

## **Состав**

*действующее вещество: levocetirizine dihydrochloride;*

1 таблетка, покрытая оболочкой содержит левоцетиризина дигидрохлорида 5 мг;

*вспомогательные вещества:* лактоза, целлюлоза микрокристаллическая, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, Opadry White OY-58900 (содержит гипромеллоза (E 464), титана диоксид (E 171), макрогол (E1521)).

## **Лекарственная форма**

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

*Основные физико-химические свойства:* овальные таблетки от белого до почти белого цвета, покрытые пленочной оболочкой, двояковыпуклые, с гравировкой "R 5» с одной стороны и гладкие с другой.

## **Фармакотерапевтическая группа**

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

## **Фармакодинамика**

Левоцетиризин - активный стабильный R-энантиомер цетиризина, который относится к группе конкурентных антагонистов гистамина. Его фармакологическое действие обусловлено блокированием H<sub>1</sub>-рецепторов. Сродство к H<sub>1</sub>-рецепторов в левоцетиризина в 2 раза выше, чем в цетиризина. Левоцетиризин 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.

Фармакокинетические параметры левоцетиризина имеют линейную зависимость и почти не отличаются от таковых у цетиризина.

## **Фармакокинетика**

*Абсорбция.* Препарат быстро и интенсивно всасывается после приема внутрь. Степень всасывания не зависит от дозы и не меняется с приемом пищи, но максимальная концентрация (max) уменьшается и достигает своего максимального значения позже. Биодоступность составляет 100%.

У 50% больных действие препарата развивается через 12 минут после приема однократной дозы, а в 95% - через полчаса - час. С max в сыворотке крови достигается через 50 минут после приема однократного приема терапевтической дозы. Равновесная концентрация в крови достигается после 2 дней приема препарата. С max составляет 270 нг / мл после однократного приема и 308 нг / мл - после повторного применения в дозе 5 мг.

*Распределение.* Информация о распределении препарата в тканях, а также проникновение через гематоэнцефалический барьер у человека на данный момент отсутствует. Связывание с белками плазмы крови составляет 90%.

*Метаболизм.* В организме человека метаболизируется около 14% левоцетиризина. Процесс метаболизма включает оксидацию, N-и O-деалкилирования и сообщения с таурином. Деалкилирования в первую очередь происходит при участии цитохрома CYP 3A4, а в процессе окисления участвуют многочисленные изоформы ферментов CYP. Левоцетиризин не влияет на активность цитохромных изоферментов 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4 в концентрациях, значительно превышающих максимальные после принятия пероральной дозы 5 мг. Учитывая низкую степень метаболизма и отсутствие способности к подавлению метаболизма, взаимодействие левоцетиризина с другими веществами маловероятно.

*Выведение.* Экскреция левоцетиризина происходит в основном за счет клубочковой фильтрации и активной канальцевой секреции. Период полувыведения препарата из плазмы крови у взрослых ( $T_{1/2}$ ) составляет  $7,9 \pm 1,9$  ч. Период полувыведения короче у маленьких детей. Общий клиренс у взрослых - 0,63 мл / мин / кг. В основном вывода левоцетиризина и его метаболитов из организма происходит с мочой - в среднем 85,4% принятой дозы, с калом выводится 12,9% принятой дозы.

*Клиренс левоцетиризина коррелирует с клиренсом креатинина.* Таким образом, пациентам с умеренными и тяжелыми нарушениями функции почек рекомендуется подбирать интервалы между приемами левоцетиризина с учетом клиренса креатинина. При анурии в 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, составляла  $\leq 10\%$ .

## **Показания**

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

## **Противопоказания**

- Повышенная чувствительность к левоцетиризину, производным пиперазина или к любому другому компоненту препарата.
- Тяжелая форма хронической почечной недостаточности (клиренс креатинина  $\leq 10$  мл / мин). Редкие наследственные заболевания непереносимости галактозы, недостаточность лактазы или нарушением всасывания глюкозы и галактозы.

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

Специальные исследования по левоцетиризину по взаимодействию с другими лекарственными средствами не проводились. Исследования по цетиризину (соединения рацемата) показали, что одновременное применение с антипирином, псевдоэфедрина, циметидином, кетоконазолом, эритромицином, азитромицином, глипезидом или диазепамом не оказывает клинически значимых неблагоприятных взаимодействий. Одновременное применение с теофиллином (400 мг / сут) снижает на 16% общий клиренс цетиризина (кинетика теофиллина не изменяется). В исследованиях при многократном введении ритонавира (600 мг 2 раза в сутки) и цетиризина (10 мг в сутки) степень экспозиции цетиризина увеличивался примерно на 40%, в то время как распределение ритонавира несколько менялся (-11%) до одновременного применения цетиризина. Нет данных по усилению эффекта седативных средств при применении в терапевтических дозах. Однако рекомендуется избегать применения приема седативных средств одновременно с приемом левоцетиризина. Прием пищи не влияет на степень всасывания препарата, но одновременное употребление пищи снижает скорость абсорбции.

Одновременное применение цетиризина или левоцетиризина и алкоголя или других депрессантов ЦНС уязвимыми пациентами может повлечь за них дополнительное снижение бдительности и нарушение выполнения работы.

## **Особенности применения**

Левосетиризин, таблетки, покрытые пленочной оболочкой не рекомендуется применять у детей в возрасте до 6 лет, потому что эта лекарственная форма не предусматривает надлежащего корректировки дозы. Детям до 6 лет следует применять лекарственную форму для педиатрического применения.

Следует проявлять осторожность при применении совместно с приемом алкоголя.

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

Следует воздержаться от управления автотранспортом и работы с механизмами при применении препарата.

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

Левосетиризин противопоказан женщинам в период беременности. Сетиризин проникает в грудное молоко, поэтому при применении препарата кормление грудью следует прекратить.

### **Способ применения и дозы**

Применяют взрослым и детям старше 6 лет в дозе 5 мг левосетиризина 1 раз в сутки независимо от приема пищи. Таблетку необходимо глотать не разжевывая, запивая небольшим количеством чистой воды.

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 согласно представленной ниже таблице.

Таблица 1.

Коррекция дозы для больных с нарушенной функцией почек:

| Функция почек | Клиренс креатинина, мл/мин | Доза и количество 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 степени                                               | 30-49                | 5 мг 1 раз в 2 суток |
| Нарушения тяжелой степени                                                 | 5 мг 1 раз в 3 суток |                      |
| Конечная стадия заболевания почек<br><br>Пациенты, находящиеся на диализе | Противопоказано      |                      |

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

Больным только с печеночной недостаточностью коррекция режима дозирования не требуется.

Больным с печеночной и почечной недостаточностью следует корректировать режим дозирования в соответствии с таблицей 1.

*Длительность применения левоцетиризина такова:*

Пациентам с периодическим аллергическим ринитом (симптомы заболевания проявляются в течение  $\leq 4$  дней в неделю или симптомы продолжаются менее 4 недель) следует применять левоцетиризин согласно заболеванию и анамнеза; лечение можно прекратить при исчезновении симптомов и восстановить при

повторном возникновении симптомов.

У пациентов с устойчивым аллергическим ринитом (симптомы заболевания проявляются в течение  $\geq 4$  дней в неделю или симптомы длятся более 4 недель) в период контакта с аллергенами может быть предложена постоянная терапия.

У пациентов с хроническим аллергическим ринитом и крапивницей длительность применения может составлять до 1 года.

## **Дети**

Препарат применяется детям от 6 лет.

## **Передозировка**

*Симптомы:* могут включать сонливость у взрослых и первоначальное возбуждение и повышенную раздражительность с последующей сонливостью у детей.

*Лечение:* специфического антидота для левоцетиризина пока нет. При проявлении симптомов передозировки рекомендуется симптоматическая и поддерживающая терапия. Следует рассмотреть необходимость промывание желудка через короткое время после применения препарата. Гемодиализ неэффективен.

## **Побочные реакции**

*При применении левоцетиризина возможно возникновение таких побочных реакций:*

*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 органов 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 желудочно-кишечного 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, соединительной ткани и костей:* миалгия, артралгия

*Данные исследований:* увеличение массы тела, отклонения функции печени от нормы;

*Нарушения питания и обмена веществ:* повышенный аппетит.

*Общие нарушения:* отек.

### **Срок годности**

2 года.

### **Условия хранения**

Хранить в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте при температуре ниже 25 °С.

### **Упаковка**

По 10 таблеток в блистере. По 1 блистеру в картонной коробке.

### **Категория отпуска**

Без рецепта.

### **Производитель**

Д-р Редди'с Лабораторис Лтд, Индия.

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

Участок № 41, с. Бачупали, Бачупали Мандал, округ Медчал Малкайгири, Телангана 500090, Индия.

**Источник инструкции**

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