

Состав

действующее вещество: levocetirizine;

1 таблетка содержит левоцетиризина дигидрохлорида 5 мг;

вспомогательные вещества: лактоза, целлюлоза микрокристаллическая, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, покрытие: Opadry white YS-1-7003 титана диоксид (E 171), гипромеллоза, полиэтиленгликоль, полисорбат 80.

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства: таблетки, покрытые пленочной оболочкой, белого цвета, круглой формы, двояковыпуклые с насечкой с одной стороны и гравировкой «Н», и с гравировкой «161» - с другой стороны.

Фармакотерапевтическая группа

Антигистаминные средства для системного применения. Производные пиперазина.

Код АТХ R06A E09.

Фармакодинамика

Левоцетиризин - цеактивный стабильный R-энантиомер цетиризина, относится к группе конкурентных антагонистов гистамина. 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. В терапевтических дозах практически не оказывает седативного эффекта.

Фармакокинетика

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

Абсорбция. Препарат быстро всасывается при приеме внутрь, прием пищи не влияет на степень всасывания, но снижает его скорость; биодоступность - 100%. У 50% больных действие препарата развивается через 12 мин после приема однократной дозы, а в 95% - через 0,5-1 час. Максимальная концентрация (C_{max}) в сыворотке достигается через 50 мин после однократного приема внутрь терапевтической дозы и сохраняется в течение 2 дней. Максимальная концентрация (C_{max}) составляет 207 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 исследованиях 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 - 90%.

Метаболизм. В организме человека метаболизму подвергается около 14% левоцетиризина. Процесс метаболизма включает оксидацию, N- и O-деалкилирования и сообщения с таурином. Деалкилирования в первую очередь происходит при участии цитохрома CYP3A 4, в то время как в процессе окисления задействован целый ряд цитохромных изоформ. Левоцетиризин не влияет на активность цитохромных изоферментов 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4 в концентрациях, даже превышают пиковые после принятия дозы 5 мг перорально. Учитывая низкую степень метаболизма, отсутствие усиления угнетающего действия, взаимодействие левоцетиризина с другими веществами маловероятно.

Вывод. Экскреция препарата происходит в основном за счет клубочковой фильтрации и активной канальцевой секреции. Период полувыведения (T_{1/2}) составляет 7,9 ± 1,9 часа, общий клиренс - 0,63 мл/мин/кг. Препарат не накапливается, полностью выводится из организма за 96 часов. 85,4% дозы препарата выводится в неизмененном виде с мочой, около 12,9% - с калом.

У больных с нарушениями функции почек (клиренс креатинина <40 мл/мин) клиренс препарата уменьшается, T_{1/2} удлиняется (так, у больных, находящихся на гемодиализе, общий клиренс уменьшается на 80%), а это требует подбора соответствующего режима дозирования. При проведении стандартного 4-часового гемодиализа удаляется незначительная часть (менее 10%) левоцетиризина. Препарат проникает в грудное молоко.

Показания

Симптоматическое лечение сезонного аллергического ринита, в том числе круглогодичного аллергического ринита.

Хроническая идиопатическая крапивница.

Противопоказания

- Гиперчувствительность к левоцетиризину, другим производных пиперазина, а также другим компонентам препарата;
- тяжелая форма хронической почечной недостаточности (клиренс креатинина <10 мл/мин);
- наследственная непереносимость галактозы, дефицит фермента лактазы (β -галактозидазы) или нарушение усвоения глюкозы и галактозы;
- период беременности и кормления грудью;
- возраст до 6 лет.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Одновременное применение с псевдоэфедрина, циметидином, кетоконазолом, эритромицином, азитромицином, глипезидом или диазепамом не вызывает клинически значимых неблагоприятных взаимодействий. Совместное применение с теофиллином (400 мг/сут) снижает на 16% общий клиренс левоцетиризина (кинетика теофиллина не изменяется). При применении в терапевтических дозах не наблюдалось усиление действия успокоительных средств. Но желательно воздерживаться от применения седативных средств во время проведения терапии.

Особенности применения

С осторожностью применяют у пациентов с хронической почечной недостаточностью (требуется коррекция режима дозирования) пациентам пожилого возраста (возможно снижение клубочковой фильтрации). Во время применения препарата следует воздерживаться от употребления алкоголя. Прием пищи не влияет на степень всасывания препарата, но снижает скорость абсорбции.

Назначая препарат, следует принимать во внимание наличие у пациентов факторов, провоцирующих задержку мочи (например, травмы спинного мозга, гиперплазия предстательной железы), поскольку левоцетиризин увеличивает риск задержки мочи.

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

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

Применение в период беременности или кормления грудью

Противопоказано применять в период беременности.

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

Способ применения и дозы

Препарат назначают взрослым и детям старше 6 лет внутрь в дозе 5 мг 1 раз в сутки. Принимают таблетку с пищей или натошак, не разжевывая, запивая небольшим количеством воды. Больным пожилого возраста при нормальной функции почек снижение дозы не требуется. Для больных с хронической почечной недостаточностью расчет дозы необходимо проводить с учетом клиренса креатинина в соответствии с таблицей.

Функция почек	Клиренс креатинина, мл/мин	Доза и количество приемов
Норма	≥ 80	5 мг 1 раз в сутки
Нарушение легкой степени	50-79	5 мг 1 раз в сутки
Нарушение умеренной степени	30-49	5 мг 1 раз в 2 суток
Нарушение тяжелой степени	< 30	5 мг 1 раз в 3 суток
Конечная стадия заболевания почек. Пациенты, находящиеся на диализе	< 10	противопоказано

Больным с печеночной недостаточностью коррекция режима дозирования не требуется. Больным с печеночной и почечной недостаточностью корректируют режим дозирования в соответствии с приведенной выше таблицы.

Длительность применения: пациентов с периодическим аллергическим ринитом (продолжительность симптомов заболевания составляет менее 4 дней в

неделю или менее 4 недель) следует лечить в соответствии с заболеванием 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 период контакта с аллергенами пациенту может быть предложена постоянная терапия. При хронических заболеваниях (хронический аллергический ринит, хроническая крапивница) продолжительность лечения составляет до 1 года (данные доступны по клиническим исследованиям при применении рацемата).

Для пользования таблицей дозировку необходимо определить клиренс креатинина (КК) пациента в мл/мин. УК (мл/мин) определяют по содержанию креатинина в сыворотке крови (мг/дл) с помощью формулы:

$$[140 - \text{возраст (годы)}] \times \text{масса тела (кг)} (\times 0,85 \text{ для женщин})$$

$$\text{КК} = \text{-----}$$

$$72 \times \text{креатинин сыворотки крови (мг/дл)}$$

Дети

Препарат в виде таблеток не применять детям до 6 лет, поскольку эта лекарственная форма не позволяет проводить необходимую коррекцию режима дозирования. Для этой категории пациентов рекомендуется применение левоцетиризина в лекарственной форме, пригодной для использования в педиатрии.

Передозировка

Симптомы передозировки: может иметь признаки интоксикации в виде сонливости; у детей передозировка может сопровождаться беспокойством и повышенной раздражительностью.

Лечение: при появлении симптомов передозировки (особенно у детей) прием препарата необходимо прекратить; проводят промывание желудка, применяют активированный уголь; терапия симптоматическая. Специфического антидота нет, гемодиализ не эффективен.

Побочные реакции

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 органа 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, ангионевротический отек.

Со стороны дыхательной системы: одышка.

Со стороны пищеварительной системы: 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.

Результаты исследований: увеличение массы тела, отклонения функции печени от нормы.

Нарушение питания и обмена веществ: повышенный аппетит.

Общие нарушения: отек.

Срок годности

3 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 3 блистера в картонной коробке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

Гетеро Лабз Лимитед.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Юнит III, Формулейшн Плот № 22 - 110 Ида, Джидиметла, Хайдерабад, 500055
Телангана, Индия

Источник инструкции

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