

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Супрастинекс, 5 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: левоцетиризин

Каждая таблетка содержит 5 мг левоцетиризина дигидрохлорида. Вспомогательные вещества, наличие которых следует учитывать в составе лекарственного препарата: лактозы моногидрат (см.раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Белые или почти белые круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, с гравировкой «Е» на одной стороне таблетки и «281» на другой стороне, без или почти без запаха.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. 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.

4.2. Режим дозирования и способ применения**Режим дозирования**

Взрослые и дети старше 6 лет

Суточная доза составляет 5 мг (1 таблетка) однократно.

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) лечение может продолжаться в течение всего периода воздействия аллергенов.

Имеется клинический опыт непрерывного применения левоецетиризина в лекарственной форме таблетки покрытые пленочной оболочкой 5 мг у взрослых пациентов длительностью до 6 месяцев.

Пропуск приема препарата

В случае пропуска приема препарата не следует принимать двойную дозу для компенсации пропущенной. Следующая доза принимается в обычное время.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Коррекция дозы препарата у пациентов пожилого возраста, при условии нормальной функции почек, не требуется (см. пункт *Пациенты с почечной недостаточностью*).

Пациенты с нарушением функции почек

Пациентам с почечной недостаточностью режим дозирования препарата следует корректировать в зависимости от функции почек (скорости клубочковой фильтрации (СКФ)).

Дозирование у пациентов с почечной недостаточностью

Почечная недостаточность	СКФ (мл/мин)	Доза и частота приема препарата
Норма	≥ 90	5 мг 1 раз в день
Легкая	60 – 89	5 мг 1 раз в день
Средняя	30 – 59	5 мг через 2 дня
Тяжелая	15 – 29	5 мг через 3 дня
Терминальная стадия – пациенты, находящиеся на диализе	< 15	Прием препарата противопоказан

Пациенты с нарушением функции печени

Пациентам с нарушением только функции печени коррекции режима дозирования не требуется.

Пациенты с нарушением функции печени и функции почек

Пациентам с почечной и печеночной недостаточностью дозирование осуществляется по вышеприведенной схеме (см. пункт *Пациенты с почечной недостаточностью*).

Дети

Препарат противопоказан у детей в возрасте до 6 лет.

Режим дозирования у детей от 6 лет соответствует режиму дозирования у взрослых.

Способ применения

Внутрь, проглатывая целиком, во время еды или натощак, запивая небольшим количеством воды.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к левоцетиризину, цетиризину, гидроксизину, любому производному пиперазина или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.
- дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция
- терминальная стадия почечной недостаточности (СКФ < 15 мл/мин).
- детский возраст до 6 лет (см. разделы 4.2 и 4.4).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

При хронической почечной недостаточности (необходима коррекция режима дозирования).
У лиц 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. раздел 4.5).

Беременность и период грудного вскармливания (см. раздел 4.6).

Осторожность следует соблюдать у пациентов с эпилепсией и повышенной судорожной готовностью, поскольку левоцетиризин может вызывать обострение приступов.

Особые указания

Интервалы между дозами должны быть подобраны индивидуально в зависимости от функции почек.

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.

Осторожность следует соблюдать у пациентов с эпилепсией и повышенной судорожной готовностью, поскольку левоцетиризин может вызвать обострение приступов.

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

Возможно появление зуда после прекращения приема левоцетиризина, даже если подобных симптомов не было в начале лечения. Симптомы могут пройти самостоятельно. В некоторых случаях симптомы могут быть сильно выраженными, и это может потребовать возобновления лечения. После возобновления лечения эти симптомы должны пройти.

Препарат Супрастинекс таблетки, покрытые пленочной оболочкой, содержит лактозу, пациентам с редко встречающейся наследственной непереносимостью галактозы, полным дефицитом лактазы или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот препарат.

Дети

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

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Изучение взаимодействия левосетиризина с другими лекарственными препаратами 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/сут) общий клиренс цетиризина снижается на 16% (кинетика теофиллина не меняется).

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

У чувствительных пациентов одновременный прием левосетиризина и алкоголя или лекарственных препаратов, оказывающих подавляющее влияние на центральную нервную систему (ЦНС), может вызвать заторможенность и ухудшение работоспособности.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Данные по применению левосетиризина во время беременности практически отсутствуют или ограничены (менее 300 исходов беременностей). Однако применение цетиризина, рацемата левосетиризина, 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 беременности назначение левосетиризина может быть рассмотрено в случае необходимости.

Лактация

Цетиризин, рацемат левосетиризина, экскретируется с грудным молоком. Поэтому также вероятно и выделение левосетиризина с грудным молоком. У детей, находящихся на грудном вскармливании, возможно появление побочных реакций на левосетиризин. Поэтому необходимо соблюдать осторожность при назначении левосетиризина в период грудного вскармливания.

Фертильность

Клинические данные по левосетиризину отсутствуют.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Левосетиризин может привести к повышенной сонливости, и, следовательно, 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.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Данные по безопасности, полученные при изучении цетиризина

Наблюдались следующие нежелательные реакции (НР):

Редко ($\geq 1/10\,000$ но $\leq 1/1000$):

Встречались легкие и временные нежелательные реакции (НР), такие как утомляемость, нарушение концентрации, сонливость, головная боль, головокружение, возбуждение, сухость во рту и желудочно-кишечные расстройства (запор). В некоторых случаях наблюдались реакции гиперчувствительности и ангионевротический отек.

Также сообщалось об отдельных случаях судорог, реакции светочувствительности, поражении печени, анафилактического шока, нарушения кровообращения, глухоты, плохого самочувствия, зуда, васкулита, зрительных нарушений и кошмарных сновидений.

Данные клинических исследований

Клинические исследования показали, что у 14,7% пациентов, принимавших левосетиризин в дозе 5 мг наблюдались НР в сравнении с 11, 3% у пациентов группы плацебо. 95% НР были легкими или умеренно выраженными.

В клинических исследованиях частота прекращения терапии вследствие развития побочных реакций составила 0,7% (4/538) у пациентов, рандомизированных для получения левосетиризина в дозе 5 мг и 0,8% (3/382) для пациентов, рандомизированных в группу плацебо.

Следующие НР были выявлены у пациентов (n=538), участвовавших в клиническом исследовании и применявших левосетиризин в рекомендованных дозах (5 мг 1 раз в сутки):

Часто ($\geq 1/100$ но $< 1/10$):

НР	Левосетиризин 5 мг (n=538), %	Плацебо (n=382), %
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 левомецетиризина была выше, чем таковая в группе плацебо, в большинстве случаев эта НР была легкой или умеренной степени тяжести.

Нечасто ($\geq 1/1\ 000$, но $< 1/100$):

Боль в животе.

Пострегистрационный период

Нарушения со стороны иммунной системы:

реакции гиперчувствительности, включая анафилаксию

Нарушения метаболизма и питания:

повышение аппетита

Психические нарушения:

тревога, агрессия, возбуждение, бессонница, галлюцинации, депрессия, суицидальные идеи, кошмарные сновидения

Нарушения со стороны нервной системы:

судороги, тромбоз синусов твердой мозговой оболочки, парестезия, головокружение, вертиго, обморок, тремор, дисгевзия

Нарушения со стороны органа зрения:

нарушение зрения, нечеткость зрительного восприятия, воспалительные проявления, непроизвольные движения глазных яблок (нистагм)

Нарушения со стороны сердца:

стенокардия, тахикардия, ощущение сердцебиения

Нарушения со стороны сосудов:

тромбоз яремной вены

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:

усиление симптомов ринита, одышка

Желудочно-кишечные нарушения:

тошнота, рвота

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей:

гепатит

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

ангионевротический отек, экзантема, гипотрихоз, кожный зуд, кожная сыпь, трещины, крапивница, фотосенсибилизация/токсичность, стойкая лекарственная эритема

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани:

боль в мышцах, артралгия

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей:

дизурия, задержка мочи

Общие нарушения и реакции в месте введения:

неэффективность продукта и его взаимодействия, сухость слизистых оболочек, отек

Лабораторные и инструментальные данные

Увеличение массы тела, изменение функциональных проб печени, перекрестная реактивность

Описание отдельных НР

У небольшого количества пациентов наблюдался зуд после прекращения применения левоцетиризина.

Если любые указанные в инструкции побочные эффекты усугубляются, или Вы заметили другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, следует сообщить об этом врачу.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

109074, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Телефон: +7 (495) 698-45-38, +7 (499) 578-02-30

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт: <http://www.roszdravnadzor.gov.ru/>

Республика Казахстан:

010000, г. Нур-Султан, ул. А. Иманова, 13

«Национальный центр экспертизы лекарственных средств и медицинских изделий»

Комитета медицинского и фармацевтического контроля Министерства здравоохранения

Республики Казахстан

Телефон: +7 (7172) 78-99-11

Электронная почта: farm@dari.kz

<http://www.ndda.kz>

Республика Беларусь:

220045, г. Минск, пр-т Дзержинского, 83, корпус 15, 8 этаж

РУП «Центр экспертиз и испытаний в здравоохранении», Республиканская клинико-фармакологическая лаборатория

Телефон: +375-17-242-00-29

Электронная почта: rcpl@rceth.by

<http://www.rceth.by>

Республика Армения:

0051, г. Ереван, пр. Комитаса 49/4

«Научный центр экспертизы лекарств и медицинских технологий им. академика Э. Габриеляна» АОЗТ
Телефон: (+374 10) 23-16-82; Горячая линия (+374 10) 20-05-05;
Факс: (+374 10) 23-21-18
Электронная почта: vigilance@pharm.am
<http://www.pharm.am>

4.9. Передозировка

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

Лечение: необходимо промыть желудок или принять активированный уголь, если после приема препарата прошло мало времени. Рекомендуются проведение симптоматической и поддерживающей терапии. Специфического антидота нет. Гемодиализ не эффективен.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: антигистаминные средства системного действия; производные пиперазина.

Код АТХ: R06AE09

Механизм действия, фармакодинамические эффекты

Левосетиризин – активное вещество препарата Супрастинекс - это R-энантиомер цетиризина, мощный и селективный антагонист гистамина, блокирующий 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.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

После приема внутрь препарат быстро и полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ). Прием пищи не влияет на полноту всасывания, хотя снижает его скорость. Максимальная концентрация (C_{max}) в плазме крови достигается через 0,9 ч и составляет 270 нг/мл, равновесная концентрация достигается через 2 суток.

Распределение

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

Биотрансформация

В небольших количествах (<14%) метаболизируется в организме путем N- и O-деалкилирования (в отличие от других антагонистов H_1 -гистаминовых рецепторов, которые метаболизируются в печени с помощью системы цитохромов) с образованием фармакологически неактивного метаболита. Из-за незначительного метаболизма и отсутствия метаболического потенциала взаимодействие левосетиризина с другими лекарственными препаратами представляется маловероятным.

Элиминация

У взрослых период полувыведения ($T_{1/2}$) составляет $7,9 \pm 1,9$ ч; 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.

Линейность

Фармакокинетические параметры левосетиризина изменяются линейно.

Пациенты с почечной недостаточностью

Кажущийся общий клиренс левосетиризина коррелирует с клиренсом креатинина (КК). Поэтому у пациентов с почечной недостаточностью средней и тяжелой степени тяжести режим дозирования препарата следует корректировать (см. подраздел «Пациенты с нарушением функции почек» раздела 4.2.)

У пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности общий клиренс снижается на 80% относительно здоровых добровольцев с нормальной функцией почек. Менее 10% левосетиризина удаляется в ходе стандартной 4-часовой процедуры гемодиализа.

Пациенты с печеночной недостаточностью
Фармакокинетика левосетиризина у пациентов с печеночной недостаточностью не изучалась. У пациентов с хроническими заболеваниями печени (гепатоцеллюлярный, холестатический и 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 людьми.

Пожилые пациенты

Данные по фармакокинетике у пациентов пожилого возраста ограничены. При повторном приеме левосетиризина в дозе 30 мг 1 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 левосетиризину, так как оба препарата - и левосетиризин, и цетиризин - выводятся преимущественно с мочой. Поэтому у пациентов пожилого возраста доза левосетиризина должна быть скорректирована в зависимости от функции почек.

Дети

Данные по исследованию фармакокинетики препарата у 14-и 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 фармакокинетической кривой «концентрация-время» (AUC) примерно в 2 раза превышают аналогичные показатели у взрослых здоровых людей при перекрестном контроле. Средний показатель $C_{\max}$ составил 450 нг/мл, $C_{\max}$ 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 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, соответствующей таковой у взрослых при приеме 5 мг препарата 1 раз в сутки.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

целлюлоза кремниевая микрокристаллическая (Prosolv® HD90) (целлюлоза микрокристаллическая (98 %))

кремния диоксид коллоидный безводный (2 %)

лактозы моногидрат

гипролоза низкозамещенная (L-NPC 11)

магния стеарат

Оболочка:

Опадрай II 33G28523 белый:

гипромеллоза 2910 (40 %)

титана диоксид (25 %)

лактозы моногидрат (21 %)

макрогол 3350 (8 %)

триацетин (6 %)

6.2. Несовместимость

Не применимо

6.3. Срок годности (срок хранения)

5 лет

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 30 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 7 или 10 таблеток в блистере из полиамид/алюминиевая фольга/ПВХ//алюминиевая фольга. 1 или 2 блистера (по 7 таблеток) или 1, 2 или 3 блистера (по 10 таблеток) упакованы вместе с листком-вкладышем в картонную пачку.

6.6 Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Венгрия

ЗАО «Фармацевтический завод ЭГИС»

1106 Будапешт, ул. Керестури 30-38

Телефон: (36-1) 803-5555

Факс: (36-1) 803-5529

Электронная почта: mailbox@egis.hu

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ООО «ЭГИС-РУС»

121552, г. Москва, ул. Ярцевская 19, Блок В, этаж 13.

Тел: +7 (495) 363-39-66.

Факс: +7 (495) 223-01-50.

Адрес электронной почты: moscow@egis.ru.

Республика Казахстан

Представительство ЗАО «Фармацевтический завод ЭГИС» в Республике Казахстан

050060, г. Алматы, ул. Жарокова 286 Г.

Телефон: + 7 (727) 247 63 34, + 7 (727) 247 63 33.

Факс: + 7 (727) 247 61 41.

Электронная почта: egis@egis.kz

Республика Беларусь

Представительство ЗАО «Фармацевтический завод ЭГИС» в Республике Беларусь

220053, г. Минск, пер. Ермака, д. 6А.

Телефон: (017) 380-00-80, (017) 227-35-51, (017) 227-35-52.

Факс: (017) 227-35-53.

Электронная почта: info@egis.by

Республика Армения

Представительство ЗАО «Фармацевтический завод ЭГИС» в Республике Армения

0010, г. Ереван, ул. Анрапетутян, дом 67, 4 этаж.

Телефон: +374-10-574509, +374-10-574686.

Электронная почта: info@egis.am

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

ЛП-№(001304)-(PG-RU)

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации: 12.10.2022

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Супрастинекс доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://eec.eaeunion.org/>.