

Капли оральные, раствор.

Основные физико-химические свойства: бесцветная или почти бесцветная сладкая жидкость без осадка, со слабым запахом уксусной кислоты.

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 H₁-рецепторов.

Сродство к H₁-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. В терапевтических дозах почти не оказывает седативного эффекта.

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_{max}) 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_{max} в сыворотке крови достигается через 50 мин после однократного приема внутрь терапевтической дозы и сохраняется в течение 2 дней. С_{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 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. Деалкирования происходит прежде всего при участии 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_{1/2}) составляет 7,9 + 1,9 часа. T_{1/2} 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 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 аллергического ринита (в том числе круглогодичного аллергического ринита) и крапивницы.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к левоцетиризину или к любой другой составляющей данной лекарственной формы, или к любым производным пиперазина.

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

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Исследования по левоцетиризину 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. 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), пациентам пожилого возраста (возможно снижение клубочковой фильтрации). Следует с осторожностью применять препарат при одновременном приеме с алкоголем (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

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

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

Метилпарабен и пропилпарагидроксибензоат, входящих в состав пероральных капель, могут вызывать аллергические реакции (возможно отсроченные).

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

Зуд может появиться 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 применение лечения после его прекращения. Только в случае исчезновения симптомов можно повторно начать лечение.

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

Следует воздерживаться от управления автотранспортом или работы с механизмами во время применения препарата.

Применение в период беременности или кормления грудью

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

Фертильность

Нет клинических данных (включая исследования на животных) по влиянию левосетиризина на фертильность.

Способ применения и дозы

Препарат назначать взрослым и детям старше 2 лет.

Рекомендуемые дозы:

Взрослые и подростки старше 12 лет: рекомендуемая суточная доза составляет 5 мг (20 капель) 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 пожилого возраста с нормальной функцией почек коррекция дозы препарата не требуется.

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:

$$\text{КЛкр} = [140 - \text{возраст (годы)}] \times \text{масса тела (кг)} / 72 \times \text{креатинин сыворотки крови (мг / дл)} \quad (\times 0,85 \text{ для женщин})$$

Коррекция дозы для больных с нарушениями функции почек

Функция почек	КК, 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 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 следует скорректировать индивидуально с учетом почечного клиренса пациента и его массы тела.

Специфических данных по применению детям с нарушениями функции почек нет.

Печеночная недостаточность

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

Рекомендуемые дозы:

- дети в возрасте от 2 до 6 лет: рекомендуемая суточная доза составляет 2,5 мг (10 капель). Указанную дозу применять по 1,25 мг (5 капель) 2 раза в сутки;
- дети в возрасте от 6 до 12 лет: рекомендуемая суточная доза составляет 5 мг (20 капель) 1 раз в сутки.

Способ применения

Капли следует накапать в ложку или растворить в небольшом количестве воды и принимать внутрь. При разведении капель следует учитывать (особенно при применении детям), что объем воды, к которому прилагаются капли, должен соответствовать количеству жидкости, которое может проглотить пациент. Разбавленный раствор следует принимать немедленно.

При подсчете капель флакон следует держать вертикально (вверх доньшком). В случае отсутствия потока капель (если соответствующее количество капель не было получено) следует перевернуть флакон в вертикальное положение, а затем снова вверх доньшком и продолжить подсчет капель.

Препарат можно принимать независимо от приема пищи.

Длительность применения

Длительность применения: пациентов с периодическим аллергическим ринитом (продолжительность симптомов заболевания составляет менее 4 суток в неделю или в течение менее 4 недель в год) 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 можно предложить постоянную терапию. 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

Применение левоцетиризина детям до 2 лет не рекомендуется из-за ограниченности данных в этой возрастной категории.

Препарат применять детям в возрасте от 2 лет.

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 неэффективен.

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: 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: миалгия, артралгия.

Результаты исследований: увеличена масса тела, отклонения функции печени от нормальных значений.

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.

Метилпарабен и пропилпарагидроксибензоат, входящих в состав пероральных капель, могут привести к развитию аллергических реакций (возможно, отсроченных).

Описание отдельных побочных реакций

Сообщалось о зуд после отмены левоцетиризина.

Отчетность по побочным реакций

Отчетность в отношении подозреваемых побочных реакций после утверждения лекарственного средства важна. Это позволяет продолжить мониторинг соотношением польза / риск лекарственного средства. Медицинских работников просят сообщать о любых подозреваемые побочные реакции через национальную систему отчетности.

Срок годности

4 года.

После вскрытия флакона хранить не более 6 недель.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 ° C в недоступном для детей месте.

Не замораживать!

Упаковка

По 20 мл во флаконах из коричневого стекла с полиэтиленовой капельницей; по 1 флакону в картонной коробке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

ЗАО Фармацевтический завод ЭГИС, Венгрия.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

9900, г. Керменд, ул. Матяш Кирай 65, Венгрия.

Источник инструкции

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