

МИНЗДРАВ РОССИИ

ЛП - 003975 - 211116

СОГЛАСОВАНО

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Левосетиризин

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Левосетиризин

Международное непатентованное название: левосетиризин

Лекарственная форма: таблетки покрытые пленочной оболочкой

Состав:

Одна таблетка содержит:

действующее вещество: левосетиризина дигидрохлорид - 5,0 мг;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая – 53,2 мг, кроскармеллоза натрия – 3,8 мг, крахмал прежелатинизированный – 32,04 мг, кремния диоксид коллоидный – 0,48 мг, магния стеарат – 0,48 мг;

оболочка таблетки: опадрай II белый - 3,8 мг (лактозы моногидрат – 1,37 мг, гипромеллоза – 1,06 мг, титана диоксид – 0,99 мг, макрогол 3000 – 0,38 мг).

Описание:

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета. На поперечном разрезе - внутренний слой белого или почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа: противоаллергическое средство - H₁-гистаминовых рецепторов блокатор.

Код АТХ: R06AE09.

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика:

Левосетиризин – это R-энантиомер цетиризина; конкурентный антагонист гистамина; блокирует H₁-гистаминовые рецепторы, средство к которым в 2 раза выше, чем у

цетиризина. Левоцетиризин оказывает влияние на гистаминазависимую стадию аллергических реакций; уменьшает миграцию эозинофилов, уменьшает сосудистую проницаемость, ограничивает высвобождение медиаторов воспаления. Предупреждает развитие и облегчает течение аллергических реакций, оказывает противоэкссудативное, противоэдематозное действие; практически не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия. В терапевтических дозах практически не оказывает седативного действия.

Фармакокинетика:

Фармакокинетические параметры левоцетиризина изменяются линейно в зависимости от дозы и практически не отличаются от фармакокинетики цетиризина.

Абсорбция: Быстро и полностью всасывается при приеме внутрь. Прием пищи не оказывает влияния на полноту всасывания, но снижает его скорость. Максимальная концентрация (C_{max}) в плазме крови достигается через 0,9 час и составляет 270 нг/мл. Постоянный уровень концентрации препарата достигается через двое суток приема.

Распределение: Связывание с белками плазмы крови – 90%. Объем распределения (V_d) составляет 0,4 л/кг. Биодоступность достигает 100%. Проникает в грудное молоко.

Метаболизм: Менее 14% препарата метаболизируется в печени путем N- и O-деалкилирования с образованием фармакологически неактивного метаболита. Из-за низкого уровня метаболизма и отсутствия метаболического потенциала (в его метаболизме система цитохрома задействована минимально) взаимодействие левоцетиризина с другими лекарственными препаратами представляется маловероятным.

Выведение: У взрослых $T_{1/2}$ (период полувыведения) составляет $7,9 \pm 1,9$ ч, а общий клиренс составляет 0,63 мл/мин/кг, у маленьких детей $T_{1/2}$ укорочен. Около 85,4% принятой дозы препарата выводится почками, около 12,9% - через кишечник.

Особые группы:

Пациенты с почечной недостаточностью

При почечной недостаточности (клиренс креатинина (КК) < 40 мл/мин) клиренс снижается (у пациентов, находящихся на гемодиализе – на 80%), $T_{1/2}$ удлиняется. Менее 10% левоцетиризина 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. 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 левоцетирин, и цетирин 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.

В случае необходимости, пожалуйста, проконсультируйтесь с врачом перед применением лекарственного препарата.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ ДЛЯ ПРИМЕНЕНИЯ

- Повышенная чувствительность к действующему 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 менее 10 мл/мин);
- Детский возраст до 6 лет (для таблеток, ввиду ограниченности данных по эффективности и безопасности).

С осторожностью:

Требуется соблюдение осторожности при следующих состояниях: хроническая почечная

недостаточность (необходима коррекция режима дозирования); у пациентов пожилого возраста (при возрастном снижении клубочковой фильтрации), при одновременном употреблении с алкоголем (см. также раздел «Взаимодействие с другими лекарственными препаратами»); 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 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

Препарат принимают внутрь во время приема пищи или натощак, не разжевывая, запивая небольшим количеством воды. Суточную дозу рекомендуется принимать за 1 прием.

Взрослые и дети старше 6 лет: суточная доза составляет 5 мг. Максимальная суточная доза – 5 мг. Детям младше 6 лет таблетки не назначают: для них используют другую, жидкую лекарственную форму.

Поскольку левоцетиризин выводится из организма почками, при назначении препарата пациентам с почечной недостаточностью и пациентам пожилого возраста дозу следует

корректировать в зависимости от величины клиренса креатинина.

Клиренс креатинина (КК) для мужчин можно рассчитать, исходя из концентрации сывороточного креатинина, по следующей формуле:

$$\text{КК (мл/мин)} = \frac{[140 - \text{возраст (годы)}] \times \text{масса тела (кг)}}{72 \times \text{КК}_{\text{сыворот}} (\text{мг/дл})}$$

Клиренс креатинина для женщин можно рассчитать, умножив полученное значение на коэффициент 0,85.

Почечная недостаточность	КК (мл/мин)	Режим дозирования
Норма	> 80	5 мг/сут
Легкая	50-79	5 мг/сут
Средняя	30-49	5 мг × 1 раз в 2 дня
Тяжелая	< 30	5 мг × 1 раз в 3 дня
Терминальная стадия - пациенты, находящиеся на диализе	< 10	Прием препарата противопоказан

Пациентам с почечной и печеночной недостаточностью дозирование осуществляется по таблице, приведенной выше. Если у пациента нарушена только функция печени, то коррекции режима дозирования не требуется.

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 препарата Левоцетиризин в лекарственной форме таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 5 мг, у взрослых пациентов длительностью до 6 месяцев.

Применяйте препарат только согласно тому способу применения и в тех дозах, которые указаны в инструкции.

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

Если после лечения улучшения не наступает или появляются новые симптомы, необходимо

проконсультироваться с врачом.

ПОБОЧНЫЕ ДЕЙСТВИЯ

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

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

Со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности, включая анафилаксию.

Со стороны метаболизма и расстройств питания: повышение аппетита.

Со стороны психики: тревога, агрессия, возбуждение, депрессия, галлюцинации, бессонница, суицидальные мысли.

Со стороны нервной системы: судороги, тромбоз синусов твердой мозговой оболочки, парестезия, головокружение, обморок, тремор, дисгевзия.

Со стороны слуха: вертиго

Со стороны органа зрения: нарушение зрения, нечеткость зрительного восприятия, воспалительные проявления.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: стенокардия, тахикардия, ощущение сердцебиения, тромбоз яремной вены.

Со стороны дыхательной системы: одышка, усиление симптомов ринита.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея.

Гепатобилиарные расстройства: гепатит, изменение функциональных проб печени.

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

Со стороны кожи и мягких тканей: ангионевротический отек, стойкая лекарственная эритема, зуд, сыпь, крапивница, гипотрихоз, трещины, фотосенсибилизация.

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

Общие расстройства: периферические отеки, увеличение массы тела.

Прочее: 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 передозировки: сонливость (у взрослых), возбуждение и беспокойство, сменяющиеся сонливостью (у детей).

Лечение передозировки: сразу после приема препарата внутрь необходимо промыть желудок или вызвать рвоту. Рекомендуется проведение симптоматической и поддерживающей терапии. Специфического антидота нет. Гемодиализ неэффективен.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ ПРЕПАРАТАМИ

Изучение взаимодействия левоцетиризина с другими 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).

При одновременном применении ритановира (600 мг 2 раза в день) и цетиризина (10 мг в день) показано в исследовании, что экспозиция цетиризина увеличивалась на 40%, а экспозиция ритановира незначительно изменялась (-11%).

В ряде случаев при одновременном применении 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.

В период лечения рекомендуется воздерживаться от употребления этанола (алкоголя).

Таблетки Левоцетиризин содержат лактозы моногидрат, поэтому их не следует назначать пациентам с непереносимостью лактозы, наследственным дефицитом лактазы или синдромом мальабсорбции глюкозы-галактозы.

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

Левосетиризин может привести к повышенной сонливости, следовательно, препарат может оказывать влияние на способность управлять автомобилем или работать с техникой. В период приема препарата Левосетиризин целесообразно воздерживаться от выполнения потенциально опасных видов работ, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторной реакции (в том числе вождение автомобиля и управление механизмами).

Форма выпуска

Таблетки покрытые пленочной оболочкой, 5 мг.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

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

Срок годности

3 года.

Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

При температуре не выше 25°C в оригинальной упаковке.

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска

Отпускают без рецепта.

Производитель

ЗАО «АЛСИ Фарма»

Претензии принимаются производителем по адресу:

Россия, 129272, Москва, Трифоновский тупик, дом 3.

Телефон: (495) 787-70-55.

Адрес места производства:

Россия, 610044, Кировская обл., г. Киров, ул. Луганская, дом 53 в.

**Генеральный директор
ЗАО «АЛСИ Фарма»**



Е.Н. Симмонс