

## **Состав**

*действующее вещество:* левоцетиризин;

1 таблетка, покрытая оболочкой, содержит левоцетиризина дигидрохлорида 5 мг

*вспомогательные вещества:* лактоза моногидрат, целлюлоза  
микрочисталлическая кремния диоксид коллоидный магния стеарат

*пленочное покрытие:* Opadry® White Y-1-7000 (гипромеллоза, титана диоксид (E 171) макрогол).

## **Лекарственная форма**

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

*Основные физико-химические свойства:* овальные двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета.

## **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 H<sub>1</sub>-рецепторов. Родство с H<sub>1</sub>-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.

## **Фармакокинетика**

Фармакокинетические параметры левецетиризина имеют линейную зависимость и не зависящие 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 хиральной инверсии.

### *Абсорбция*

После перорального применения левоцетиризин быстро и интенсивно всасывается. Степень всасывания не зависит от дозы и не меняется с едой, но максимальная концентрация (max) левоцетиризина уменьшается и достигается позже. Биодоступность составляет 100%. Действие левоцетиризина развивается через 12 минут после приема однократной дозы у 50% больных, а через 0,5-1 час - в 95%. У взрослых  $C_{max}$  в плазме крови достигается через 50 минут после однократного приема терапевтической дозы. Равновесная концентрация в крови достигается после 2 дней приема.  $C_{max}$  составляет 270 нг/мл после однократного применения и 308 нг/мл после повторного применения дозы 5 мг 1 раз в сутки.

### *Распределение*

Отсутствует информация о распределении левоцетиризина 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.

Распределение левоцетиризина ограничен, так как объем распределения составляет 0,4 л/кг. Связывание с белками плазмы крови человека - 90%.

### *Метаболизм*

В организме человека уровень метаболизма составляет менее 14% от дозы левоцетиризина, поэтому различие 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. Деалкирования происходит прежде всего с участием цитохрома CYP 3A4, тогда как в процессе ароматического 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 приема дозы 5 мг перорально. Учитывая низкую степень метаболизма и отсутствие способности к подавлению метаболизма взаимодействие левоцетиризина с другими веществами (и наоборот) маловероятно.

### *Вывод*

Экскреция левоцетиризина происходит двумя путями: за счет клубочковой фильтрации и активной канальцевой секреции. Период полувыведения из плазмы ( $T_{1/2}$ ) у взрослых составляет 7,9 + 1,9 часа.  $T_{1/2}$  короче у детей

младшего возраста. Средний очевиден 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% дозы). С фекалиями выводится только 12,9% дозы.

### *Особые популяции*

#### *Пациенты с нарушениями функции почек*

Очевидный клиренс левоцетиризина коррелирует с клиренсом креатинина. Поэтому пациентам с умеренными и тяжелыми нарушениями функции почек рекомендуется подбирать интервалы между приемами левоцетиризина с учетом клиренса креатинина. При анурии у пациентов с терминальной стадией заболевания почек общий клиренс уменьшается примерно на 80% по сравнению с общим клиренсом у лиц без таких нарушений. 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 другим компонентам 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**

Исследование взаимодействия левоцетиризина (в т.ч. с индукторами CYP3A4) не проводилось. Исследование взаимодействия цетиризина (соединение рацемата) показали, что одновременное применение с антипирином, азитромицином, циметидином, диазепамом, эритромицин, глипизидом, кетоконазолом или псевдоэфедрина не оказывает клинически значимых неблагоприятных эффектов.

При одновременном применении с теофиллином (400 мг в сутки) в исследовании многократного применения наблюдалось небольшое снижение (на 16%)

клиренса цетиризина (распределение теофиллина не менялся).

При исследовании многократного применения ритонавира (600 мг 2 раза в сутки) и цетиризина (10 мг в сутки) экспозиция цетиризина увеличивалась примерно на 40%, тогда как распределение ритонавира несколько менялся (-11%).

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

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

Одновременное применение цетиризина или левоцетиризина с алкоголем или другими депрессантами центральной нервной системы у чувствительных пациентов может вызвать дополнительное снижение внимания и способности к выполнению работы.

### **Особенности применения**

Лекарственное средство следует с осторожностью применять пациентам с хронической почечной недостаточностью (требуется коррекция режима дозирования) и пациентам пожилого возраста с почечной недостаточностью (возможно снижение клубочковой фильтрации).

При применении лекарственного средства следует воздерживаться от употребления алкоголя (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

При применении лекарственного средства пациентам с факторами, провоцирующими задержку мочи (например, травмы спинного мозга, гиперплазия предстательной железы), следует принимать во внимание, что левоцетиризин увеличивает риск задержки мочи.

Лекарственное средство 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, поэтому применение лекарственного средства следует прекратить за 3 дня до ее проведения (период вывода).

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

Левоцетиризин в виде таблеток не применять детям до 6 лет, поскольку эта лекарственная форма не позволяет проводить необходимую коррекцию режима дозирования. Данной категории пациентов рекомендуется назначать левоцетиризин в лекарственной форме, пригодной для применения в педиатрии.

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

Сравнительные клинические исследования не выявили никаких доказательств того, что левоцетиризин в рекомендуемой дозе ухудшает психическое бдительность, реакционную способность или способность управлять автотранспортом.

Однако, некоторые пациенты могут испытывать сонливость, усталость и астению во время лечения левоцетиризин. Поэтому пациенты, которые намерены управлять автотранспортом или другими механизмами, должны учитывать свою реакцию на лекарственное средство.

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

Лекарственный препарат противопоказан для применения в период беременности.

Цетиризин проникает в грудное молоко, поэтому при необходимости применения лекарственного средства кормления грудью следует прекратить.

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

### **Способ применения и дозы**

Лекарственное средство предназначено для перорального применения. Таблетку необходимо глотать целиком, запивая небольшим количеством воды, независимо от приема пищи. Рекомендуется применять суточную дозу в 1 прием.

*Взрослые и дети старше 12 лет*

Рекомендуемая суточная доза составляет 5 мг (1 таблетка) 1 раз в сутки.

### *Пациенты пожилого возраста*

Больным пожилого возраста с нормальной функцией почек коррекция дозы не требуется.

Корректировка дозы рекомендуется пациентам пожилого возраста с нарушениями функции почек умеренной и тяжелой степени (см. «Пациенты с почечной недостаточностью»).

### *Пациенты с почечной недостаточностью*

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

Коррекция дозы левоцетиризина для больных с нарушениями функции почек

<b>Функция почек</b>	<b>Клиренс креатинина, мл/мин</b>	<b>Доза и количество приемов</b>
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 раз в 2 сутки
Нарушение тяжелой степени	$< 30$	5 мг 1 раз в 3 сутки
Терминальная стадия заболевания почек Пациенты, находящиеся на диализе	$< 10$	Противопоказано

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

Специфических данных по применению левоцетиризина детям с нарушениями функции почек нет.

### *Пациенты с печеночной недостаточностью*

Больным с печеночной недостаточностью коррекция режима дозирования не требуется. Больным с печеночной и почечной недостаточностью следует

корректировать режим дозирования в соответствии с приведенной выше таблицы.

### *Педиатрическая популяция*

#### *Дети в возрасте от 6 до 12 лет*

Рекомендуемая суточная доза составляет 5 мг (1 таблетка) 1 раз в сутки.

#### *Дети в возрасте от 2 до 6 лет*

Левосетиризин в виде таблеток не применять детям до 6 лет, поскольку эта лекарственная форма не позволяет проводить необходимую коррекцию режима дозирования. Данной категории пациентов рекомендуется назначать левосетиризин в лекарственной форме, пригодной для применения в педиатрии.

### *Длительность применения*

Пациентов с периодическим аллергическим ринитом (длительность проявления симптомов заболевания составляет менее 4 суток в неделю или менее 4 недели в год) следует лечить в соответствии с течения заболевания и анамнеза: лечение можно прекратить, если симптомы исчезнут, и можно восстановить снова при повторном возникновении симптомов .

В случае устойчивого аллергического ринита (длительность проявления симптомов заболевания составляет более 4 суток в неделю или более 4 недель в год) в период контакта с аллергенами пациенту может быть предложена постоянная терапия. Существует клинический опыт применения левосетиризина 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 рацемата).

## **Дети**

Лекарственное средство в виде таблеток не применять детям до 6 лет, поскольку эта лекарственная форма не позволяет проводить необходимую коррекцию режима дозирования. Данной категории пациентов рекомендуется назначать левосетиризин в лекарственной форме, пригодной для применения в педиатрии.

## **Передозировка**

### *Симптомы*

Симптомы передозировки у взрослых могут включать сонливость. У детей сначала могут возникнуть возбуждение и повышенная раздражительность с последующей сонливостью.

### *Лечение*

Специфического антидота к левоцетиризину нет. В случае появления симптомов передозировки рекомендуется симптоматическая и поддерживающая терапия. Можно рассмотреть необходимость промывание желудка через короткое время после применения лекарственного средства. Гемодиализ для выведения левоцетиризина из организма не эффективен.

### **Побочные реакции**

Сообщалось о таких побочных реакциях, которые возникали во время клинических исследований левоцетиризина, не менее чем у 1% пациентов (часто ( $\geq 1/100$ ,  $<1/10$ )) в возрасте от 12 до 71 года:

*со стороны нервной системы:* головная боль, сонливость

*со стороны пищеварительного тракта:* сухость во рту

*со стороны организма в целом:* повышенная утомляемость.

Нечасто ( $\geq 1/1000$ ,  $<1/100$ ) также сообщалось о астении и боль в животе.

Сообщалось о таких побочных реакциях, которые возникали во время клинических исследований левоцетиризина, не менее чем у 1% детей в возрасте 6 - 11 месяцев и в возрасте от 1 до 6 лет:

*со стороны пищеварительного тракта:* диарея, рвота, запор

*со стороны нервной системы:* сонливость

*со стороны психики:* нарушение сна.

Сообщалось о таких побочных реакциях, которые возникали во время клинических исследований левоцетиризина, не менее чем у 1% детей в возрасте от 6 до 12 лет

*со стороны нервной системы:* головная боль, сонливость.

В пострегистрационный период также сообщалось о развитии нижеперечисленных побочных реакций. Побочные реакции указаны по классам систем органов, согласно MedDRA, и по частоте: 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



(<1/10000); частота неизвестна (нельзя определить по имеющимся данным).

*Со стороны иммунной системы:*

частота неизвестна - повышенная чувствительность, в том числе анафилаксия.

*Со стороны метаболизма и питания:*

частота неизвестна - повышенный аппетит.

*Со стороны психики:*

частота неизвестна - агрессия, возбуждение, галлюцинации, депрессия, бессонница, суицидальные мысли, кошмарные сновидения.

*Со стороны нервной системы:*

частота неизвестна - судороги, парестезии, головокружение, обморок, тремор, дисгевзия.

*Со стороны органов слуха и равновесия:*

частота неизвестна - вертиго.

*Со стороны органов зрения:*

частота неизвестна - нарушение зрения, нечеткость зрения, окулография.

*Со стороны сердца:*

частота неизвестна - усиленное сердцебиение, тахикардия.

*Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:*

частота неизвестна - одышка.

*Со стороны пищеварительного тракта:*

частота неизвестна - диарея, рвота, запор, сухость во рту, тошнота, боль в животе.

*Со стороны пищеварительной системы:*

частота неизвестна - гепатит.

*Со стороны почек и мочевыделительной системы:*

частота неизвестна - дизурия, задержка мочи.

*Со стороны кожи и подкожных тканей:*

частота неизвестна - ангионевротический отек, устойчивые медикаментозные высыпания, зуд, сыпь, крапивница.

*Со стороны костно-мышечной системы, соединительной ткани и костей:*

частота неизвестна - миалгия, артралгия.

*Со стороны организма в целом и реакции в месте введения:*

частота неизвестна - отек.

Результаты лабораторных исследований: частота неизвестна - увеличение массы тела, отклонения функции печени от нормы.

*Описание отдельных побочных реакций*

Сообщалось о зуд после отмены левоцетиризина.

*Сообщение о подозреваемых побочных реакции*

Сообщение о подозреваемых побочных реакции, возникшие после регистрации лекарственного средства, очень важны. Это позволяет постоянно наблюдать за балансом польза / риск лекарственного средства. Работников системы здравоохранения просят сообщать о любых подозреваемые побочные реакции через национальную систему сообщений.

### **Срок годности**

3 года.

### **Условия хранения**

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

### **Упаковка**

10 таблеток в блистере, 2 блистера в картонной коробке.

### **Категория отпуска**

Без рецепта.

### **Производитель**

УОРЛД МЕДИЦИН ИЛАЧ САН. ВЕ ТиДжей. А.Ш./WORLD MEDICINE ILAC SAN. VE TIC. A.S.

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

15 Теммуз Махаллеши Джамии Йолу Джаддеси №50 Гюнешли Бешикташ/Стамбул, Турция/15 Temmuz Mahallesi Cami Yolu Caddesi No: 50 Gunesli Bagcilar/Istanbul, Turkey.

**Источник инструкции**

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