

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**Зодак® Экспресс**

наименование лекарственного препарата

таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 5 мг

лекарственная форма, дозировка

Зентива к.с., Чешская Республика

наименование производителя, страна

Изменение № 4

Дата внесения Изменения «___» _____ 20__ г.

Старая редакция	Новая редакция
Фармакологические свойства Фармакокинетика Фармакокинетические параметры левоцетиризина изменяются линейно и практически не отличаются от фармакокинетики цетиризина. Всасывание После приема внутрь препарат быстро и полностью абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Прием пищи не влияет на полноту абсорбции, хотя скорость ее уменьшается. У взрослых после однократного приема препарата в терапевтической дозе (5 мг) максимальная концентрация (C_{max}) в плазме крови достигается через 0,9 ч и составляет 270 нг/мл, после повторного приема в дозе 5 мг - 308 нг/мл. Равновесная концентрация достигается через 2 суток. Распределение Левосетиризин на 90 % связывается с	Фармакологические свойства Фармакокинетика Фармакокинетические параметры левоцетиризина изменяются линейно и практически не отличаются от фармакокинетики цетиризина. Всасывание После приема внутрь препарат быстро и полностью абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Прием пищи не влияет на полноту абсорбции, хотя скорость ее уменьшается. У взрослых после однократного приема препарата в терапевтической дозе (5 мг) максимальная концентрация (C_{max}) в плазме крови достигается через 0,9 ч и составляет 270 нг/мл, после повторного приема в дозе 5 мг - 308 нг/мл. Равновесная концентрация достигается через 2 суток. Распределение Левосетиризин на 90 % связывается с

Старая редакция	Новая редакция
белками плазмы крови. Объем распределения (V_d) составляет 0,4 л/кг. Биодоступность достигает 100 %.	белками плазмы крови. Объем распределения (V_d) составляет 0,4 л/кг. Биодоступность достигает 100 %.
<i>Метаболизм</i>	<i>Метаболизм</i>
В небольших количествах (< 14%) левоцетиризин метаболизируется в организме путем N- и O-деалкилирования (в отличие от других антагонистов H₁-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.	В небольших количествах (< 14%) левоцетиризин метаболизируется в организме путем N- и O-деалкилирования (в отличие от других антагонистов H₁-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.
<i>Выведение</i>	<i>Выведение</i>
У взрослых период полувыведения ($T_{1/2}$) составляет $7,9 \pm 1,9$ ч; у маленьких детей $T_{1/2}$ укорочен. 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.	У взрослых период полувыведения ($T_{1/2}$) составляет $7,9 \pm 1,9$ ч; у маленьких детей $T_{1/2}$ укорочен. 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.
Фармакокинетика у особых групп пациентов	Фармакокинетика у особых групп пациентов
<i>Пациенты с почечной недостаточностью</i> У пациентов с почечной недостаточностью (клиренс креатинина (КК) < 40 мл/мин) клиренс препарата уменьшается, а $T_{1/2}$ удлиняется (так, у больных, находящихся на гемодиализе, общий клиренс снижается на 80 %), что требует соответствующего изменения режима дозирования. Менее 10 %	<i>Пациенты с почечной недостаточностью</i> У пациентов с умеренной и тяжелой почечной недостаточностью (в зависимости от скорости клубочковой фильтрации [СКФ]) клиренс препарата уменьшается, а $T_{1/2}$ удлиняется (так, у больных, находящихся на гемодиализе, общий клиренс снижается на 80 %), что требует

Старая редакция	Новая редакция
левоцетиризина удаляется в ходе стандартной 4-часовой процедуры гемодиализа. <i>Дети</i> 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 (у детей в возрасте от 1 до 11 лет и 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 до 5 лет приводит к концентрации в плазме, соответствующей таковой у взрослых при приеме 5 мг препарата один раз в сутки. <i>Пожилые пациенты</i> Данные по фармакокинетике у пожилых пациентов ограничены. При повторном приеме 30 мг левоцетиризина один раз в сутки в течение 6 дней у пожилых пациентов (возраст от 65 до 74 лет) общий	коррекции режима дозирования (см.раздел «Способ применения и дозы»). Менее 10 % левоцетиризина удаляется в ходе стандартной 4-часовой процедуры гемодиализа. <i>Дети</i> 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 (у детей в возрасте от 1 до 11 лет и 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 до 5 лет приводит к концентрации в плазме, соответствующей таковой у взрослых при приеме 5 мг препарата один раз в сутки. <i>Пожилые пациенты</i> Данные по фармакокинетике у пожилых пациентов ограничены. При повторном приеме 30 мг левоцетиризина один раз в

Старая редакция	Новая редакция
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.	сутки в течение 6 дней у 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.
Противопоказания • Гиперчувствительность к левоцетиризину, цетиризину, гидроксизину, и другим производным пиперазина или к любому из вспомогательных компонентов препарата; • терминальная стадия почечной недостаточности (КК менее 10 мл/мин); • возраст до 6 лет (для данной лекарственной формы); • врожденная непереносимость галактозы, дефицит лактазы или мальабсорбция глюкозы - галактозы (из-за содержания в препарате лактозы).	Противопоказания • Гиперчувствительность к левоцетиризину, цетиризину, гидроксизину, и другим производным пиперазина или к любому из вспомогательных компонентов препарата; • терминальная стадия почечной недостаточности, требующая диализ (скорость клубочковой фильтрации [СКФ] менее 15 мл/мин); • возраст до 6 лет (для данной лекарственной формы); • врожденная непереносимость галактозы, дефицит лактазы или мальабсорбция глюкозы - галактозы (из-за содержания в препарате лактозы).
Способ применения и дозы Таблетку следует принимать внутрь, не	Способ применения и дозы Таблетку следует принимать внутрь, не

Старая редакция	Новая редакция
разжевывая и запивая жидкостью, независимо от приема пищи. Рекомендуется принимать суточную дозу в один прием. <i>Взрослые, подростки и дети старше 6 лет</i> Рекомендуемая суточная доза составляет 5 мг (1 таблетка). Если после лечения улучшения не наступает или появляются новые симптомы, необходимо проконсультироваться с врачом. Применяйте препарат только согласно тому способу применения и в тех дозах, которые указаны в инструкции. В случае необходимости, пожалуйста, проконсультируйтесь с врачом перед применением лекарственного препарата. <i>Пациенты пожилого возраста</i> У пожилых пациентов с почечной недостаточностью умеренной степени тяжести и тяжелой почечной недостаточностью рекомендуется корректировка дозы (см. «Пациенты с нарушением функции почек»). <i>Пациенты с нарушением функции почек</i> При назначении препарата пациентам с нарушением функции почек в случае, когда альтернативное лечение не может быть назначено, дозу следует корректировать в зависимости от величины КК, поскольку левоцетиризин выводится из организма в основном почками. КК для мужчин можно рассчитать, исходя из концентрации сывороточного креатинина,	разжевывая и запивая жидкостью, независимо от приема пищи. Рекомендуется принимать суточную дозу в один прием. <i>Взрослые, подростки и дети старше 6 лет</i> Рекомендуемая суточная доза составляет 5 мг (1 таблетка). Если после лечения улучшения не наступает или появляются новые симптомы, необходимо проконсультироваться с врачом. Применяйте препарат только согласно тому способу применения и в тех дозах, которые указаны в инструкции. В случае необходимости, пожалуйста, проконсультируйтесь с врачом перед применением лекарственного препарата. <i>Пациенты пожилого возраста</i> У пожилых пациентов с почечной недостаточностью умеренной степени тяжести и тяжелой почечной недостаточностью рекомендуется корректировка дозы (см. «Пациенты с нарушением функции почек»). <i>Пациенты с нарушением функции почек</i> При назначении препарата пациентам с нарушением функции почек в случае, когда альтернативное лечение не может быть назначено, дозу следует корректировать в зависимости от функции почек (скорость клубочковой фильтрации [СКФ]), поскольку левоцетиризин выводится из организма в основном почками. Коррекция дозы у пациентов с нарушением

Старая редакция	Новая редакция																																				
по следующей формуле: $\text{КК (мл/мин)} = \frac{[140 - \text{возраст (годы)}] \times \text{масса тела (кг)}}{72 \times \text{КК}_{\text{сыворот}} (\text{мг/дл})}$ КК для женщин можно рассчитать, умножив полученное значение на коэффициент 0,85. Коррекция дозы у пациентов с нарушением функции почек: <table><tr><th>Почечная недостаточность</th><th>КК (мл/мин)</th><th>Доза и кратность приема</th></tr><tr><td>Норма</td><td>≥ 80</td><td>5 мг один раз в сутки</td></tr><tr><td>Легкая</td><td>50-79</td><td>5 мг один раз в сутки</td></tr><tr><td>Умеренная</td><td>30-49</td><td>5 мг один раз в 2 суток</td></tr><tr><td>Тяжелая</td><td><30</td><td>5 мг один раз в 3 суток</td></tr><tr><td>Терминальная стадия — пациенты на диализе</td><td><10</td><td>Противопоказано</td></tr></table> У детей с нарушением функции почек дозу корректируют индивидуально с учетом КК и массы тела. Специальных рекомендаций по применению у детей с нарушением функции почек нет. <i>Пациенты с нарушением функции печени</i> При изолированном нарушении функции печени коррекции дозы не требуется. Взрослым пациентам с нарушением функции печени и почек дозирование осуществляют согласно таблице, приведенной выше. <i>Продолжительность лечения</i> При лечении сезонного (интермиттирующего) ринита (наличие симптомов менее 4 дней в неделю или их	Почечная недостаточность	КК (мл/мин)	Доза и кратность приема	Норма	≥ 80	5 мг один раз в сутки	Легкая	50-79	5 мг один раз в сутки	Умеренная	30-49	5 мг один раз в 2 суток	Тяжелая	<30	5 мг один раз в 3 суток	Терминальная стадия — пациенты на диализе	<10	Противопоказано	функции почек: <table><tr><th>Почечная недостаточность</th><th>СКФ (мл/мин)</th><th>Доза и кратность приема</th></tr><tr><td>Норма</td><td>≥ 90</td><td>5 мг один раз в сутки</td></tr><tr><td>Легкая</td><td>60 - <90</td><td>5 мг один раз в сутки</td></tr><tr><td>Умеренная</td><td>30-<60</td><td>5 мг один раз в 2 суток</td></tr><tr><td>Тяжелая</td><td><30</td><td>5 мг один раз в 3 суток</td></tr><tr><td>Терминальная стадия — пациенты на диализе</td><td><15 (на диализе)</td><td>Противопоказано</td></tr></table> У детей с нарушением функции почек дозу корректируют индивидуально с учетом КК и массы тела. Специальных рекомендаций по применению у детей с нарушением функции почек нет. <i>Пациенты с нарушением функции печени</i> При изолированном нарушении функции печени коррекции дозы не требуется. Взрослым пациентам с нарушением функции печени и почек дозирование осуществляют согласно таблице, приведенной выше. <i>Продолжительность лечения</i> 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	Почечная недостаточность	СКФ (мл/мин)	Доза и кратность приема	Норма	≥ 90	5 мг один раз в сутки	Легкая	60 - <90	5 мг один раз в сутки	Умеренная	30-<60	5 мг один раз в 2 суток	Тяжелая	<30	5 мг один раз в 3 суток	Терминальная стадия — пациенты на диализе	<15 (на диализе)	Противопоказано
Почечная недостаточность	КК (мл/мин)	Доза и кратность приема																																			
Норма	≥ 80	5 мг один раз в сутки																																			
Легкая	50-79	5 мг один раз в сутки																																			
Умеренная	30-49	5 мг один раз в 2 суток																																			
Тяжелая	<30	5 мг один раз в 3 суток																																			
Терминальная стадия — пациенты на диализе	<10	Противопоказано																																			
Почечная недостаточность	СКФ (мл/мин)	Доза и кратность приема																																			
Норма	≥ 90	5 мг один раз в сутки																																			
Легкая	60 - <90	5 мг один раз в сутки																																			
Умеренная	30-<60	5 мг один раз в 2 суток																																			
Тяжелая	<30	5 мг один раз в 3 суток																																			
Терминальная стадия — пациенты на диализе	<15 (на диализе)	Противопоказано																																			

Старая редакция	Новая редакция
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 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 Зодак® Экспресс, не принимайте двойную дозу для компенсации пропущенной, примите следующую дозу в обычное время.	(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 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 Зодак® Экспресс, не принимайте двойную дозу для компенсации пропущенной, примите следующую дозу в обычное время.
Особые указания Применение препарата в форме таблеток, покрытых пленочной оболочкой, противопоказано у детей до 6 лет, так как такая форма выпуска не обеспечивает возможности коррекции дозы. Пациентам с почечной недостаточностью	Особые указания Применение препарата в форме таблеток, покрытых пленочной оболочкой, противопоказано у детей до 6 лет, так как такая форма выпуска не обеспечивает возможности коррекции дозы. Пациентам с почечной недостаточностью

Старая редакция	Новая редакция
умеренной степени тяжести и тяжелой почечной недостаточностью рекомендуется увеличение интервалов между приемами препарата Зодак® Экспресс в соответствии с показателем КК. При применении препарата Зодак® Экспресс у пациентов с повреждением спинного мозга, гиперплазией предстательной железы, а также при наличии других предрасполагающих факторов к задержке мочи, требуется соблюдение осторожности, так как левоцетиризин может увеличивать риск развития задержки мочи. При применении препарата Зодак® Экспресс у пациентов с эпилепсией и у пациентов с риском возникновения судорог требуется соблюдение осторожности, поскольку левоцетиризин может вызывать развитие судорожного синдрома (см. раздел «С осторожностью»). Во время применения препарата Зодак® Экспресс пациентам рекомендуется воздержаться от употребления алкогольных напитков. В состав продукта входит лактозы моногидрат; пациентам с редкими наследственными заболеваниями, сопровождающимися непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы (дефицит лактазы Лаппа) или при синдроме мальабсорбции глюкозы/галактозы данный лекарственный препарат противопоказан. Внимательно прочтите инструкцию перед	умеренной степени тяжести и тяжелой почечной недостаточностью рекомендуется увеличение интервалов между приемами препарата Зодак® Экспресс в зависимости от почечной функции. При применении препарата Зодак® Экспресс у пациентов с повреждением спинного мозга, гиперплазией предстательной железы, а также при наличии других предрасполагающих факторов к задержке мочи, требуется соблюдение осторожности, так как левоцетиризин может увеличивать риск развития задержки мочи. При применении препарата Зодак® Экспресс у пациентов с эпилепсией и у пациентов с риском возникновения судорог требуется соблюдение осторожности, поскольку левоцетиризин может вызывать развитие судорожного синдрома (см. раздел «С осторожностью»). Во время применения препарата Зодак® Экспресс пациентам рекомендуется воздержаться от употребления алкогольных напитков. Реакция на кожные аллергические пробы ингибируется антигистаминами, поэтому перед назначением аллергологических проб рекомендован трехдневный «отмывочный» период. После прекращения применения левоцетиризина может возникнуть зуд, в том числе интенсивный, даже если эти симптомы отсутствовали до

Старая редакция	Новая редакция
тем, как начать применение препарата. Сохраните инструкцию, она может понадобиться вновь. Если у Вас возникли вопросы, обратитесь к врачу. Лекарственный препарат, которым Вы лечитесь предназначен лично Вам, и его не следует передавать другим лицам, поскольку оно может причинить им вред даже при наличии тех же симптомов, что и у Вас.	начала лечения. Симптомы могут исчезнуть спонтанно, или может потребоваться возобновление лечения до исчезновения данных симптомов. В состав продукта входит лактозы моногидрат; пациентам с редкими наследственными заболеваниями, сопровождающимися непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы (дефицит лактазы Лаппа) или при синдроме мальабсорбции глюкозы/галактозы данный лекарственный препарат противопоказан. Внимательно прочтите инструкцию перед тем, как начать применение препарата. Сохраните инструкцию, она может понадобиться вновь. Если у Вас возникли вопросы, обратитесь к врачу. Лекарственный препарат, которым Вы лечитесь предназначен лично Вам, и его не следует передавать другим лицам, поскольку оно может причинить им вред даже при наличии тех же симптомов, что и у Вас.
Организация, принимающая претензии потребителей: ООО «Опелла Хелскеа». Россия, 125009, г. Москва, ул. Тверская, 22. Телефон: (495) 721-14-00. Факс: (495) 721-14-11.	Организация, принимающая претензии потребителей: ООО «Опелла Хелскеа». Россия, 125375, г. Москва, ул. Тверская, 22. Телефон: (495) 721-14-00. Факс: (495) 721-14-11.

Менеджер по регистрации



Хотулева Е.В.