ЛП-003730-110719

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ЛАЗИН®5,0

РЕГИСТРАЦИОННЫЙ НОМЕР:

ТОРГОВОЕ НАИМЕНОВАНИЕ: Лазин®5,0.

МЕЖДУНАРОДНОЕ НЕПАТЕНТОВАННОЕ ИЛИ ГРУППИРОВОЧНОЕ НАИМЕНОВАНИЕ: левоцетиризин.

ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА: таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

СОСТАВ:

Одна таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

Действующее вещество: левоцетиризина дигидрохлорид – 5,000 мг;

вспомогательные вещества: внутренний слой: целлюлоза микрокристаллическая – 25,800 мг, лактозы моногидрат (в том числе Фарматоза 200М – 10,000 мг, Флоулак-100 – 55,950 мг) – 65,950 мг, кремния диоксид коллоидный – 1,250 мг; *внешний слой:* кремния диоксид коллоидный – 1,250 мг; магния стеарат – 1,750 мг;

пленочная оболочка: Опадрай белый YS-1-7003 – 2,525 мг (гидроксипропилметилцеллюлоза 2910 (Е 464) – 59,75%; титана диоксид (Е 171) – 31,25%; макрогол 400 (Е1521) – 8,0%;, полисорбат-80 (Е433) – 1,0%).

ОПИСАНИЕ

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, с риской и гравировкой «Н» под риской на одной стороне и гравировкой «161» на другой стороне. На поперечном разрезе: ядро от белого до почти белого цвета.

ФАРМАКОТЕРАПЕВТИЧЕСКАЯ ГРУППА: противоаллергическое средство. H_1-гистаминовых рецепторов блокатор.

Код АТХ: R06AE09.

117150

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика

Левоцетиризин - активное вещество препарата Лазин®5,0 — это R-энантиомер цетиризина, который относится к группе конкурентных антагонистов гистамина и блокирует Н1 гистаминовые рецепторы.

Левоцетиризин оказывает влияние на гистамин зависимую 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.

Всасывание

После приема внутрь препарат быстро и полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта. Прием пищи не влияет на полноту всасывания, хотя снижает ее скорость. Максимальная концентрация (Cmax) в плазме крови достигается через 0,9 час и составляет 270 нг/мл, равновесная концентрация достигается через 2 суток.

Распределение

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

Метаболизм

В небольших количествах (<14%) метаболизируется в организме путем N- и O-деалкилирования (в отличие от других антагонистов Н1-гистаминовых рецепторов, которые метаболизируются в печени с помощью системы цитохромов) с образованием фармакологически неактивного метаболита. Из-за незначительного метаболизма и отсутствия метаболического потенциала взаимодействие левоцетиризина с другими лекарственными препаратами представляется маловероятным.

Выведение

Период полувыведения (T1/2) у взрослых составляет 7,9 ±1,9 час. У детей младшего возраста период полувыведения короче. У взрослых общий клиренс составляет 0,63 мл/мин/кг. Около 85,4% принятой дозы препарата выводится почками в неизменном виде путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции; около 12,9% - через кишечник.

117150

Отдельные группы пациентов

Пациенты с почечной недостаточностью

У пациентов с почечной недостаточностью (клиренс креатинина (КК) < 40 мл/мин) клиренс препарата уменьшается. У пациентов, находящихся на гемодиализе, общий клиренс снижается на 80. Менее 10% препарата удаляется в ходе стандартной 4-часовой процедуры гемодиализа.

Пациенты с печеночной недостаточностью

Фармакокинетика у пациентов с печеночной недостаточностью не изучалась. У пациентов с хроническими заболеваниями печени (гепатоцеллюлярный, холестатический и биллиарный цирроз). Получавших рацемическое соединение цетиризина в дозе 10 или 20 мг однократно, наблюдалось увеличение периода полувыведения на 50 % и снижение клиренса препарата на 40 %, по сравнению со здоровыми людьми.

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 пероральном приеме однократно 5 мг левоцетиризина показали, что показатели C_{max} и площадь под кривой (AUC) примерно в два раза превышают аналогичные показатели у взрослых здоровых людей при перекрестном контроле. Средний показатель C_{max} составил 450 нг/мл, максимальная концентрация достигалась в среднем через 1,2 часа, общий клиренс с учетом массы тела был на 30 % выше, а период полувыведения 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 левоцетиризина 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, соответствующей таковой у взрослых при приеме 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 применено к левоцетиризина, так как оба препарата и левоцетиризин, и

117150

цетиризин выводятся преимущественно с мочой. Поэтому, у пожилых пациентов доза левоцетиризина должна быть скорректирована в зависимости от функции почек.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

- Лечение симптомов круглогодичного (персистирующего) и сезонного (интермиттирующего) аллергических ринитов 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

Повышенная чувствительность к активному веществу, цетиризину, гидроксизину, любому производному пиперазина или к любому другому вспомогательному веществу препарата. Дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция. терминальная стадия почечной недостаточности (клиренс креатинина <10 мл/мин). детский возраст до 6 лет.

С ОСТОРОЖНОСТЬЮ

При хронической почечной недостаточности (необходима коррекция режима дозирования).

Беременность и период грудного вскармливания.

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

У пациентов пожилого возраста (при возрастном снижении клубочковой фильтрации).

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 с алкоголем *(см. Взаимодействие с другими лекарственными средствами).*

ПРИМЕНЕНИЕ ПРИ БЕРЕМЕННОСТИ И В ПЕРИОД ГРУДНОГО ВСКАРМЛИВАНИЯ

Беременность

117150

Данные по применению левоцетиризина во время беременности практически отсутствуют или ограничены (менее 300 исходов беременностей). Однако, применение цетиризина, рацемата левоцетиризина, при беременности (более 1000 исходов беременностей) 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, экскретируется с грудным молоком. Поэтому также вероятно и выделение левоцетиризина с грудным молоком. У детей, находящихся на грудном вскармливании, возможно появление побочных реакций на левоцетиризин. Поэтому необходимо соблюдать осторожность при назначении левоцетиризина в период грудного вскармливания.

Фертильность

Клинические данные по левоцетиризину отсутствуют.

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

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

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

Взрослые и дети старше 6 лет: суточная доза составляет 5 мг (1 таблетка) однократно. Основным путем выведения левоцетиризина из организма является выведение почками, поэтому при применении препарата у пациентов пожилого возраста и с почечной недостаточностью доза должна корректироваться в зависимости от степени почечной недостаточности, основываясь на оценке клиренса креатинина (мл/мин).

Пациентам *с легким нарушением функции почек* (клиренс креатинина 50-79 мл/мин) коррекции дозы не требуется.

У пациентов *с умеренной почечной недостаточностью* (клиренс креатинина от 30 до 49 мл/мин) рекомендуемая доза 5 мг через день.

У пациентов *с тяжелой почечной недостаточностью* (клиренс креатинина менее 30 мл/мин) рекомендуемая доза 5 мг 1 раз в 3 дня.

117150

Пациентам *с почечной и печеночной недостаточностью* дозирование осуществляется по вышеприведенной схеме.

Пациентам *с нарушением только функции печени* коррекции режима дозирования не требуется.

Продолжительность приема препарата:

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

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

Имеется клинический опыт непрерывного применения левоцетиризина у взрослых пациентов длительностью до 6 месяцев.

Если вы принимаете (или недавно принимали) другие препараты, включая безрецептурные, сообщите об этом лечащему врачу.

Если Вы забыли принять левоцетиризин, не принимайте двойную дозу для компенсации пропущенной, примите следующую дозу в обычное время.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Данные по безопасности, полученные при изучении цетиризина

Наблюдались следующие нежелательные реакции: *редко (≥1/10000, <1/1000),* встречались легкие и временные нежелательные явления такие как утомляемость, нарушение концентрации, сонливость, головная боль, головокружение, возбуждение, сухость во рту и желудочно-кишечные расстройства (запор). В некоторых случаях наблюдались реакции гиперчувствительности и ангионевротический отек. Также сообщалось об отдельных случаях судорог, реакции светочувствительности, поражении печени, анафилактического шока, нарушения кровообращения, глухоты, плохого самочувствия, зуда, васкулита, зрительных нарушений и кошмарных сновидениях.

Данные клинических исследований

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 или умеренно выраженными. В клинических исследованиях частота прекращения терапии вследствие развития побочных реакций составила 0,7 % (4/538) у пациентов,

117150

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

Следующие нежелательные реакции были выявлены у пациентов (n=538) участвовавших в клиническом исследовании и применявших левоцетиризин в рекомендованных дозах (5 мг один 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 это нежелательное явления было легкой или умеренной степени тяжести.

Нечасто (0,1-1%): Боли в животе.

Пострегистрационные исследования

В период пострегистрационного применения препарата наблюдались следующие побочные эффекты:

Со стороны иммунной системы

Реакция гиперчувствительности, включая анафилаксию.

Со стороны обмена веществ и расстройств питания

Повышение аппетита.

Со стороны психики

Тревога, агрессия, возбуждение, галлюцинации, депрессия, бессонница, суицидальные идеи, кошмарные сновидения.

Со стороны нервной системы

Судороги, тромбоз синусов твердой мозговой оболочки, парестезия, головокружение, вертиго, обморок, тремор, дисгевзия.

Со стороны органа зрения

Воспалительные проявления, нарушение зрения, нечеткость зрительного восприятия, непроизвольные движения глазных яблок (нистагм).

Со стороны сердца

Стенокардия, тахикардия, ощущение сердцебиения.

Со стороны сосудов

Тромбоз яремной вены.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Усиление симптомов ринита, одышка.

Со стороны кожи и подкожных тканей

Ангионевротический отек, экзантема, гипотрихоз, зуд, сыпь, трещины, крапивница, фотосенсибилизация/токсичность, стойкая лекарственная эритема.

Общие расстройства

Неэффективность продукта и его взаимодействия, сухость слизистых оболочек.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Тошнота, рвота.

Со стороны печени и желчевыводящих путей

Гепатит.

Со стороны скелетно-мышечной, костной системы и соединительной ткани

Боль в мышцах, артралгия

Со стороны почек и мочевыводящих путей

Дизурия, задержка мочи.

Общие расстройства и нарушения в месте введения

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 у Вас отмечаются любые побочные эффекты, указанные в инструкции, или они усугубляются, или Вы заметили любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Симптомы передозировки у взрослых – возбуждение, беспокойство, сонливость; у детей – возбуждение, беспокойство, которые сменяются сонливостью.

117150

***Лечение*:** необходимо промыть желудок или принять активированный уголь, если после приема препарата прошло мало времени. Специфического антидота нет. Рекомендуется симптоматическая и поддерживающая терапия. Гемодиализ неэффективен.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Изучение взаимодействия левоцетиризина с другими лекарственными препаратами не проводилось. При изучении лекарственного взаимодействия рацемата цетиризина с феназоном, псевдоэфедрином, циметидином, кетоконазолом, эритромицином, азитромицином, глипизидом и диазепамом клинически значимых нежелательных взаимодействий не выявлено.

При одновременном применении с теофиллином (400 мг/сут) общий клиренс цетиризина снижается на 16% (кинетика теофиллина не меняется).

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

У чувствительных пациентов одновременный прием левоцетиризина и алкоголя или лекарственных препаратов, оказывающих подавляющее влияние на центральную нервную систему (ЦНС), может вызвать заторможенность и ухудшение работоспособности.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Интервалы между дозами должны быть подобраны индивидуально в зависимости от почечной функции.

Рекомендуется соблюдать осторожность при одновременном употреблении с алкоголем.

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

Осторожность следует соблюдать у пациентов с эпилепсией и повышенной судорожной готовностью. Поскольку левоцетиризин может вызвать обострение приступов.

Реакция на кожные аллергические пробы подавляется антигистаминными препаратами, и перед проведением тестирования необходимо воздержаться от приема препарата в течение 3 дней.

Возможно появление зуда после прекращения приема левоцетиризина, даже если подобных симптомов не было в начале лечения. Симптомы могут пройти самостоятельно. В некоторых случаях симптомы могут быть сильно выраженными, и это может

117150

потребовать возобновления лечения. После возобновления лечения эти симптомы должны пройти.

Дети

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

ВЛИЯНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА НА СПОСОБНОСТЬ УПРАВЛЯТЬ ТРАНСПОРТНЫМИ СРЕДСТВАМИ, МЕХАНИЗМАМИ

Левоцетиризин может привести к повышенной сонливости, следовательно, данный препарат может оказывать влияние на способность управлять автомобилем или работать с техникой. В период лечения необходимо воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

ФОРМА ВЫПУСКА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 5 мг.

При производстве на Хетеро Лабс Лимитед:

По 10 таблеток в блистер из фольги алюминиевой.

По 1, 2 или 3 блистера с инструкцией по применению в пачке из картона.

При расфасовке и/или упаковке на ООО «МАКИЗ-ФАРМА»:

По 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке из пленки ПВХ и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 1, 2 или 3 контурных ячейковых упаковки или блистера с инструкцией по применению в пачке из картона.

СРОК ГОДНОСТИ

3 года.

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

117150

УСЛОВИЯ ОТПУСКА

Отпускают без рецепта.

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ/ ФАСОВЩИК/ УПАКОВЩИК

Хетеро Лабс Лимитед, Индия

Юнит III, 22-110, I.D.A., Джидиметла, Хайдарабад-500055, Телангана, Индия.

ФАСОВЩИК/ УПАКОВЩИК

ООО «МАКИЗ-ФАРМА», Россия

109029, г. Москва, Автомобильный проезд, д. 6, стр. 5

Адрес места производства:

109029, г. Москва, Автомобильный проезд, д. 6, стр. 4, стр. 6, стр. 8

НАИМЕНОВАНИЕ И АДРЕС ЮРИДИЧЕСКОГО ЛИЦА, НА ИМЯ КОТОРОГО ВЫДАНО РЕГИСТРАЦИОННОЕ УДОСТОВЕРЕНИЕ:

Хетеро Лабс Лимитед, Индия

«Хетеро Корпорейт», 7-2-А2, Индастриал Эстейтс, Санат Нагар, Хайдарабад-500 018, Телангана, Индия.

ОРГАНИЗАЦИЯ, ПРИНИМАЮЩАЯ ПРЕТЕНЗИИ:

Московское представительство Компании «Хетеро Лабс Лимитед» (Индия)

109029, г. Москва, Автомобильный проезд, д. 6 стр. 5

Тел/факс: (495) 981-00-88

e-mail: DrugSafety-Russia@heterodrugs.com

Глава представительства Компании Равикумар Сваминатхан

HETERO LABS LTD Hyd-18.

МЗ РФ ФГБУ НЦЭСМП ЭКСПЕРТНЫЙ ОТЧЕТ ДЕЙСТВИТЕЛЕН ДЛЯ ДАННОЙ ВЕРСИИ ДОКУМЕНТА 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 1 5