

Склад

діюча речовина: levocetirizine;

1 таблетка містить левоцетиризину дигідрохлориду 5 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, целюлоза мікрокристалічна, кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат, покриття: Opadry white YS-1-7003: титану діоксид (Е 171), гіпромелоза, поліетиленгліколь, полісорбат 80.

Лікарська форма

Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки, вкриті плівковою оболонкою, білого кольору, круглої форми двоопуклі з рискою з одного боку та гравіюванням «Н», та з гравіюванням «161» - з іншого боку.

Фармакотерапевтична група

Антигістамінні засоби для системного застосування. Похідні піперазину.

Код АТХ R06A E09.

Фармакодинаміка

Левоцетиризин – цеактивний стабільний R-енантіомер цетиризину, що належить до групи конкурентних антагоністів гістаміну. Фармакологічна дія зумовлена блокуванням H1-гістамінових рецепторів. Спорідненість до H1-гістамінових рецепторів у левоцетиризину у 2 рази вище, ніж у цетиризину. Впливає на гістамінзалежну стадію розвитку алергійної реакції, зменшує міграцію еозинофілів, судинну проникність, обмежує вивільнення медіаторів запалення. Попереджає розвиток та полегшує перебіг алергійних реакцій, чинить антиексудативну, протисвербіжну, протизапальну дії, практично не чинить антихолінергічної і антисеротонінової дії. У терапевтичних дозах практично не виявляє седативного ефекту.

Фармакокінетика

Фармакокінетичні параметри левоцетиризину мають лінійну залежність і майже не відрізняються від таких у цетиризину.

Абсорбція. Препарат швидко всмоктується при застосуванні внутрішньо, прийом їжі не впливає на ступінь всмоктування, але знижує його швидкість; біодоступність – 100 %. У 50 % хворих дія препарату розвивається через 12 хв після приймання одноразової дози, а у 95 % — через 0,5-1 годину. Максимальна концентрація (C_{max}) у сироватці досягається через 50 хв після одноразового прийому внутрішньо терапевтичної дози та утримується протягом 2 днів. Максимальна концентрація (C_{max}) становить 207 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 дослідженнях 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 – 90 %.

Біотрансформація. В організмі людини метаболізму піддається близько 14 % левоцетиризину. Процес метаболізму включає оксидацію, N- та O-деалкілування і сполучення з таурином. Деалкілування в першу чергу відбувається за участю цитохрому CYP3A 4, у той час як у процесі оксидації задіяна ціла низка цитохромних ізоформ. Левоцетиризин не впливає на активність цитохромних ізоферментів 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4 у концентраціях, що навіть перевищують пікові після прийняття дози 5 мг перорально. Враховуючи низький ступінь метаболізму, відсутність посилення пригнічувальної дії, взаємодія левоцетиризину з іншими речовинами малоймовірна.

Виведення. Екскреція препарату відбувається в основному за рахунок клубочкової фільтрації та активної каналцевої секреції. Період напіввиведення препарату (T_{1/2}) становить 7,9±1,9 години, загальний кліренс – 0,63 мл/хв/кг. Препарат не накопичується, повністю виводиться з організму за 96 годин. 85,4 % дози препарату виводиться у незміненому вигляді із сечею, близько 12,9 % – з фекаліями.

У хворих з порушеннями функції нирок (кліренс креатиніну < 40 мл/хв) кліренс препарату зменшується, T_{1/2} подовжується (так, у хворих, які перебувають на гемодіалізі, загальний кліренс зменшується на 80 %), а це вимагає підбору відповідного режиму дозування. При проведенні стандартного 4-годинного гемодіалізу видаляється незначна частина (менше 10 %) левоцетиризину. Препарат виділяється в грудне молоко.

Показання

Симптоматичне лікування сезонного алергійного риніту, у тому числі цілорічного алергійного риніту.

Хронічна ідіопатична кропив'янка.

Протипоказання

- Гіперчутливість до левоцетиризину, інших похідних піперазину, а також до інших компонентів препарату;
- тяжка форма хронічної ниркової недостатності (кліренс креатиніну < 10 мл/хв);
- спадкова непереносимість галактози, дефіцит ферменту лактази (β -галактозидази) або порушення засвоєння глюкози і галактози;
- період вагітності або годування груддю;
- дитячий вік до 6 років.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій

Одночасне застосування із псевдоефедриним, циметидином, кетоконазолом, еритроміцином, азитроміцином, гліпезидом або діазепамом не спричиняє клінічно значущих несприятливих взаємодій. Сумісне застосування з теофіліном (400 мг/добу) знижує на 16% загальний кліренс левоцетиризину (кінетика теофіліну не змінюється). При застосуванні в терапевтичних дозах не спостерігалось посилення дії заспокійливих засобів. Але бажано утримуватися від застосування седативних засобів під час проведення терапії.

Особливості застосування

З обережністю застосовують пацієнтам з хронічною нирковою недостатністю (потрібна корекція режиму дозування); пацієнтам літнього віку (можливе зниження клубочкової фільтрації). Під час застосування препарату слід утримуватись від вживання алкоголю. Прийом їжі не впливає на ступінь всмоктування препарату, але знижує швидкість його абсорбції.

Призначаючи препарат, слід брати до уваги наявність у пацієнтів факторів, що провокують затримку сечі (наприклад, травми спинного мозку, гіперплазія передміхурової залози), оскільки левоцетиризин збільшує ризик затримки сечі.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами

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

Застосування у період вагітності або годування груддю

Протипоказано застосовувати у період вагітності.

Препарат виділяється у грудне молоко, тому за необхідності застосовування препарату годування груддю потрібно припинити.

Спосіб застосування та дози

Препарат призначають дорослим та дітям віком від 6 років внутрішньо у добовій дозі 5 мг 1 раз на добу. Приймають таблетку з їжею або натще, не розжовуючи, запиваючи невеликою кількістю води. Хворим літнього віку при нормальній функції нирок зниження дози не потрібне. Для хворих із хронічною нирковою недостатністю розрахунок дози необхідно проводити з урахуванням кліренсу креатиніну відповідно до таблиці.

Функція нирок	Кліренс креатиніну, мл/хв	Доза й кількість приймів
Норма	≥ 80	5 мг 1 раз на добу
Порушення легкого ступеня	50-79	5 мг 1 раз на добу
Порушення помірного ступеня	30-49	5 мг 1 раз на 2 доби
Порушення тяжкого ступеня	< 30	5 мг 1 раз на 3 доби
Кінцева стадія захворювання нирок. Пацієнти, які перебувають на діалізі	< 10	Протипоказано

Хворим з печінковою недостатністю корекція режиму дозування не потрібна.

Хворим з печінковою та нирковою недостатністю коригують режим дозування відповідно до наведеної вище таблиці.

Тривалість застосування: пацієнтів із періодичним алергічним ринітом (тривалість симптомів захворювання становить менше 4 діб на тиждень або менше 4 тижнів) слід лікувати відповідно до 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 4 днів на тиждень або більше 4 тижнів) 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 (дані доступні з клінічних досліджень при застосуванні рацемату).

Для користування таблицею дозування необхідно визначити кліренс креатиніну (КК) пацієнта у мл/хв. КК (мл/хв) визначають за вмістом креатиніну в сироватці крові (мг/дл) за допомогою формули:

$$[140 - \text{вік (роки)}] \times \text{маса тіла (кг)} (\times 0,85 \text{ для жінок})$$

$$\text{КК} = \frac{\text{[140 - вік (роки)]} \times \text{маса тіла (кг)} (\times 0,85 \text{ для жінок})}{72 \times \text{креатинін сироватки крові (мг/дл)}}$$

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 застосування левоцетиризину у лікарській формі, придатній для використання у педіатрії.

Передозування

Симптоми передозування: може мати ознаки інтоксикації у вигляді сонливості; у дітей передозування може супроводжуватися занепокоєнням і підвищеною дратівливістю.

Лікування: з появою симптомів передозування (особливо у дітей) прийом препарату необхідно припинити; проводять промивання шлунка, застосовують активоване вугілля; терапія симптоматична. Специфічного антидоту немає, гемодіаліз не ефективний.

Побічні реакції

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

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

З боку серця: посилене серцебиття, тахікардія.

З боку органів зору: порушення зору, нечіткість зору.

З боку органів слуху та рівноваги: вертиго.

З боку печінки та жовчовивідних шляхів: гепатит.

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

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

З боку дихальної системи: задишка.

З боку травної системи: діарея, блювання, запор, сухість у роті, нудота, біль у животі.

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

З боку скелетно-м'язової системи, сполучної тканини та кісток: міалгія.

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

Порушення харчування та обміну речовин: підвищений апетит.

Загальні порушення: набряк.

Термін придатності

3 роки.

Умови зберігання

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка

По 10 таблеток у блістері, по 3 блістери у картонній коробці.

Категорія відпуску

Без рецепта.

Виробник

Гетеро Лабз Лімітед.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності

Юніт III, Формулейшн Плот № 22 - 110 ІДА, Джидіметла, Хайдерабад, 500 055
Телангана, Індія

Джерело інструкції

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