

Склад

діюча речовина: левоцетиризин;

1 таблетка, вкрита плівковою оболонкою, містить 5 мг левоцетиризину дигідрохлориду;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна (тип 102), лактози моногідрат, кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат;

оболонка: опадрі білий (гіпромелоза (E 464), титану діоксид (E 171), макрогол 400).

Лікарська форма

Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: білого або майже білого кольору довгасті двоопуклі таблетки, вкриті плівковою оболонкою, з гравіруванням «R23» з одного боку. Довжина близько 8 мм, ширина близько 4,5 мм.

Фармакотерапевтична група

Антигістамінні засоби для системного застосування. Похідні піперазину. Код АТХ R06A E09.

Фармакодинаміка

Левоцетиризин – це активний стабільний R-енантіомер цетиризину, що належить до групи конкурентних і селективних антагоністів H_1 -гістамінових рецепторів. Фармакологічна дія зумовлена блокуванням H_1 -гістамінових рецепторів. Спорідненість до H_1 -гістамінових рецепторів у левоцетиризину у 2 рази вища, ніж у цетиризину. Впливає на гістамінзалежну стадію розвитку алергійної реакції, зменшує міграцію еозинофілів, судинну проникність, обмежує вивільнення медіаторів запалення. Попереджає розвиток та полегшує перебіг алергічних реакцій, чинить антиексудативну, протисвербіжну, протизапальну дію, практично не чинить антихолінергічної та антисеротонінової дії.

Дані ЕКГ не показали відповідного впливу левоцетиризину на інтервал QT.

Фармакокінетика

Фармакокінетичні параметри левоцетиризину мають лінійну залежність, не залежать від дози та часу і мають низьку варіабельність у різних пацієнтів. Фармакокінетичний профіль при введенні єдиного енантіомера такий самий, як і при застосуванні цетиризину. У процесі абсорбції або виведення не спостерігається хоральна інверсія.

Всмоктування. Левоцетиризин швидко та інтенсивно всмоктується після застосування внутрішньо. Ступінь всмоктування препарату не залежить від дози препарату та не змінюється з прийомом їжі, але максимальна концентрація (C_{max}) препарату зменшується та досягає свого максимального значення пізніше. Біодоступність досягає 100 %.

У 50 % хворих дія препарату розвивається через 12 хвилин після прийому одноразової дози, а у 95 % — через 0,5-1 годину. Максимальна концентрація (C_{max}) у сироватці крові досягається через 50 хвилин після однократного прийому внутрішньо терапевтичної дози. Рівноважна концентрація у крові досягається після 2 днів прийому препарату. Максимальна концентрація становить 270 нг/мл після одноразового застосування і 308 нг/мл — після повторного застосування у дозі 5 мг відповідно.

Розподіл. Відсутня інформація щодо розподілу препарату у тканинах людини, а також щодо проникнення левоцетиризину крізь гематоенцефалічний бар'єр. У ході досліджень на тваринах найбільша концентрація зафіксована у печінці та нирках, а найнижча - у тканинах центральної нервової системи. Об'єм розподілу - 0,4 л/кг. Зв'язування з білками плазми крові людини - 90 %.

Біотрансформація. В організмі людини рівень метаболізму становить менше 14 % від дози левоцетиризину, і тому відмінність у результаті генетичного поліморфізму або супутнього прийому ферментних інгібіторів, як очікується, буде незначною.

Процес метаболізму включає ароматичну оксидацию, N- та O-деалкілування і сполучення з таурином. Деалкілування, у першу чергу, відбувається з участю цитохрому CYP 3A4, у той час як у процесі ароматичної оксидации задіяний цілий ряд цитохромних ізоформ CYP. Левоцетиризин не впливає на активність цитохромних ізоферментів 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4 у концентраціях, що значно перевищують максимальні після прийняття дози 5 мг перорально. Враховуючи низький ступінь метаболізму та відсутність здатності до пригнічення метаболізму, взаємодія левоцетиризину з іншими речовинами (і навпаки) малоймовірна.

Виведення. Екскреція препарату відбувається двома шляхами - за рахунок клубочкової фільтрації та активної каналцевої секреції. Період напіввиведення

($T_{1/2}$) у дорослих становить $7,9 \pm 1,9$ години. Середній очевидний загальний кліренс – 0,63 мл/хв/кг. В основному виведення левоцетиризину та його метаболітів з організму відбувається із сечею, що становить у середньому 85,4 % застосованої дози препарату. З фекаліями виводиться лише 12,9 % застосованої дози препарату.

Особливі популяції

Порушення функції нирок

Очевидний кліренс левоцетиризину для організму корелює з кліренсом креатиніну. Тому у пацієнтів із помірними та тяжкими порушеннями функції нирок рекомендується підбирати інтервали між прийомами левоцетиризину з урахуванням кліренсу креатиніну. При анурії при кінцевій термінальній стадії захворювання нирок загальний кліренс організму пацієнтів, порівняно з загальним кліренсом організму в осіб без таких порушень, зменшується приблизно на 80 %. Кількість левоцетиризину, що виводиться під час стандартної 4-годинної процедури гемодіалізу, становила < 10 %.

Показання

Симптоматичне лікування алергійних ринітів, у тому числі цілорічних алергійних ринітів; хронічна ідіопатична кропив'янка.

Протипоказання

- Підвищена чутливість до левоцетиризину, цетиризину, гідроксизину та інших похідних піперазину або до будь-якого іншого компонента препарату.
- Тяжка ниркова недостатність при кліренсі креатиніну менше 10 мл/хв.
- Тяжка спадкова непереносимість галактози, дефіцит ферменту лактази (β -галактозидази) або порушення засвоєння глюкози і галактози.
- Вагітність та період годування груддю.
- Дитячий вік до 6 років.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій

Одночасне застосування з феназином, псевдоефедриним, циметидином, кетоконазолом, еритроміцином, азитроміцином, гліпезидом або діазепамом не проявляє клінічно значущих несприятливих взаємодій. При сумісному застосуванні з теофіліном (400 мг/добу) спостерігалось невелике зниження на 16 % загального кліренсу левоцетиризину, при цьому кінетика теофіліну не змінюється. При сумісному введенні ритонавіру та цетиризину ступінь експозиції цетиризину збільшувався, тоді як розподіл ритонавіру дещо змінювався (-11 %).

Одночасне застосування левоцетиризину та алкоголю або інших препаратів, що пригнічують функцію центральної нервової системи у чутливих пацієнтів може спричинити додаткове зниження пильності та здатності до виконання роботи. Слід утримуватися від застосування седативних засобів під час проведення терапії.

Особливості застосування

З обережністю застосовувати пацієнтам з хронічною нирковою недостатністю (потрібна корекція режиму дозування), пацієнтам літнього віку (можливе зниження клубочкової фільтрації).

Під час застосування препарату слід утримуватися від вживання алкоголю (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

При наявності у пацієнтів певних факторів, що провокують затримку сечі (наприклад, травми спинного мозку, гіперплазія передміхурової залози) необхідно звернути на це увагу при призначенні препарату, оскільки левоцетиризин може збільшити ризик затримки сечі.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами

Слід утримуватися від керування автотранспортом або роботи з іншими потенційно небезпечними механізмами під час лікування препаратом.

Застосування у період вагітності або годування груддю

Левоцетиризин протипоказаний для застосовування у період вагітності. Препарат проникає у грудне молоко, тому у разі необхідності застосування препарату у період лактації годування груддю потрібно припинити.

Фертильність

Немає даних щодо впливу левоцетиризину на фертильність.

Спосіб застосування та дози

Препарат призначають дорослим та дітям віком від 6 років.

Дорослі та діти віком від 6 років: рекомендована добова доза становить 5 мг (1 таблетка, вкрита плівковою оболонкою).

Хворим літнього віку при нормальній функції нирок зниження дози не потрібне.

Корекція дози рекомендується у пацієнтів літнього віку з помірною і тяжкою нирковою недостатністю (див. розділ «Пацієнти з порушеною функцією нирок»).

Дорослі пацієнти з порушенням функції нирок:

Інтервали дозування мають бути індивідуалізовані залежно від ступеня порушення функції нирок.

Корекція дози препарату для хворих із порушеною функцією нирок

Функція нирок	Кліренс креатиніну, мл/хв	Доза й кількість прий
Нормальна функція нирок	≥ 80	5 мг 1 раз на добу
Порушення функції нирок легкого ступеня	50-79	5 мг 1 раз на добу
Порушення функції нирок помірного ступеня	30-49	5 мг 1 раз на 2 доби
Порушення функції нирок тяжкого ступеня	< 30	5 мг 1 раз на 3 доби
Термінальна стадія ниркової недостатності Пацієнти, які перебувають на гемодіалізі	< 10	Протипоказано

Хворим з печінковою недостатністю корекція режиму дозування не потрібна. Хворим з печінковою та нирковою недостатністю слід коригувати режим дозування відповідно до таблиці, наведеної вище, після консультації з лікарем.

У дітей з нирковою недостатністю корекцію дози необхідно проводити індивідуально, виходячи з показника кліренсу креатиніну і маси тіла пацієнта. Спеціальні данні щодо режиму прийому препарату дітьми з нирковою недостатністю відсутні.

Тривалість застосування

Пацієнтів із періодичним алергічним ринітом (тривалість прояву симптомів захворювання становить менше 4 днів на тиждень або менше 4 тижнів на рік) слід

лікувати відповідно до перебігу захворювання та анамнезу; лікування можна припинити, якщо симптоми зникнуть, та можна відновити знову при повторному виникненні симптомів. У разі стійкого алергічного риніту (тривалість симптомів захворювання становить більше ніж 4 дні на тиждень або більше 4 тижнів на рік) у період контакту з алергенами пацієнту може бути запропонована постійна терапія. При хронічних захворюваннях (хронічний алергічний риніт, хронічна кропив'янка) тривалість лікування становить до 1 року.

Спосіб застосування

Приймати таблетку необхідно внутрішньо, незалежно від вживання їжі. Таблетку необхідно ковтати цілою, запиваючи невеликою кількістю води. Рекомендовано застосовувати добову дозу в один прийом.

Діти

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.

Передозування

Симптоми: симптоми передозування можуть включати сонливість у дорослих та початкове збудження і підвищену дратівливість з наступною сонливістю у дітей.

Лікування. Специфічного антидоту до левоцетиризину немає. У випадку появи симптомів передозування рекомендується симптоматична та підтримуюча терапія. Можна розглянути необхідність промивання шлунка через короткий час після застосування препарату. Гемодіаліз для виведення левоцетиризину з організму не ефективний.

Побічні реакції

Побічні реакції, виявлені під час застосування препарату, зазначені нижче.

З боку нервової системи: сонливість, головний біль, підвищена втомлюваність, слабкість, астенія, судоми, парестезія, запаморочення, непритомність, тремор, дисгевзія.

З боку психіки: порушення сну, агресивність, збудження, галюцинації, депресія, безсоння, суїцидальні думки.

З боку органів зору: порушення зору, нечіткість зору.

З боку органів слуху та рівноваги: вертиго.

З боку серцево-судинної системи: відчуття серцебиття, тахікардія.

З боку органів дихання: задишка.

З боку шлунково-кишкового тракту: діарея, блювання, запор, сухість у роті, нудота, біль у животі.

З боку гепатобіліарної системи: гепатит.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: ангіоневротичний набряк, стійкі медикаментозні висипання, свербіж, висипання, кропив'янка.

З боку опорно-рухового апарату: біль у м'язах, артралгія.

З боку імунної системи: гіперчутливість, у тому числі анафілаксія.

З боку нирок та сечовидільної системи: дизурія, затримка сечі.

З боку харчування та обміну речовин: підвищений апетит.

Загальні порушення та стан місця введення: набряк.

Результати досліджень: збільшення маси тіла, відхилення функціональних показників печінкових проб від норми.

Прийом препарату слід припинити у разі появи будь-якого з вищезазначених побічних ефектів та звернутися до лікаря.

Повідомлення щодо підозрюваних побічних реакцій

Повідомлення щодо підозрюваних побічних реакцій після реєстрації лікарського засобу є дуже важливим. Це дозволяє постійно спостерігати за співвідношенням користь/ризик препарату. Медичних працівників просять повідомляти про підозрювані побічні реакції.

Термін придатності

2 роки.

Умови зберігання

Цей лікарський засіб не потребує спеціальних температурних умов зберігання. Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка

По 7 таблеток у блістері; по 4 блістери в пачці.

Категорія відпуску

Без рецепта.

Виробник

ТОВ «Гедеон Ріхтер Польща».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності

вул. Гранична, 35, Гродзиськ Мазовецький, 05-825, Польща.

вул. кн. Ю. Понятовського, 5, Гродзиськ Мазовецький, 05-825, Польща.

Джерело інструкції

Інструкцію лікарського засобу взято з офіційного джерела — [Державного реєстру лікарських засобів України](#).