МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ЛЕТИЗЕН®

LETIZEN®

Регистрационный номер:

Торговое название: Летизен®

Международное непатентованное название (МНН): цетиризин

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав

1 таблетка содержит:

ЯДРО

Активное вещество:

Цетиризина дигидрохлорид	10,00 мг

Вспомогательные вещества:

Лактозы моногидрат	75,00 мг
Крахмал кукурузный	40,00 мг
Повидон	4,00 мг
Магния стеарат	1,00 мг

ОБОЛОЧКА ПЛЕНОЧНАЯ

Опадрай 33G28707:	3,60 мг
(готовая к использованию смесь:	
Гипромеллоза	1,440 мг
Титана диоксид (Е171)	0,864 мг
Лактозы моногидрат	0,792 мг
Макрогол 3000	0,288 мг
Триацетин	0,216 мг)

Описание

Круглые слегка двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, с риской.

Фармакотерапевтическая группа: противоаллергическое средство - H_1- гистаминовых рецепторов блокатор)

Код АТХ: R06AE07

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Цетиризин – конкурентный антагонист гистамина и метаболит гидроксизина. Цетиризин избирательно блокирует периферические H_1-гистаминовые рецепторы. Влияет на «раннюю» гистаминозависимую стадию аллергических реакций, ограничивает высвобождение медиаторов воспаления «поздней» стадии аллергической реакции, уменьшает миграцию эозинофилов, нейтрофилов и базофилов, стабилизирует мембраны тучных клеток. Устраняет кожную реакцию на введение гистамина, специфических аллергенов, а также на охлаждение (при холодовой крапивнице). Снижает гистамининдуцированную бронхоконстрикцию при бронхиальной астме легкого течения. Обладает противоаллергическим, противозудным и противоэкссудативным действием. Уменьшает проницаемость капилляров, предупреждает развитие отека тканей. Оказывает слабое антихолинэргическое и антисеротониновое действие. В терапевтических дозах обычно не вызывает седативного эффекта. Действие цетиризина начинается через 20 мин после приема внутрь. Максимальный эффект проявляется через 1 час после приема внутрь и продолжается более 24 ч. На фоне курсового лечения толерантности к антигистаминному действию цетиризина не развивается. После прекращения лечения действие сохраняется до 3 суток.

Фармакокинетика

Цетиризин обладает линейной фармакокинетикой в диапазоне доз от 5 до 60 мг. Быстро всасывается из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ); всасывание – 70 %. Достигает максимальной концентрации (C_{max}) в плазме крови (около 300 нг/мл) через 1 ч после приёма внутрь, а равновесной концентрации - через 3 дня применения. При длительном применении в организме не накапливается. Период полувыведения ($T_{1/2}$) составляет примерно 10 ч.

Степень всасывания цетиризина не зависит от приема пищи, но скорость всасывания может снижаться. Биодоступность цетиризина при приёме внутрь в форме таблеток или раствора одинакова.

Объём распределения цетиризина очень небольшой, по сравнению с другими антигистаминными препаратами, и составляет примерно 0,5 л/кг. В плазме крови примерно 93 % цетиризина связывается с альбумином.

Менее 14 % препарата метаболизируется в печени путем О-дезалкилирования с образованием фармакологически неактивного метаболита.

Цетиризин не подвергается активному метаболизму при эффекте «первого» прохождения через печень. В неизмененном виде цетиризин выводится почками, а метаболиты – с желчью через кишечник. В небольшом количестве секретируется в грудное молоко.

Особые группы пациентов

Пожилые пациенты

У пожилых пациентов $T_{½}$ увеличен на 50 %, а клиренс снижен на 40 %. Замедленное выведение является преимущественно результатом сниженного общего клиренса цетиризина, который зависит от функции почек.

Дети

У детей цетиризин достигает более высокой концентрации в плазме крови и быстрее выводится из организма. Общий клиренс выше, примерно, на 33 %, а $T_{½}$ короче на 33 % и составляет 6 ч у детей в возрасте 6-12 лет.

Нарушение функции почек

У здоровых добровольцев и пациентов с лёгкими нарушениями функции почек (клиренс креатинина (КК) более 40 мл/мин) фармакокинетика цетиризина одинакова. У пациентов с умеренными нарушениями функции почек $T_{½}$ увеличен в 3 раза, а клиренс снижен на 70 % по сравнению с добровольцами с нормальной функцией почек. Пациентам с умеренными или выраженными нарушениями функции почек необходима коррекция дозы.

У пациентов, находящихся на гемодиализе (КК менее 7 мл/мин) после однократного применения цетиризина внутрь $T_{½}$ увеличивается в 3 раза, а клиренс снижен на 70 % по сравнению со здоровыми добровольцами. Только 9,4 % дозы выводится из организма при гемодиализе.

Нарушение функции печени

У пациентов с циррозом печени, получавших 10 или 20 мг цетиризина в качестве однократной дозы, отмечалось увеличение $T_{½}$ на 50 % и снижение клиренса на 40 % по сравнению со здоровыми людьми. Изменение дозы необходимо только тем пациентам с заболеваниями печени, у которых имеются сопутствующие нарушения функции почек.

Показания к применению

- Сезонный и круглогодичный аллергический ринит и конъюнктивит;
- Поллиноз (сенная лихорадка);
- Крапивница (в том числе хроническая идиопатическая);
- Зудящие аллергические дерматозы;
- Отек Квинке.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к цетиризину, гидроксизину или вспомогательным компонентам препарата, терминальная почечная недостаточность (КК менее 10 мл/мин и потребность в гемодиализе), беременность, период грудного вскармливания, детский возраст до 6 лет (данная лекарственная форма), дефицит лактазы, непереносимость фруктозы или лактозы, синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции.

С осторожностью

Хроническая почечная недостаточность (за исключением терминальной, см. «Способ применения»), пожилой возраст (возможно снижение клубочковой фильтрации), хронические заболевания печени.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Данные о клиническом применении цетиризина у беременных женщин отсутствуют, поэтому не следует применять препарат Летизен® при беременности.

Цетиризин секретируется в грудное молоко, поэтому в период применения препарата Летизен®, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Способ применения и дозы

Внутрь, регулярно, предпочтительно в одно время суток, запивая небольшим количеством жидкости.

Взрослые и подростки старше 12 лет

Рекомендуемая суточная доза - 1 таблетка (10 мг) 1 раз в сутки.

Дети от 6 до 12 лет

Рекомендуемая суточная доза - ½ таблетки (5 мг) 2 раза в сутки.

Пожилые пациенты

Коррекция дозы не требуется.

Нарушения функции печени

Коррекция дозы не требуется.

Длительность лечения устанавливается врачом.

Взрослые пациенты с нарушением функции почек

Почечная недостаточность	**Клиренс креатинина (мл/мин)**	**Доза и кратность приёма**
Нормальная функция почек	≥80	10 мг 1 раз в сутки
Легкая	50-79	10 мг 1 раз в сутки

Средняя	30-49	5 мг 1 раз в сутки
Тяжелая	менее 30	5 мг 1 раз в сутки, раз в 2 дня
Терминальная, потребность в гемодиализе	10-30	Противопоказано

У детей с нарушением функции почек дозу следует корректировать индивидуально, учитывая КК, возраст пациента и массу его тела (рекомендуется использование препарата Летизен® в лекарственной форме раствор для приема внутрь).

Побочное действие

Классификация частоты развития побочных эффектов (ВОЗ):

очень часто >1/10

часто от > 1/100 до < 1/10

нечасто от > 1/1000 до < 1/100

редко от >1/10000 до < 1/1000

очень редко от < 1/10000, включая отдельные сообщения.

Со стороны нервной системы:

часто: головная боль, головокружение;

редко: мигрень, сонливость;

очень редко: судороги, изменение и потеря вкуса, парестезия, дискинезия, обморок, агрессивность; возбуждение, спутанность сознания, депрессия, бессонница, дистония, тремор, тик, галлюцинации, растерянность;

Со стороны дыхательной системы:

часто: фарингит, ринит;

Со стороны пищеварительной системы:

часто: сухость слизистой оболочки полости рта, тошнота;

редко: боль в животе;

очень редко: диарея, нарушение функции печени (повышение активности «печеночных» трансаминаз, щелочной фосфатазы, гамма-глутаминтрансферазы и концентрации билирубина);

Со стороны сердечно-сосудистой системы:

очень редко: тахикардия;

Со стороны мочевыделительной системы:

очень редко: расстройство мочеиспускания, энурез;

Со стороны органов чувств:

очень редко: нарушение аккомодации, нечеткость зрения, нистагм;

Со стороны кожных покровов:

очень редко: кожный зуд, сыпь, крапивница;

Аллергические реакции:

очень редко: анафилактический шок, ангионевротический отёк, реакции повышенной чувствительности;

Прочие:

часто: слабость;

очень редко: увеличение массы тела, астения, общее недомогание, отёки нижних конечностей;

Лабораторные показатели: тромбоцитопения.

Передозировка

Симптомы: спутанность сознания, диарея, головокружение, головная боль, общее недомогание, мидриаз, зуд, беспокойство, заторможенность, сонливость, тахикардия, тремор, задержка мочи, ступор, растерянность.

Лечение: специфического антидота нет.

В случае передозировки рекомендуется симптоматическое или поддерживающее лечение.

Необходим контроль за функциями сердечно-сосудистой и дыхательной систем.

Если после приёма препарата внутрь прошло немного времени, следует вызвать рвоту и промыть желудок, принять активированный уголь.

Специфического антидота нет. Гемодиализ неэффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Фармакокинетического взаимодействия цетиризина с псевдоэфедрином, циметидином, кетоконазолом, эритромицином, азитромицином, диазепамом и глипизидом не обнаружено.

Одновременное применение цетиризина с теофиллином (400 мг/сут) приводит к снижению общего клиренса цетиризина на 16 % (кинетика теофиллина не изменяется).

При одновременном применении с макролидами и кетоконазолом изменений на электрокардиограмме не отмечается.

Миелотоксичные лекарственные средства усиливают проявление гематотоксичности препарата.

Особые указания

При пропуске дозы необходимо принять её как можно скорее. Если до следующего приёма препарата Летизен® остаётся несколько часов, принимают стандартную дозу в обычное время, оставляя пропущенной предыдущую дозу.

Поскольку у некоторых пациентов препарат Летизен® может вызывать сонливость, его рекомендуется принимать вечером.

В терапевтических дозах не отмечено клинически значимого взаимодействия с этанолом (при концентрации этанола в крови до 0,5 г/л). Тем не менее, рекомендуется воздерживаться от употребления алкоголя во время лечения.

Препарат Летизен® содержит лактозу, поэтому он противопоказан пациентам с дефицитом лактазы, непереносимостью лактозы, синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции.

Влияние на способность управлять автотранспортом и другими техническими устройствами: препарат Летизен® у некоторых пациентов может вызвать сонливость, поэтому, необходимо воздержаться от управления транспортными средствами и работы со сложными техническими устройствами, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 10 мг.

По 10 таблеток в блистер из ПВХ/алюминиевой фольги.

По 1 или 2 блистера в пачку картонную вместе с инструкцией по применению.

Условия хранения

При температуре не выше 30 °С, в оригинальной упаковке.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет.

Не использовать препарат после истечения срока годности.

Условия отпуска из аптек

Отпускают без рецепта.

Производитель:

КРКА, д.д., Ново место, Шмарьешка цеста 6, 8501 Ново место, Словения

По всем вопросам обращаться по адресу Представительства в РФ:

123022, Москва, ул.2-я Звенигородская, д.13, стр.41

Тел.: (495) 739-66-00, факс: (495) 739-66-01

При расфасовке и/или упаковке на российском предприятии указывается:

ООО "КРКА-РУС", 143500, Россия, Московская обл., г. Истра, ул. Московская, д. 50

Тел.: (495) 994-70-70

Факс: (495) 994-70-78

Представитель фирмы KRKA KRKA, tovarna zdravil, d.d., Novo mesto 9452 И.К. Моногова