

## **Состав**

*действующее вещество:* levocetirizine;

1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит левоцетиризина дигидрохлорида в пересчете на 100 % вещество 5 мг;

*вспомогательные вещества:* целлюлоза микрокристаллическая; лактоза, моногидрат; кремния диоксид коллоидный безводный; магния стеарат; покрытие: гипромеллоза; полиэтиленгликоль 6000; титана диоксид (E171).

## **Лекарственная форма**

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

*Основные физико-химические свойства:* таблетки круглой формы с двояковыпуклой поверхностью, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Антигистаминные средства для системного применения. Производные пиперазина. Код АТХ R06A E09.

## **Фармакодинамика**

Левоцетиризин – это активный стабильный R-энантиомер цетиризина, который относится к группе конкурентных антагонистов гистамина. Фармакологическое действие обусловлено блокированием H1-гистаминовых рецепторов. Сродство с H1-гистаминовыми рецепторами у левоцетиризина в 2 раза выше, чем у 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, противозудное, противовоспалительное действие, почти не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия.

## **Фармакокинетика**

Фармакокинетические параметры левоцетиризина имеют линейную зависимость, не зависят от дозы и времени, демонстрируют низкую вариабельность между пациентами. Фармакокинетический профиль при

введении единственного энантиомера такой же, как и при применении цетиризина. В процессе абсорбции или выведения не наблюдается хиральная инверсия.

*Абсорбция.* Препарат после перорального применения быстро и интенсивно всасывается. Степень всасывания левоцетиризина не зависит от дозы препарата и не изменяется с приемом пищи, но максимальная концентрация ( $C_{max}$ ) препарата уменьшается и достигает своего максимального значения позже. Биодоступность достигает 100 %.

У 50 % больных действие препарата развивается через 12 минут после приема однократной дозы, а у 95 % – через 0,5-1 час.  $C_{max}$  в сыворотке крови достигается через 50 минут после однократного приема внутрь терапевтической дозы. Равновесная концентрация в крови достигается после двух дней приема препарата.  $C_{max}$  составляет 270 нг/мл после однократного применения и 308 нг/мл – после повторного применения в дозе 5 мг соответственно.

*Распределение.* Отсутствует информация относительно распределения препарата в тканях человека, а также относительно проникновения левоцетиризина через гематоэнцефалический барьер. Объем распределения – 0,4 л/кг. Связывание с белками плазмы крови человека – 90 %.

*Биотрансформация.* В организме человека уровень метаболизма составляет меньше 14 % от дозы и поэтому разница в результате генетического полиморфизма или сопутствующего приема ферментных ингибиторов, как ожидается, будет незначительной. Процесс метаболизма включает ароматическую оксидацию, N- и O-деалкилирование и соединение с таурином. Деалкилирование в первую очередь происходит при участии цитохрома CYP 3A4, тогда как в процессе ароматической оксидации принимают участие 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 угнетению метаболизма, взаимодействие левоцетиризина с другими веществами (и наоборот) маловероятно.

*Выведение.* Экскреция левоцетиризина происходит двумя путями – за счет клубочковой фильтрации и активной канальцевой секреции. Период полувыведения левоцетиризина из плазмы крови у взрослых ( $T_{1/2}$ ) составляет  $7,9 \pm 1,9$  часа.  $T_{1/2}$  левоцетиризина короче у маленьких детей. Средний очевидный общий клиренс у взрослых – 0,63 мл/мин/кг. В основном левоцетиризин и его метаболиты выводятся из организма с мочой (в среднем 85,4 % применяемой дозы препарата). С фекалиями выводится только 12,9 %

применяемой дозы препарата.

## Особые популяции

### *Нарушение функций 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 по сравнению с таковым у лиц с нормальной функцией почек, уменьшается приблизительно на 80 %. Количество левоцетиризина, которое выводится во время стандартной 4-часовой процедуры гемодиализа, составляло меньше 10 %.

## **Показания**

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

## **Противопоказания**

- Повышенная чувствительность к левоцетиризину, цетиризину, гидроксизину, к каким-либо другим производным пиперазина или к любому другому вспомогательному веществу препарата.
- Тяжелая форма хронической почечной недостаточности (клиренс креатинина
- Редкие наследственные состояния непереносимости галактозы, лактазной недостаточности или нарушения усвоения глюкозы и галактозы.
- Период беременности или кормления грудью.

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

Исследования с левоцетиризином относительно взаимодействия (включая исследования с ферментами CYP3A4) не проводились. Исследования с цетиризином (соединение рацемата) показали, что одновременное применение с антипирином, азитромицином, циметидином, диазепамом, эритромицином, глипизидом, кетоконазолом или псевдоэфедрином не оказывает клинически значимых неблагоприятных взаимодействий. При совместном применении с теофиллином (400 мг в сутки) наблюдалось небольшое снижение (на 16 %) общего клиренса левоцетиризина (распределение теофиллина не изменялось). При исследовании многократного введения ритонавира (600 мг 2 раза в сутки) и

цетиризина (10 мг в сутки) степень экспозиции цетиризина увеличивалась приблизительно на 40 %, тогда как распределение ритонавира несколько изменялось (-11 %) к параллельному применению цетиризина.

Нет данных относительно усиления эффекта седативных средств при применении в терапевтических дозах. Но следует избегать применения седативных средств во время приема препарата.

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

Одновременное применение цетиризина или левоцетиризина и алкоголя или других депрессантов центральной нервной системы может вызвать дополнительное снижение внимательности и нарушение способности выполнения работы.

### **Особенности применения**

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

Во время применения препарата следует воздерживаться от употребления алкоголя.

При наличии у пациентов определенных факторов, провоцирующих задержку мочи (например, травмы спинного мозга, гиперплазия предстательной железы) препарат следует назначать с осторожностью, так как левоцетиризин может увеличить риск задержки мочи.

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

На период лечения препаратом следует воздерживаться от управления автотранспортом или работы с другими потенциально опасными механизмами.

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

Левоцетиризин противопоказан в период беременности.

Левоцетиризин проникает в грудное молоко, поэтому при необходимости применения препарата кормление грудью следует прекратить.

## *Фертильность.*

Нет клинических данных (включая исследования на животных) относительно влияния левоцетиризина на фертильность.

## **Способ применения и дозы**

Препарат применяют внутрь независимо от употребления пищи. Таблетку необходимо глотать целой, запивая небольшим количеством воды.

Рекомендуется применять суточную дозу за один прием.

Препарат назначают взрослым и детям с 6 лет.

### Рекомендованные дозы

*Взрослые и дети с 12 лет:* суточная доза составляет 5 мг (1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой) 1 раз в сутки.

### *Пациенты пожилого возраста*

Больным пожилого возраста с нормальной функцией почек коррекция дозы препарата не нужна.

Корректирование дозы рекомендуется пациентам пожилого возраста с нарушением функций почек от умеренной до тяжелой степени.

### *Пациенты с нарушениями функций почек*

Больным с нарушенной функцией почек расчет дозы необходимо проводить с учетом степени нарушения функции почек (клиренса креатинина), см. таблицу ниже.

Клиренс креатинина (КК) определяют по содержанию креатинина в сыворотке крови (мг/дл) по формуле:

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

Дозировка препарата для больных с нарушенной функцией почек

| Функция почек                                                                   | Клиренс креатинина,<br>мл/мин | Доза и количество<br>приемов |
|---------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------|------------------------------|
| Нормальная функция почек                                                        | $\geq 80$                     | 5 мг 1 раз в сутки           |
| Нарушения легкой степени                                                        | 50-79                         | 5 мг 1 раз в сутки           |
| Нарушения умеренной<br>степени                                                  | 30-49                         | 5 мг 1 раз в 2 суток         |
| Нарушения тяжелой степени                                                       | 5 мг 1 раз в 3 суток          |                              |
| Конечная стадия заболевания<br>почек<br><br>Пациенты, находящиеся на<br>диализе | Противопоказано               |                              |

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

Не существует специфических данных относительно применения детям с нарушением функций почек.

#### *Пациенты с нарушением функций печени*

Больным исключительно с печеночной недостаточностью коррекция дозировки не нужна. Больным с печеночной и почечной недостаточностью корректировать дозировку в соответствии с приведенной выше таблицей.

#### *Педиатрическая популяция*

Дети с 6 до 12 лет: рекомендованная суточная доза – 5 мг (1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой).

Для детей с 2 до 6 лет невозможна коррекция дозы препарата в данной лекарственной форме (таблетка, покрытая пленочной оболочкой).

Рекомендуется принимать левоцетиризин в другой лекарственной форме, пригодной для применения в педиатрии.

## Длительность применения

Пациентов с периодическим аллергическим ринитом (длительность симптомов заболевания составляет меньше чем 4 суток в неделю или в течение меньше чем 4 недели в год) следует лечить в соответствии с заболеванием и анамнезом; лечение можно прекратить, если симптомы исчезнут, и можно восстановить снова при повторном возникновении симптомов. В случае стойкого аллергического ринита (длительность симптомов заболевания составляет больше чем 4 суток в неделю и в течение больше чем 4 недель в год) в период контакта с аллергенами пациенту может быть предложена постоянная терапия. Существует клинический опыт применения левоцетиризина в течение минимум 6-месячного периода лечения. При хронических заболеваниях (хронический аллергический ринит, хроническая крапивница) длительность лечения составляет до 1 года (данные клинических исследований применения рацемата).

## **Дети**

Препарат в виде таблеток не применяют детям до 6 лет, так как эта лекарственная форма не дает возможности проводить необходимую коррекцию дозировки. Данной категории пациентов рекомендуется назначение левоцетиризина в другой лекарственной форме, пригодной для применения в педиатрии.

## **Передозировка**

*Симптомы:* симптомы передозировки могут включать сонливость у взрослых и начальное возбуждение и повышенное раздражение с последующей сонливостью у детей.

*Лечение.* Специфического антидота к левоцетиризину нет. В случае появления симптомов передозировки рекомендуется симптоматическая и поддерживающая терапия. Можно рассмотреть необходимость промывания желудка через короткий промежуток времени после применения препарата. Гемодиализ для выведения левоцетиризина из организма не эффективный.

## **Побочные реакции**

*Со стороны иммунной системы:* гиперчувствительность, в том числе анафилаксия.

*Со стороны обмена веществ:* повышенный аппетит.

*Со стороны нервной системы:* сонливость, головная боль, повышенная утомляемость, слабость, астения, судороги, парестезия, головокружение, обморок, тремор, дисгевзия.

*Со стороны психики:* нарушение сна, возбуждение, галлюцинации, депрессия, агрессия, бессонница, суицидальные мысли.

*Со стороны сердца:* усиленное сердцебиение, тахикардия.

*Со стороны органов зрения:* нарушение зрения, нечеткость зрения.

*Со стороны органов слуха:* вертиго.

*Со стороны гепатобилиарной системы:* гепатит.

*Со стороны мочевыделительной системы:* дизурия, задержка мочи.

*Со стороны дыхательной системы:* одышка.

*Со стороны пищеварительного тракта:* диарея, рвота, запор, сухость во рту, тошнота, боль в животе.

*Со стороны кожи и подкожных тканей:* ангионевротический отек, стойкие медикаментозные высыпания, зуд, сыпь, крапивница.

*Со стороны костно-мышечной системы:* миалгия, артралгия.

*Общие нарушения:* отек.

*Результаты исследований:* увеличение массы тела, отклонения функциональных печеночных проб от нормы.

#### Сообщения относительно подозреваемых побочных реакций

Сообщения относительно подозреваемых побочных реакций после получения регистрационного удостоверения являются очень важными. Это дает возможность постоянно наблюдать за соотношением польза/риск препарата. Медицинским работникам следует сообщать о подозрительных побочных реакциях через систему национальной отчетности.

#### **Срок годности**

4 года.

#### **Условия хранения**

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

**Упаковка**

По 10 таблеток в блистере, по 2 блистера в коробке из картона.

**Категория отпуска**

Без рецепта.

**Производитель**

ООО «АСТРАФАРМ», Украина.

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

08132, Киевская обл., Киево-Святошинский р-н, г. Вишневое, ул. Киевская, 6.

**Источник инструкции**

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