

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Левосетиризин-Тева

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Левосетиризин-Тева

Международное непатентованное наименование: Левосетиризин

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав

1 таблетка содержит: *действующее вещество* левосетиризина дигидрохлорид 5,00 мг; *вспомогательные вещества*: целлюлоза микрокристаллическая (марка 102) 30,00 мг, лактозы моногидрат 63,50 мг, кремния диоксид коллоидный (кремния диоксид коллоидный безводный) 0,50 мг, магния стеарат 1,00 мг; *оболочка* Опадрай Y1-7000H белый: макрогол-400 (полиэтиленгликоль-400) 0,1875 мг, титана диоксид (E171) 0,9375 мг, гипромеллоза-2910 (E464) 1,875 мг.

Описание

Овальные таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, с гравировкой «LC5» на одной стороне. Таблетки должны быть без трещин и сколов.

Фармакотерапевтическая группа: противоаллергическое средство - H₁-гистаминовых рецепторов блокатор

Код АТХ: R06AE09

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Левосетиризин - активное вещество препарата Левосетиризин-Тева; это R-энантиомер цетиризина, который относится к группе конкурентных антагонистов гистамина и блокирует H₁-гистаминовые рецепторы.

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

Левосетиризин 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.

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.

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

Менее 14% препарата метаболизируется в печени с образованием фармакологически неактивного метаболита. Из-за незначительного метаболизма и отсутствия метаболического потенциала взаимодействие левоцетиризина с другими лекарственными препаратами представляется маловероятным.

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

Особые 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%, что требует изменения соответствующего режима дозирования. Менее 10% препарата удаляется в ходе стандартной 4-часовой процедуры гемодиализа.

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 324 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 применимо и к левоцетиризину, так как оба препарата: и левоцетиризин, и цетиризин - выводятся преимущественно с мочой. Поэтому у пожилых пациентов доза левоцетиризина должна быть скорректирована в зависимости от функции почек.

Показания для применения

- 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 для применения

- 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 (ввиду ограниченности данных по безопасности и эффективности).

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»);
- при назначении беременным женщинам и в период грудного вскармливания.

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 назначении левоцетиризина беременным следует соблюдать осторожность.

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.

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-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 препарата 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 Левоцетиризин-Тева, не принимайте двойную дозу для компенсации пропущенной, примите следующую дозу в обычное время.

Побочное действие

Нежелательные реакции систематизированы в соответствии с Классификацией Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$); редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$); частота неизвестна (невозможно определить исходя из доступных данных).

Клинические исследования

Во время проведения клинических исследований у мужчин и женщин 12-71 лет с частотой 1% и более (часто $\geq 1/100$, $< 1/10$) встречались следующие побочные эффекты: головная боль, сонливость, сухость во рту, утомляемость, нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$) встречались астения и боль в животе.

Во время проведения клинических исследований у детей в возрасте от 6 до 12 лет с частотой 1% и более (часто $\geq 1/100$, $< 1/10$) встречались головная боль и сонливость.

Пострегистрационные исследования

Со стороны иммунной системы: очень редко - реакции гиперчувствительности, включая анафилаксию.

Со стороны метаболизма и расстройств питания: частота неизвестна - повышение аппетита.

Со стороны психики: очень редко - агрессия, возбуждение; частота неизвестна - тревога, депрессия, галлюцинации, бессонница, суицидальные мысли.

Со стороны нервной системы: очень редко - судороги, головная боль, сонливость; частота неизвестна - тромбоз синусов твердой мозговой оболочки, парестезия, головокружение, обморок, тремор, дисгевзия.

Со стороны органа слуха: частота неизвестна - вертиго.

Со стороны органа зрения: частота неизвестна - нарушение зрения, нечеткость зрительного восприятия, воспалительные проявления, непроизвольные движения глазных яблок (нистагм).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: очень редко - ощущение сердцебиения; частота неизвестна - стенокардия, тахикардия, тромбоз яремной вены.

Со стороны дыхательной системы: частота неизвестна - одышка, усиление симптомов ринита.

Со стороны пищеварительной системы: очень редко - тошнота, боль в животе, сухость во рту; частота неизвестна - рвота, диарея.

Гепатобилиарные расстройства: очень редко - изменение функциональных проб печени; частота неизвестна - гепатит.

Со стороны почек и мочевыделительной системы: частота неизвестна - дизурия, задержка мочи.

Со стороны кожи и мягких тканей: очень редко - ангионевротический отек, стойкая лекарственная эритема, сыпь, зуд, крапивница; частота неизвестна - гипотрихоз, трещины, фотосенсибилизация.

Со стороны костно-мышечной системы: частота неизвестна - боль в мышцах, артралгия.

Общие расстройства: очень редко - увеличение массы тела, усталость, астения; частота неизвестна - периферические отеки.

Прочее: частота неизвестна - перекрестная реактивность.

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), возбуждение и беспокойство, сменяющиеся сонливостью (у детей).

Лечение: необходимо промыть желудок или принять активированный уголь, если после приема препарата прошло мало времени. Рекомендуется проведение

симптоматической и поддерживающей терапии. Специфического антидота нет. Гемодиализ не эффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Изучение взаимодействия левоцетиризина с другими лекарственными препаратами не проводилось. При изучении лекарственного взаимодействия рацемата цетиризина с антипирином, 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%).

В ряде случаев одновременное применение левоцетиризина с алкоголем или лекарственными препаратами, оказывающими 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.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Левоцетиризин может привести к повышенной сонливости, следовательно, препарат Левоцетиризин-Тева 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 таблеток в блистер из алюминиевой ламинированной фольги. По 1 или 2 блистера вместе с инструкцией по применению в пачку картонную, на которую дополнительно могут быть нанесены защитные наклейки.

Или по 10 таблеток в блистер из алюминиевой ламинированной фольги. По 1 блистеру вместе с инструкцией по применению в пачку картонную, на которую дополнительно могут быть нанесены защитные наклейки.

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.

Условия отпуска

Отпускают без рецепта.

**Наименование держателя (владельца) регистрационного удостоверения
лекарственного препарата**

Тева Фармацевтические Предприятия Лтд., Израиль

Производитель

Тева Фармацевтические Предприятия Лтд.,

18 Эли Гурвитц Стрит, Индастриал Зоун, Кфар-Саба, Израиль

Организация, принимающая претензии потребителей

ООО «Тева», 115054, Москва, ул. Валовая, 35,

тел.: +7 (495) 644 22 34, факс: +7 (495) 644 22 35

Адрес в интернете: www.teva.ru

Менеджер по регистрации



Лотышева О.В.