

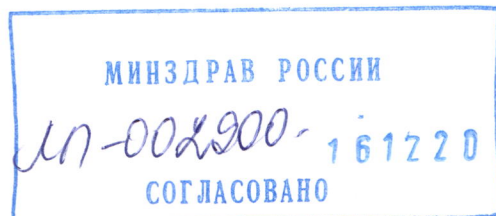
МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО

ПРЕПАРАТА

Алерсэт-Л



Регистрационный номер:

Торговое наименование препарата: Алерсэт-Л

Международное непатентованное или группировочное наименование:
левоцетиризин

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав

Одна таблетка, покрытая пленочной оболочкой. содержит:

действующее вещество: левоцетиризина дигидрохлорид 5 мг;

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат 83 мг, лактоза 23 мг, крахмал прежелатинизированный 15,5 мг, магния стеарат 3 мг;

состав оболочки: инстакоат (IC-S-344) 1 мг [гипромеллоза 48 %, диэтилфталат 12 %, этилцеллюлоза 40 %], гипромеллоза-E15 3,11 мг, титана диоксид (E171) 0,8 мг, макрогол – 400 0,64 мг, краситель железа оксид красный (E172) 0,1 мг, тальк 0,8 мг.

Описание

Таблетки продолговатой формы, покрытые пленочной оболочкой светло-розового цвета, с риской на одной стороне. Вид таблетки на поперечном разрезе: оболочка – светло-розового цвета, ядро – белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Противоаллергическое средство – H₁-гистаминовых рецепторов блокатор

Код АТХ: R06AE09

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Левосетиризин – R-энантиомер цетиризина; мощный и селективный антагонист гистамина, блокирующий H₁-гистаминовые рецепторы.

Левосетиризин оказывает влияние на гистаминозависимую 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 левосетиризина изменяются линейно.

Всасывание

После приема внутрь левосетиризин быстро и полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта. Одновременный прием пищи не оказывает влияния на полноту всасывания, но снижает его скорость. Максимальная концентрация в плазме крови (C_{max}) достигается через 0,9 часа и составляет 270 нг/мл, равновесная концентрация достигается через 2 суток.

Распределение

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

Метаболизм

В небольших количествах (менее 14%) метаболизируется в организме путем N- и O-дезалкилирования (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.

Выведение

Период полувыведения ($T_{1/2}$) у взрослых составляет $7,9 \pm 1,9$ час. У детей младшего возраста $T_{1/2}$ короче. У взрослых общий клиренс составляет 0,63 мл/мин/кг.

Около 85,4 % принятой дозы препарата выводится почками в неизмененном виде путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции; около 12,9 % - через кишечник.

Отдельные группы пациентов

Пациенты с нарушением функции почек

У пациентов с нарушением функции почек (клиренс креатинина (КК) 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 нарушением функции печени

Фармакокинетика левоцетиризина у пациентов с печеночной недостаточностью не изучалась. У пациентов с хроническими заболеваниями печени (гепатоцеллюлярный, холестатический или билиарный цирроз), получавших рацемическое соединение цетиризина в дозе 10 или 20 мг однократно, наблюдалось увеличение $T_{1/2}$ на 50% и снижение клиренса препарата на 40%, по сравнению со здоровыми добровольцами.

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 приеме внутрь однократно 5 мг левоцетиризина показали, что показатели C_{max} и AUC (площадь под фармакокинетической кривой «концентрация-время») примерно в 2 раза превышают аналогичные показатели у взрослых здоровых добровольцев 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 $T_{1/2}$ на 24% короче у детей, чем соответствующие показатели у взрослых. Специальные фармакокинетические исследования у детей младше 6 лет не проводились. Ретроспективный фармакокинетический анализ был 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 крови, соответствующей таковой у взрослых при применении 5 мг препарата один раз в сутки.

Пожилые пациенты

Данные по фармакокинетике у пожилых пациентов ограничены. При повторном применении 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 почками. 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 действующему 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 (КК) менее 10 мл/мин);

Детский возраст до 6 лет (ввиду ограниченности данных по безопасности и эффективности);

С осторожностью

Хроническая почечная недостаточность (требуется коррекция режима дозирования); применение у пациентов пожилого возраста (возможно снижение скорости клубочковой фильтрации); применение 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. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»); беременность, период грудного вскармливания.

Осторожность следует соблюдать при применении 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 беременности). Однако, применение цетиризина, рацемата левоцетиризина, при беременности (более

1000 исходов беременности) 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, выделяется 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 применении левоцетиризина в период грудного вскармливания.

Фертильность

Клинические данные по левоцетиризину 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

Препарат Алерсэт-Л принимают внутрь, таблетки проглатывают целиком, во время приема пищи или натощак, запивая небольшим количеством воды.

Взрослые и дети старше 6 лет: суточная доза составляет 5 мг (1 таблетка) однократно.

Основным путем выведения левоцетиризина из организма является выведение почками, поэтому при применении препарата Алерсэт-Л у пациентов *пожилого возраста* и пациентов *с нарушением функции почек* доза должна быть скорректирована в зависимости от степени нарушения функции почек, основываясь на оценке КК (мл/мин).

Пациентам с легким нарушением функции почек (КК 50-79 мл/мин) коррекции дозы не требуется.

У пациентов с умеренной почечной недостаточностью (КК от 30 до 49 мл/мин) рекомендуемая доза 5 мг через день.

У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (КК от 10 до 29 мл/мин) рекомендуемая доза 5 мг 1 раз в 3 дня.

У пациентов с терминальной почечной недостаточностью (КК менее 10 мл/мин) применение препарата противопоказано (см. раздел «Противопоказания»).

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) аллергического 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) терапия 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 врачу.

Если Вы забыли принять препарат, не принимайте двойную дозу для компенсации пропущенной, примите следующую дозу в обычное время.

Побочное действие

Данные представлены по системно-органным классам в соответствии со словарем нормативно-правовой деятельности (MedDRA) и со следующей частотой: очень часто ($\geq 1/10$); часто (от $\geq 1/100$ до $< 1/10$); нечасто (от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$); редко (от $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$); частота неизвестна (не может быть установлена на основании имеющихся данных).

Данные по безопасности, полученные при изучении цетиризина

Наблюдались следующие нежелательные реакции

Редко ($\geq 1/10000$ до $< 1/1000$)

Встречались легкие и временные нежелательные реакции: повышенная утомляемость, нарушение концентрации, сонливость, головная боль, головокружение, возбудимость, сухость во рту и нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта (запор). В некоторых случаях наблюдались реакции гиперчувствительности и ангионевротический отек.

Также сообщалось об отдельных случаях судорог, реакции фоточувствительности, поражении печени, анафилактического шока, нарушения кровообращения, глухоты, плохого самочувствия, кожного зуда, васкулита, зрительных нарушениях и кошмарных сновидениях.

Клинические исследования левоцетиризина

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 и 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 1 раз в сутки):

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.

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:

Частота побочных эффектов неизвестна (не может быть оценена по имеющимся данным).

Нарушения со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности, в том числе анафилактические реакции;

Нарушения со стороны обмена веществ и питания: повышение аппетита.

Нарушения со стороны психики: тревога, агрессия, возбуждение, бессонница, галлюцинации, депрессия, суицидальные мысли, кошмарные сновидения.

Нарушения со стороны нервной системы: судороги, тромбоз синусов твердой мозговой оболочки, парестезия, головокружение, обморок, тремор, дисгевзия (нарушение вкуса).

Нарушения со стороны органа зрения: нарушение зрения, нечеткость зрительного восприятия, воспалительные проявления, непроизвольные движения глазных яблок (нистагм).

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения: вертиго.

Нарушения со стороны сердца: тахикардия, стенокардия, ощущение сердцебиения.

Нарушения со стороны сосудов: тромбоз яремной вены.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: одышка, усиление симптомов ринита.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, рвота.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: гепатит.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: ангионевротический отек, экзантема, гипотрихоз, зуд, сыпь, трещины, крапивница, фотосенсибилизация/токсичность. стойкая лекарственная эритема.

Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани: боль в мышцах, артралгия.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: дизурия, задержка мочи.

Общие расстройства: неэффективность препарата и его взаимодействия, сухость слизистых оболочек.

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 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), вначале могут появиться возбуждение и беспокойство.

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 неэффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Изучение взаимодействия левоцетиризина с другими лекарственными средствами 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/сутки) общий клиренс цетиризина снижается на 16 %, при этом фармакокинетика теофиллина не изменяется.

В исследовании при одновременном приеме *ритонавира* (600 мг 2 раза в сутки) и цетиризина (10 мг в сутки) показано, что экспозиция цетиризина увеличивалась на 40 %, а экспозиция ритонавира незначительно изменялась (-11 %).

У чувствительных пациентов одновременный прием левоцетиризина и этанола или лекарственных средств, оказывающих подавляющее влияние на центральную нервную систему, может вызвать заторможенность и снижение работоспособности.

Особые указания

Интервалы между приемами доз препарата Алерсэт-Л должны быть подобраны индивидуально в зависимости от нарушений функции почек.

Рекомендуется соблюдать осторожность при одновременном употреблении препарата Алерсэт-Л с алкоголем (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»).

При наличии у пациентов предполагающих факторов к задержке мочи (например, повреждение спинного мозга, гиперплазия предстательной железы) следует соблюдать осторожность, поскольку левоцетиризин может увеличить риск задержки мочи.

Осторожность следует соблюдать при применении препарата у пациентов с эпилепсией и повышенной судорожной готовностью, поскольку препарат Алерсэт-Л может вызвать обострение приступов.

Реакция на кожные аллергические пробы подавляется антигистаминными препаратами, и перед проведением тестирования необходимо воздержаться от применения препарата Алерсэт-Л в течение 3 дней.

Возможно появление кожного зуда после прекращения применения препарата Алерсэт-Л, даже если подобных симптомов не было в начале терапии. Симптомы могут пройти самостоятельно. В некоторых случаях симптомы могут быть сильно выражены, и это может потребовать

возобновления терапии. После возобновления терапии эти симптомы должны пройти.

Дети

Левосетиризин в таблетках, покрытых пленочной оболочкой противопоказан у детей до 6 лет, поскольку данная лекарственная форма не позволяет использовать подходящую дозировку для этой возрастной группы. Рекомендуется использовать педиатрическую лекарственную форму (капли для приема внутрь).

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Применение препарата Алерсэт-Л может привести к повышенной сонливости, следовательно, применение препарата Алерсэт-Л может оказывать влияние на способность управлять автотранспортом или работу с механизмами. В период лечения следует воздержаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой 5 мг.

По 10 таблеток в блистер, изготовленный из ПВХ пленки и алюминиевой фольги.

По 1, 2, 10 блистеров вместе с инструкцией по применению помещают в картонную пачку.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 30 ° C блистер в пачке.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять после истечения срока годности.

Условия отпуска

Отпускают без рецепта.

Владелец регистрационного удостоверения/Производитель

Микро Лабс Лимитед

Юр. адрес: 31 Рейс Корс Род, Бангалор – 560 001, Индия

Адрес места производства:

«Микро Лабс Лимитед»

92, Промышленный комплекс Сипкот, Хосур – 635126 (Т.Н.), Индия

Организация, принимающая претензии потребителей

Представительство компании «Микро Лабс Лимитед»

119571, г. Москва, Ленинский проспект, д. 148, офис 57/58

Тел: (495) 937-27-70/71

Представитель фирмы



Гветадзе Н.Ш.