

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Эльцет®

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Эльцет®

Международное непатентованное или группировочное наименование: левоцетиризин

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав

1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

действующее вещество: левоцетиризина дигидрохлорид – 5 мг;

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, кальция гидрофосфата дигидрат, натрия карбоксиметилкрахмал (натрия крахмала гликолят), повидон, магния стеарат;

вспомогательные вещества для оболочки: гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза), макрогол 6000 (полиэтиленгликоль 6000), титана диоксид.

Описание

Двояковыпуклые таблетки продолговатой формы со скругленными концами, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, с риской. На поперечном разрезе ядро белого или почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Антигистаминные средства системного действия; производные пиперазина.

Код АТХ: R06AE09.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Левоцетиризин – активное вещество препарата Эльцет® – это R-энантиомер цетиризина, мощный и селективный антагонист гистамина, блокирующий H₁-гистаминовые рецепторы. Левоцетиризин оказывает влияние на гистаминазависимую 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 ($C_{\max}$) в плазме крови достигается через 0,9 часа 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 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 левоцетиризина с лекарственными препаратами представляется маловероятным.

Выведение

Период полувыведения ($T_{1/2}$) у взрослых составляет $7,9 \pm 1,9$ 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.

Отдельные группы пациентов

Пациенты с почечной недостаточностью

У пациентов с почечной недостаточностью при клиренсе креатинина менее 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 левоцетиризина 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 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. 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 препарата один раз в сутки.

Пожилые пациенты

Данные по фармакокинетики 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 левоцетирин, и цетирин выводятся преимущественно с мочой. Поэтому у пожилых пациентов доза левоцетиризина должна быть скорректирована в 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

Повышенная чувствительность к активному веществу, цетирину, 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).

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 препаратами).

Беременность и период грудного вскармливания.

Осторожность следует соблюдать 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 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 левоцетизину 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

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 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.

Поскольку левоцетиризин выводится из организма почками, при применении препарата у пациентов с почечной недостаточностью и пациентов пожилого возраста дозу следует корректировать в зависимости от степени почечной недостаточности.

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.

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 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 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.

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

Если Вы забыли принять препарат Эльцет[®], 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 ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$)

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 сновидений.

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, 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 один раз в сутки):

С частотой 1–10 %

<i>Нежелательные реакции</i>	<i>Левоцетиризин 5 мг (n=538)</i>	<i>Плацебо (n=382)</i>
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 явление 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:

Реакции гиперчувствительности, включая анафилаксию.

Со стороны обмена веществ и питания:

Повышение аппетита.

Нарушения 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, произвольные 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:

Ангioneвротический 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 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: сонливость (у взрослых), возбуждение и беспокойство, 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 не эффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Изучение взаимодействия левоцетиризина с другими лекарственными препаратами 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/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 вызывать 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.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Левоцетиризин может привести к повышенной сонливости, следовательно препарат Эльцет® 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.

По 7, 10, 14, 28, 30 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 1, 2, 3 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают без рецепта.

Производитель/организация, принимающая претензии потребителей

АО «АЛИУМ», Россия.

Московская обл., г.о. Серпухов, п. Оболенск, тер. Квартал А, д. 2.

Выпускающий контроль качества

Московская обл., г.о. Серпухов, п. Оболенск, тер. Квартал А, д. 2, стр. 1.

Телефон: +7 (495) 646-28-68.

E-mail: info@binnopharmgroup.ru