

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Алерсэт-Л

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Алерсэт-Л

Международное непатентованное или группировочное наименование: левоцетиризин

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Состав

Одна таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

действующее вещество: левоцетиризина дигидрохлорид 5 мг;

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат 83 мг, лактоза безводная 23 мг, крахмал прежелатинизированный 15,5 мг, магния стеарат 3 мг;

состав оболочки: инстакоат (IC-S-344) 1 мг [гипромеллоза 48 %, диэтилфталат 12 %, этилцеллюлоза 40 %], гипромеллоза Е15 3,11 мг, титана диоксид (Е171) 0,8 мг, макрогол 400 0,64 мг, краситель железа оксид красный (Е172) 0,1 мг, тальк 0,8 мг.

Описание

Таблетки продолговатой формы, покрытые пленочной оболочкой светло-розового цвета, с риской на одной стороне. Вид таблетки на поперечном разрезе: оболочка – светло-розового цвета, ядро – белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Антигистаминные средства системного действия; производные пиперазина.

Код АТХ: R06AE09

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Левоцетиризин – R-энантиомер цетиризина; мощный и селективный антагонист гистамина, блокирующий H₁-гистаминовые рецепторы.

Левоцетиризин оказывает влияние на гистаминозависимую стадию аллергических реакций, а также уменьшает миграцию эозинофилов, уменьшает проницаемость сосудов, ограничивает высвобождение медиаторов воспаления.

Левоцетиризин предупреждает развитие и облегчает течение аллергических реакций, обладает противоэкссудативным, противозудным действием, практически не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия. В терапевтических дозах практически не оказывает седативного эффекта.

Фармакокинетика

Фармакокинетические параметры левоцетиризина изменяются линейно.

Абсорбция

После приема внутрь левоцетиризин быстро и полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта. Одновременный прием пищи не оказывает влияния на полноту всасывания,

но снижает ее скорость. Максимальная концентрация в плазме крови ($C_{\max}$) достигается через 0,9 ч и составляет 270 нг/мл, равновесная концентрация достигается через 2 суток.

Распределение

Левосетиризин на 90 % связывается с белками плазмы крови. Объем распределения составляет 0,4 л/кг. Биодоступность достигает 100 %.

Биотрансформация

В небольших количествах (менее 14 %) метаболизируется в организме путем N- и O-деалкилирования (в отличие от других антагонистов H_1 -гистаминовых рецепторов, которые метаболизируются в печени с помощью системы цитохромов) с образованием фармакологически неактивного метаболита. Из-за незначительного метаболизма и отсутствия метаболического потенциала взаимодействие левосетиризина с другими лекарственными препаратами представляется маловероятным.

Элиминация

Период полувыведения ($T_{1/2}$) у взрослых составляет $7,9 \pm 1,9$ ч. У детей младшего возраста $T_{1/2}$ короче. У взрослых общий клиренс составляет 0,63 мл/мин/кг.

Около 85,4 % принятой дозы препарата выводится почками в неизмененном виде путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции; около 12,9 % – через кишечник.

Отдельные группы пациентов

Пациенты с нарушением функции почек

Кажущийся общий клиренс левосетиризина коррелирует с клиренсом креатинина. Поэтому у пациентов с почечной недостаточностью средней и тяжелой степени тяжести режим дозирования препарата следует корректировать (см. подраздел «Пациенты с почечной недостаточностью» раздела «Способ применения и дозы»).

У пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности общий клиренс снижается на 80 % относительно здоровых добровольцев с нормальной функцией почек. Менее 10 % левосетиризина удаляется в ходе стандартной 4-часовой процедуры гемодиализа.

Пациенты с нарушением функции печени

Фармакокинетика левосетиризина у пациентов с печеночной недостаточностью не изучалась. У пациентов с хроническими заболеваниями печени (гепатоцеллюлярный, холестатический и билиарный цирроз), получавших рацемическое соединение цетиризина в дозе 10 или 20 мг однократно, наблюдалось увеличение $T_{1/2}$ на 50 % и снижение клиренса препарата на 40 %, по сравнению со здоровыми добровольцами.

Дети

Данные по исследованию фармакокинетики препарата у 14 детей в возрасте от 6 до 11 лет с массой тела от 20 до 40 кг при приеме внутрь однократно 5 мг левосетиризина показали, что показатели $C_{\max}$ и площадь под фармакокинетической кривой «концентрация – время» (AUC) примерно в 2 раза превышают аналогичные показатели у взрослых здоровых добровольцев при перекрестном контроле. Средний показатель $C_{\max}$ составил 450 нг/мл, максимальная концентрация достигалась в среднем через 1,2 ч, общий клиренс с учетом массы тела был на 30 % выше, а $T_{1/2}$ на 24 % короче у детей, чем соответствующие показатели у взрослых.

Специальные фармакокинетические исследования у детей младше 6 лет не проводились.

Ретроспективный фармакокинетический анализ проведен у 323 пациентов (181 ребенок в возрасте от 1 до 5 лет, 18 детей в возрасте от 6 до 11 лет и 124 взрослых в возрасте от 18 до 55 лет), получавших одну или несколько доз левосетиризина от 1,25 мг до 30 мг. Данные, полученные в ходе анализа, показали, что прием препарата в дозе 1,25 мг у детей в возрасте от 6 месяцев до 5 лет приводит к концентрации в плазме крови, соответствующей таковой у взрослых при применении 5 мг препарата один раз в сутки.

Пожилые пациенты

Данные по фармакокинетике у пожилых пациентов ограничены. При повторном приеме 30 мг левоцетиризина один раз в сутки в течение 6 дней у 9 пожилых пациентов (возраст от 65 до 74 лет) общий клиренс был приблизительно на 33 % ниже, чем таковой у взрослых более молодого возраста. Было показано, что распределение рацемата цетиризина больше зависит от функции почек, чем от возраста. Это утверждение также может быть применимо и к левоцетиризину, так как оба препарата – и левоцетиризин, и цетиризин выводятся преимущественно почками. Поэтому у пожилых пациентов доза левоцетиризина должна быть скорректирована зависимости от функции почек.

Показания к применению

- Лечение симптомов аллергических ринитов (включая круглогодичный (персистирующий) и сезонный (интермиттирующий) аллергические риниты) и аллергического конъюнктивита, таких как зуд, чихание, заложенность носа, ринорея, слезотечение, гиперемия конъюнктивы.
- Поллиноз (сенная лихорадка).
- Крапивница.
- Другие аллергические дерматозы, сопровождающиеся зудом и высыпаниями.

Противопоказания

- Гиперчувствительность к левоцетиризину, цетиризину, гидроксизину, любому производному пиперазина или к любому из вспомогательных веществ препарата.
- Дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.
- Терминальная стадия почечной недостаточности (скорость клубочковой фильтрации <15 мл/мин).
- Детский возраст до 6 лет.

С осторожностью

Хроническая почечная недостаточность (требуется коррекция режима дозирования); применение у пациентов пожилого возраста (возможно снижение скорости клубочковой фильтрации); применение у пациентов с повреждением спинного мозга, гиперплазией предстательной железы, а также при наличии других предрасполагающих факторов к задержке мочи, поскольку левоцетиризин может увеличивать риск задержки мочи; при одновременном употреблении алкоголя (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»); беременность, период грудного вскармливания.

Осторожность следует соблюдать при применении у пациентов с эпилепсией и повышенной судорожной готовностью, поскольку левоцетиризин может вызвать обострение приступов.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Данные по применению левоцетиризина во время беременности практически отсутствуют или ограничены (менее 300 исходов беременности). Однако, применение цетиризина, рацемата левоцетиризина, при беременности (более 1000 исходов беременности) не сопровождалось пороками развития и внутриутробным и неонатальным токсическим воздействием. В исследованиях на животных не выявлено прямого или косвенного неблагоприятного влияния на течение беременности, эмбриональное и фетальное развитие, роды и постнатальное развитие.

При беременности назначение левоцетиризина может быть рассмотрено в случае необходимости.

Период грудного вскармливания

Цетиризин, рацемат левоцетиризина, выделяется с грудным молоком. Поэтому также вероятно и выделение левоцетиризина с грудным молоком. У детей, находящихся на грудном вскармливании, возможно появление нежелательных реакций на левоцетиризин. Поэтому необходимо соблюдать осторожность при применении левоцетиризина в период грудного вскармливания.

Фертильность

Клинические данные по левоцетиризину отсутствуют.

Перед применением препарата, если Вы беременны или предполагаете, что Вы могли бы быть беременной, или планируете беременность, необходимо проконсультироваться с врачом.

Способ применения и дозы

Режим дозирования

Взрослые

Суточная доза составляет 5 мг (1 таблетка) однократно.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Коррекция дозы препарата у пациентов пожилого возраста при условии нормальной функции почек не требуется.

Пациенты с почечной недостаточностью

Пациентам с почечной недостаточностью режим дозирования препарата следует корректировать в зависимости от функции почек (скорость клубочковой фильтрации [СКФ]).

Дозирование у пациентов с почечной недостаточностью:

Почечная недостаточность	СКФ (мл/мин)	Режим дозирования
Норма	≥90	5 мг 1 раз в день
Легкая	60–89	5 мг 1 раз в день
Средняя	30–59	5 мг через 2 дня
Тяжелая	15–29 (не требующие диализа)	5 мг через 3 дня
Терминальная стадия – пациенты, находящиеся на диализе	<15	прием препарата противопоказан

Пациенты с нарушением функции печени

У пациентов с нарушением только функции печени коррекции режима дозирования не требуется.

У пациентов с *нарушением и функции печени, и функции почек*, рекомендуется коррекция дозирования (см. таблицу выше).

Продолжительность приема препарата

При лечении сезонного (интермиттирующего) аллергического ринита (наличие симптомов менее 4 дней в неделю или их общая продолжительность менее 4 недель) продолжительность лечения зависит от длительности симптоматики; лечение может быть прекращено исчезновении симптомов и возобновлено при появлении симптомов.

При лечении круглогодичного (персистирующего) аллергического ринита (наличие симптомов более 4 дней в неделю и их общая продолжительность более 4 недель) лечение может продолжаться в течение всего периода воздействия аллергенов.

Имеется клинический опыт непрерывного применения левоцетиризина в лекарственной форме таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 5 мг, у взрослых пациентов длительностью до 6 месяцев.

Пропуск приема препарата

Если Вы забыли принять препарат Алерсэт-Л, не принимайте двойную дозу для компенсации пропущенной, примите следующую дозу в обычное время.

Дети

Дети от 0 до 6 лет

Препарат Алерсэт-Л не следует назначать детям в возрасте от 0 до 6 лет, для данной лекарственной формы, в связи с невозможностью обеспечить режим дозирования.

Дети старше 6 лет

Режим дозирования для детей от 6 лет не отличается от режима дозирования для взрослых.

Способ применения

Препарат принимают внутрь, проглатывая целиком, во время еды или натощак, запивая небольшим количеством воды.

Если Вы принимаете или недавно принимали другие препараты, сообщите об этом лечащему врачу.

Если после лечения улучшение не наступает, или появляются новые симптомы, необходимо проконсультироваться с врачом.

Применяйте препарат только согласно тому способу применения и в тех дозах, которые указаны в инструкции.

Побочное действие

Нежелательные реакции представлены по системно-органным классам в соответствии со словарем нормативно-правовой деятельности (MedDRA) и со следующей частотой: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $<1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, но $<1/100$), редко ($\geq 1/10\,000$, но $<1/1000$), очень редко ($<1/10\,000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Данные по безопасности, полученные при изучении цетиризина

Наблюдались следующие нежелательные реакции:

Редко ($\geq 1/10\,000$, но $<1/1000$)

Встречались легкие и временные нежелательные реакции: повышенная утомляемость, нарушение концентрации, сонливость, головная боль, головокружение, возбудимость, сухость во рту и нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта (запор). В некоторых случаях наблюдались реакции гиперчувствительности и ангионевротический отек.

Также сообщалось об отдельных случаях судорог, реакции фоточувствительности, поражении печени, анафилактического шока, нарушения кровообращения, глухоты, плохого самочувствия, кожного зуда, васкулита, зрительных нарушениях и кошмарных сновидениях.

Клинические исследования левоцетиризина

Клинические исследования показали, что у 14,7 % пациентов, принимавших левоцетиризин в дозе 5 мг, наблюдались нежелательные реакции в сравнении с 11,3 % у пациентов группы плацебо. 95 % данных нежелательных реакций были легкими и умеренно выраженными.

В клинических исследованиях частота прекращения терапии вследствие развития нежелательных реакций составила 0,7 % (4/538) у пациентов, рандомизированных для

получения левоцетиризина в дозе 5 мг, и 0,8 % (3/382) для пациентов, рандомизированных в группу плацебо.

Следующие нежелательные реакции были выявлены у пациентов (n = 538), участвовавших в клиническом исследовании и применявших левоцетиризин в рекомендованных дозах (5 мг 1 раз в сутки):

С частотой 1–10 %

Нежелательные реакции	Левоцетиризин 5 мг (n = 538)	Плацебо (n = 382)
Сонливость	5,6 %	1,3 %
Сухость во рту	2,6 %	1,3 %
Головная боль	2,4 %	2,9 %
Утомляемость	1,5 %	0,5 %
Астения	1,1 %	1,3 %

Хотя частота случаев сонливости в группе левоцетиризина была выше, чем таковая в группе плацебо, в большинстве случаев эта нежелательная реакция была легкой или умеренной степени тяжести.

Нечасто (0,1–1 %): боли в животе.

Пострегистрационные исследования

В период пострегистрационного применения препарата наблюдались следующие побочные эффекты:

Частота побочных эффектов неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Нарушения со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности, в том числе анафилактические реакции.

Нарушения метаболизма и питания: повышение аппетита.

Психические нарушения: тревога, агрессия, возбуждение, бессонница, галлюцинации, депрессия, суицидальные мысли, кошмарные сновидения.

Нарушения со стороны нервной системы: судороги, тромбоз синусов твердой мозговой оболочки, парестезия, головокружение, обморок, тремор, дисгевзия.

Нарушения со стороны органа зрения: нарушение зрения, нечеткость зрительного восприятия, воспалительные проявления, непроизвольные движения глазных яблок (нистагм).

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта: вертиго.

Нарушения со стороны сердца: тахикардия, стенокардия, ощущение сердцебиения.

Нарушения со стороны сосудов: тромбоз яремной вены.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: одышка, усиление симптомов ринита.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, рвота.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: гепатит.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: ангионевротический отек, экзантема, гипотрихоз, зуд, сыпь, трещины, крапивница, фотосенсибилизация/токсичность, стойкая лекарственная эритема.

Нарушения со стороны мышечной, костной и соединительной ткани: боль в мышцах, артралгия.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: дизурия, задержка мочи.

Общие нарушения и реакции в месте введения: неэффективность препарата и его взаимодействия, сухость слизистых оболочек, отек.

Лабораторные и инструментальные данные: увеличение массы тела, изменение функциональных проб печени, перекрестная реактивность.

Описание отдельных нежелательных реакций

У малого количества пациентов наблюдался зуд после прекращения применения левоцетиризина.

Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются, или Вы заметили любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, **сообщите об этом врачу.**

Передозировка

Симптомы: сонливость (у взрослых), вначале могут появиться возбуждение и беспокойство, затем сменяющиеся сонливостью (у детей).

Лечение: необходимо промыть желудок или принять активированный уголь, если после приема препарата прошло мало времени. Рекомендуются проведение симптоматической и поддерживающей терапии. Специфического антидота нет. Гемодиализ неэффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Изучение взаимодействия левоцетиризина с другими лекарственными средствами не проводилось.

При изучении лекарственного взаимодействия рацемата цетиризина с *антипирином, азитромицином, циметидином, диазепамом, эритромицином, глипизидом, кетоконазолом и псевдоэфедрином* клинически значимых нежелательных взаимодействий не выявлено.

При одновременном применении с *теофиллином* (400 мг/сутки) общий клиренс цетиризина снижается на 16 %, при этом фармакокинетика теофиллина не изменяется.

В исследовании при одновременном приеме *ритонавира* (600 мг 2 раза в сутки) и цетиризина (10 мг в сутки) показано, что экспозиция цетиризина увеличивалась на 40 %, а экспозиция ритонавира незначительно изменялась (-11%).

У чувствительных пациентов одновременный прием левоцетиризина и этанола или лекарственных средств, оказывающих подавляющее влияние на центральную нервную систему, может вызвать заторможенность и снижение работоспособности.

Особые указания

Интервалы между приемами доз препарата Алерсэт-Л должны быть подобраны индивидуально в зависимости от почечной функции.

Рекомендуется соблюдать осторожность при одновременном применении препарата Алерсэт-Л и употреблении алкоголя (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»).

При наличии у пациентов предполагающих факторов к задержке мочи (например, повреждение спинного мозга, гиперплазия предстательной железы) следует соблюдать осторожность, поскольку левоцетиризин может увеличить риск задержки мочи.

Осторожность следует соблюдать при применении препарата у пациентов с эпилепсией и повышенной судорожной готовностью, поскольку препарат Алерсэт-Л может вызвать обострение приступов.

Реакция на кожные аллергические пробы подавляется антигистаминными препаратами, и

перед проведением тестирования необходимо воздержаться от применения препарата Алерсэт-Л в течение 3 дней.

Возможно появление кожного зуда после прекращения применения Алерсэт-Л, даже если подобных симптомов не было в начале терапии. Симптомы могут пройти самостоятельно. В некоторых случаях симптомы могут быть сильно выражены, и это может потребовать возобновления терапии. После возобновления терапии эти симптомы должны пройти.

Дети

Левосетиризин в таблетках, покрытых пленочной оболочкой, противопоказан у детей в возрасте до 6 лет, поскольку данная лекарственная форма не позволяет применять подходящую дозировку для этой возрастной группы. Рекомендуется применять педиатрическую лекарственную форму (капли для приема внутрь).

Вспомогательные вещества

Препарат Алерсэт-Л содержит лактозу (лактозы моногидрат и лактозу безводную). Данный лекарственный препарат не следует принимать пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, лактазной недостаточностью или глюкозо-галактозной мальабсорбцией.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Применение препарата Алерсэт-Л может привести к повышенной сонливости, следовательно, применение препарата Алерсэт-Л может оказывать влияние на способность управлять транспортными средствами или работать с механизмами. В период лечения следует воздержаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 5 мг.

По 10 таблеток в блистер из ПВХ пленки и алюминиевой фольги.

По 1, 2, 10 блистеров вместе с инструкцией по применению помещают в картонную пачку.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять после истечения срока годности.

Условия отпуска

Отпускают без рецепта.

Держатель регистрационного удостоверения / Производитель

Микро Лабс Лимитед

Юридический адрес: 31, Рейс Корс Роуд, Бангалор – 560 001, Карнатака, Индия

Тел.: +91-80-22370451-57

Факс: +91-80-22370463

Электронная почта: info@microlabs.in

Адрес места производства: 92, Промышленный комплекс Сипкот, Хосур – 635 126 (Т.Н.), Индия

Организация, принимающая претензии потребителей

Представительство компании «Микро Лабс Лимитед»

117198, г. Москва, ул. Ленинский проспект, д. 113/1, офис 314 Е

Тел./факс: +7 (495) 937 27 70/71

Электронная почта: info@microgroup.ru