

Состав

действующее вещество: левоцетиризин;

1 таблетка, покрытая оболочкой, содержит 5 мг левоцетиризина дигидрохлорида;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая (тип 102), лактоза, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат;

оболочка: опадри белый (гипромеллоза (Е 464), титана диоксид (Е 171), макрогол 400).

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства: белого или почти белого цвета продолговатые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, с гравировкой «R23» с одной стороны. Длина около 8 мм, ширина около 4,5 мм.

Фармакотерапевтическая группа

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

Фармакодинамика

Левоцетиризин - это активный стабильный R-энантиомер цетиризина, относится к группе конкурентных и селективных антагонистов H₁-рецепторов.

Фармакологическое действие обусловлено блокированием H₁-рецепторов.

Сродство к H₁-рецепторов в левоцетиризина 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 облегчает течение аллергических реакций, оказывает антиэкссудативное, противоаллергическое, противовоспалительное действие, практически не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия.

Данные ЭКГ не показали соответствующего влияния левоцетиризина на интервал QT.

Фармакокинетика

Фармакокинетические параметры левоцетиризина имеют линейную зависимость, не зависят 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 хоральная инверсия.

Всасывание. Левоцетиризин быстро и интенсивно всасывается после приема внутрь. Степень всасывания препарата не зависит от дозы и не меняется с приемом пищи, но максимальная концентрация (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 в 95% - через 0,5-1 час. Максимальная концентрация (C_{max}) в сыворотке крови достигается через 50 минут после однократного приема внутрь терапевтической дозы. Равновесная концентрация в крови достигается после 2 дней приема препарата. Максимальная концентрация составляет 270 нг / мл после однократного применения и 308 нг / мл - после повторного применения в дозе 5 мг соответственно.

Распределение. Отсутствует информация о распределении препарата в тканях человека, а также о проникновении левоцетиризина сквозь гематоэнцефалический барьер. В ходе исследований на животных наибольшая концентрация зафиксирована в печени и почках, а самая низкая - в тканях центральной нервной системы. Объем распределения - 0,4 л / кг. Связывание с белками плазмы крови человека - 90%.

Метаболизм. В организме человека уровень метаболизма составляет менее 14% от дозы левоцетиризина, и поэтому разница 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. Деалкилирования, в первую очередь, происходит при участии цитохрома CYP 3A4, в то время как в процессе ароматического окисления задействован целый ряд цитохромных изоформ CYP. Левоцетиризин не влияет на активность цитохромных изоферментов 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4 в концентрациях, значительно превышающих максимальные после принятия дозы 5 мг перорально. Учитывая низкую степень метаболизма и отсутствие способности к подавлению метаболизма, взаимодействие левоцетиризина с другими веществами (и наоборот) маловероятно.

Выведение. Экскреция препарата происходит двумя путями - за счет клубочковой фильтрации и активной канальцевой секреции. Период полувыведения ($T_{1/2}$) у взрослых составляет $7,9 + 1,9$ часа. Средний очевиден общий клиренс - $0,63$ мл / мин / кг. В основном вывода левоцетиризина и его метаболитов из организма с мочой, что составляет в среднем $85,4\%$ дозы препарата. С фекалиями выводится только $12,9\%$ дозы препарата.

Особые популяции

Нарушение функции почек

Очевидный клиренс левоцетиризина для организма коррелирует с клиренсом креатинина. Поэтому у пациентов с умеренными и тяжелыми нарушениями функции почек рекомендуется подбирать интервалы между приемами левоцетиризина с учетом клиренса креатинина. При анурии при 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, составила $<10\%$.

Показания

Симптоматическое лечение аллергических ринитов, в том числе круглогодичных аллергических ринитов; хроническая идиопатическая крапивница.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к левоцетиризину, цетиризину, гидроксизину и другим производным пиперазина или к любому другому компоненту препарата.
- Тяжелая почечная недостаточность при КК менее 10 мл / мин.
- Тяжелая наследственная непереносимость галактозы, дефицит фермента лактазы (β -галактозидазы) или нарушение усвоения глюкозы и галактозы.
- Беременность и период кормления грудью.
- Возраст до 6 лет.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Одновременное применение с феназином, псевдоэфедрином, циметидином, кетоконазолом, эритромицином, азитромицином, глипезидом или диазепамом не проявляет клинически значимых неблагоприятных взаимодействий. При совместном применении с теофиллином (400 мг / сут) наблюдалось небольшое

снижение на 16% общего клиренса левоцетиризина, при этом кинетика теофиллина не меняется. При совместном введении ритонавира и цетиризина степень экспозиции цетиризина увеличивался, тогда как распределение ритонавира несколько менялся (-11%).

Одновременное применение левоцетиризина и алкоголя или других препаратов, угнетающих функцию центральной нервной системы у чувствительных пациентов может вызвать дополнительное снижение бдительности и способности к выполнению работы. Следует воздерживаться от применения седативных средств во время проведения терапии.

Особенности применения

С осторожностью применять пациентам с хронической почечной недостаточностью (требуется коррекция режима дозирования), пациентам пожилого возраста (возможно снижение клубочковой фильтрации).

Во время применения препарата следует воздерживаться от употребления алкоголя (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

При наличии у пациентов определенных факторов, провоцирующих задержку мочи (например, травмы спинного мозга, гиперплазия предстательной железы) необходимо обратить на это внимание при назначении препарата, поскольку левоцетиризин может увеличить риск задержки мочи.

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

Следует воздерживаться от управления автотранспортом или работы с потенциально опасными механизмами во время лечения.

Применение в период беременности или кормления грудью

Левоцетиризин противопоказан для применения в период беременности. Препарат проникает в грудное молоко, поэтому при необходимости применения препарата в период кормления грудью следует прекратить.

Фертильность

Нет данных о влиянии левоцетиризина на фертильность.

Способ применения и дозы

Препарат назначают взрослым и детям старше 6 лет.

Взрослые и дети старше 6 лет: рекомендуемая суточная доза составляет 5 мг (1 таблетка, покрытая оболочкой).

Больным пожилого возраста при нормальной функции почек снижение дозы не требуется.

Коррекция дозы рекомендуется у пациентов пожилого возраста с умеренной и тяжелой почечной недостаточностью (см. «Пациенты с нарушенной функцией почек»).

Взрослые пациенты с нарушением функции почек

Интервалы дозирования должны быть индивидуализированы в зависимости от степени нарушения функции почек.

Коррекция дозы для больных с нарушенной функцией почек:

Функция почек	Клиренс креатинина, мл/мин	Доза и количество пр
Нормальная функция почек	≥ 80	5 мг 1 раз в сутки
Нарушения функции почек легкой степени	50-79	5 мг 1 раз в сутки
Нарушения функции почек умеренной степени	30-49	5 мг 1 раз в 2 суток
Нарушения функции почек тяжелой степени	< 30	5 мг 1 раз в 3 суток
Терминальная стадия почечной недостаточности Пациенты, находящиеся на гемодиализе	< 10	Противопоказано

Больным с печеночной недостаточностью коррекция режима дозирования не требуется. Больным с печеночной и почечной недостаточностью следует корректировать режим дозирования в соответствии с таблицей, приведенной выше, после консультации с врачом.

У детей с почечной недостаточностью коррекцию дозы необходимо проводить индивидуально, исходя из показателя клиренса креатинина и массы тела пациента. Специальные данные о режиме приема препарата детьми с почечной недостаточностью отсутствуют.

Длительность применения

Пациентов с периодическим аллергическим ринитом (длительность проявления симптомов заболевания составляет менее 4 дней в неделю или менее 4 недель в году) следует лечить в соответствии с течением заболевания и анамнеза; лечение можно прекратить, если симптомы исчезнут, и можно восстановить снова при повторном возникновении симптомов. В случае устойчивого аллергического ринита (продолжительность симптомов заболевания составляет более 4 дней в неделю или более 4 недель в году) в период контакта с аллергенами пациенту может быть предложена постоянная терапия. При хронических заболеваниях (хронический аллергический ринит, хроническая крапивница) продолжительность лечения составляет до 1 года.

Способ применения

Принимать таблетку необходимо внутрь, независимо от приема пищи. Таблетку необходимо глотать целиком, запивая небольшим количеством воды. Рекомендуются применять суточную дозу в один прием.

Дети

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.

Передозировка

Симптомы: симптомы передозировки могут включать сонливость у взрослых и первоначальное возбуждение и повышенную раздражительность 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 короткое время после применения препарата. Гемодиализ для выведения левоцетиризина из организма не эффективен.

Побочные реакции

Побочные реакции, выявленные во время применения препарата, указанные ниже.

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

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

Со стороны органов зрения: нарушение зрения, нечеткость зрения.

Со стороны органов слуха и равновесия: вертиго.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: сердцебиение, тахикардия.

Со стороны органов дыхания: одышка.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: диарея, рвота, запор, сухость во рту, тошнота, боль в животе.

Со стороны пищеварительной системы: гепатит.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: ангионевротический отек, устойчивые медикаментозные высыпания, зуд, сыпь, крапивница.

Со стороны опорно-двигательного аппарата: боль в мышцах, артралгия.

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

Со стороны почек и мочевыделительной системы: дизурия, задержка мочи.

Со стороны питания и обмена веществ: повышенный аппетит.

Общие нарушения и состояние места введения: отек.

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

Прием препарата следует прекратить при появлении любого из вышеупомянутых побочных эффектов и обратиться к врачу.

Сообщение о подозреваемых побочных реакциях

Сообщение о подозреваемых побочных реакциях после регистрации лекарственного средства является очень важным. Это позволяет постоянно наблюдать за соотношением польза / риск препарата. Медицинских работников просят сообщать о подозреваемых побочных реакциях.

Срок годности

2 года.

Условия хранения

Это лекарственное средство не требует специальных температурных условий хранения. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 7 таблеток в блистере, по 4 блистера в пачке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

ТОВ «Гедеон Ріхтер Польща».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

ул. Предельная, 35, Гродзиск Мазовецкий, 05-825, Польша.

ул. кн. Ю. Понятовского, 5, Гродзиск Мазовецкий, 05-825, Польша.

Источник инструкции

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