МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП 002059-291214
СОГЛАСОВАНО

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Эльцет
таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 5 мг

ЗАО «Фармацевтическое предприятие «Оболенское», Россия

Изменение № 1

Дата внесения Изменения «__» 291214 20___ г.

Старая редакция	Новая редакция
Фармакологические свойства *Фармакодинамика* Левоцетиризин - R-энантиомер цетиризина, конкурентный антагонист гистамина, который блокирует H_1-гистаминовые рецепторы, сродство к которым у него в 2 раза выше, чем у цетиризина. Оказывает влияние на гистаминозависимую стадию аллергических реакций, уменьшает миграцию эозинофилов, сосудистую проницаемость, ограничивает высвобождение медиаторов воспаления и цитокинов. Предупреждает развитие и облегчает проявление аллергических реакций, обладает противоэкссудативным,	**Фармакологические свойства** *Фармакодинамика.* Левоцетиризин – активное вещество препарата Эльцет – это R-энантиомер цетиризина, который относится к группе конкурентных антагонистов гистамина и блокирует H_1-гистаминовые рецепторы. Левоцетиризин оказывает влияние на гистаминозависимую стадию аллергических реакций, а так же уменьшает миграцию эозинофилов, уменьшает проницаемость сосудов, ограничивает высвобождение медиаторов воспаления. Левоцетиризин предупреждает развитие и облегчает течение аллергических реакций, обладает

противозудным действием. Практически отсутствует антихолинергическое и антисеротониновое действие. В терапевтических дозах практически не оказывает седативного действия. *Фармакокинетика* Фармакокинетические параметры левоцетиризина изменяются линейно. Всасывание. Левоцетиризин быстро и полностью всасывается при приеме внутрь, абсорбируясь из желудочно-кишечного тракта. Прием пищи не оказывает влияния на полноту всасывания, но скорость абсорбции уменьшается. Время достижения максимальной концентрации в плазме крови (TC_{max}) после однократного приема препарата в разовой терапевтической дозе (5 мг) составляет 0,9 ч, C_{max} - 207 нг/мл. После повторного приема препарата в дозе 5 мг C_{max} составляет 308 нг/мл. Распределение. Биодоступность достигает 100%. Объем распределения левоцетиризина составляет 0,4 л/кг. Связь с белками плазмы крови на 90%. Метаболизм. Менее 14% препарата метаболизируется путем N- и	противоэкссудативным, противозудным действием, практически не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия. В терапевтических дозах практически не оказывает седативного действия. *Фармакокинетика.* Фармакокинетические параметры левоцетиризина изменяются линейно. Всасывание. После приема внутрь препарат быстро и полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта. Прием пищи не оказывает влияния на полноту всасывания, хотя снижает ее скорость. Максимальная концентрация (C_{max}) в плазме крови достигается через 0,9 часа и составляет 207 нг/мл, равновесная концентрация достигается через 2 суток. После повторного приема препарата в дозе 5 мг C_{max} составляет 308 нг/мл. Распределение. Левоцетиризин на 90% связывается с белками плазмы (Vd) крови. Объем распределения составляет 0,4 л/кг. Биодоступность достигает 100%. Метаболизм. Менее 14% препарата метаболизируется в печени с

О-дезалкилирования с образованием фармакологически неактивного метаболита. Из-за низкого уровня метаболизма и отсутствия метаболического потенциала взаимодействие левоцетиризина с другими лекарственными препаратами представляется маловероятным. Выведение. Период полувыведения ($T_{½}$) составляет 7,9±1,9 ч, у маленьких детей $T_{½}$ укорочен. Общий клиренс у взрослых составляет 0,63 мл/мин/кг. Почками с мочой в неизменном виде выводится 85,4% принятой дозы препарата. Через кишечник выводится около 12,9% принятой дозы препарата. Препарат не кумулируется. Полностью выводится из организма за 96 ч. При почечной недостаточности (клиренсе креатинина (КК) менее 40 мл/мин) клиренс препарата уменьшается и $T_{1/2}$ удлиняется. Так, у пациентов, находящихся на гемодиализе, общий клиренс снижается на 80%, и менее 10% левоцетиризина удаляется в ходе стандартной 4-часовой процедуры гемодиализа.	образованием фармакологически неактивного метаболита. Выведение. Период полувыведения ($T_{½}$) у взрослых составляет 7,9±1,9 ч. Общий клиренс у взрослых составляет 0,63 мл/мин/кг. Около 85,4% принятой дозы препарата выводится почками, около 12,9% - через кишечник. У пациентов с почечной недостаточностью при клиренсе креатинина (КК) менее 40 мл/мин клиренс препарата уменьшается. У пациентов, находящихся на гемодиализе, общий клиренс снижается на 80%, что требует изменения соответствующего режима дозирования. Менее 10% препарата удаляется в ходе стандартной 4-часовой процедуры гемодиализа.

С осторожностью Применять с осторожностью при следующих состояниях: - хроническая почечная недостаточность (при КК более 10 мл/мин и менее 50 мл/мин требуется коррекция режима дозирования); - пожилой возраст (возможно снижение клубочковой фильтрации); - при одновременном применении с алкоголем.	**С осторожностью** Применять с осторожностью при следующих состояниях: - хроническая почечная недостаточность (при КК более 10 мл/мин и менее 50 мл/мин требуется коррекция режима дозирования); - пожилой возраст (возможно снижение 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 применении с алкоголем.
Способ применения и дозы Внутрь, во время еды или натощак, не разжевывая, запивая небольшим количеством воды. *Взрослые и дети старше 6 лет:* рекомендуемая суточная доза -5 мг (1 таблетка). *Пациенты пожилого возраста:* при условии нормальной функции почек снижение суточной дозы не требуется. *Пациенты с почечной*	**Способ применения и дозы** 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. Поскольку левоцетиризин выводится из организма почками, при применении препарата у *пациентов с почечной недостаточностью и*

недостаточностью и пациентам пожилого возраста: дозу следует корректировать в зависимости от величины клиренса креатинина (КК).

Клиренс креатинина для мужчин можно рассчитывать, исходя из концентрации сывороточного креатинина, по следующей формуле:

$$КК(мл/мин) = \frac{[140 - возраст\ (годы)] \times масса\ тела\ (кг)}{72 \times КК(сыворот)\ (мг/дл)}$$

Клиренс креатинина для женщин можно рассчитать, умножив полученное значение на коэффициент 0,85.

Пациенты с почечной и печеночной недостаточностью: дозу следует рассчитывать по таблице, приведенной ниже.

Почечная недостаточность	**КК (мл/мин)**	**Режим дозирования**
Норма	>80	5 мг/сут
Легкая	50-79	5 мг/сут
Средняя	30-49	5 мг/сут ×1 раз в 2 дня
Тяжелая	<30	5 мг/сут ×1 раз в 3 дня
Терминальная стадия-	<10	Прием препарата

пациентов пожилого возраста дозу следует корректировать в зависимости от степени почечной недостаточности.

Пациентам *с легким нарушением функции почек* (клиренс креатинина 50-79 мл/мин) коррекция 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.

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

пациенты, находящиеся на гемодиализе		противопоказан

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

Длительность курса лечения зависит от характера заболевания. Курс лечения при поллинозе в среднем составляет 1-6 недель, при хронических заболеваниях (круглогодичный ринит, атопический дерматит) длительность курса лечения может увеличиться.

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 дней в неделю или 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 препарат Эльцет не принимайте двойную дозу для компенсации пропущенной, примите следующую дозу в обычное время.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами При одновременном применении с теофиллином (400 мг/сут) общий клиренс рацемического цетиризина снижается на 16%, при этом кинетика теофиллина не меняется. В ряде случаев при одновременном применении левоцетиризина с этанолом или лекарственными препаратами, угнетающими центральную нервную систему, возможно усиление их влияния на центральную нервную систему.	**Взаимодействие с другими лекарственными средствами** Изучение взаимодействия левоцетиризина с другими лекарственными средствами 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 ритановира (600 мг 2 раза в день) и цетиризина (10 мг в день) показано, что экспозиция цетиризина увеличивалась на 40%, а экспозиция ритановира незначительно изменялась (-11%). В ряде случаев при одновременном применении левоцетиризина с алкоголем или лекарственными препаратами, угнетающими центральную нервную систему

	(ЦНС), возможно усиление их влияния на ЦНС, хотя не доказано, что рацемат цетиризина потенцирует эффект алкоголя.
Условия отпуска Отпускается по рецепту.	**Условия отпуска** Без рецепта.

Директор по регистрации **Г.У. Сетдекова**