

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

Зодак Экспресс, 5 мг, таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: левоцетиризин.

Каждая таблетка содержит 5 мг левоцетиризина дигидрохлорида.

Вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: лактоза (см. разделы 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Продолговатые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, от белого до почти белого цвета, с гравировкой «е» на одной стороне.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

Лекарственный препарат Зодак Экспресс показан к применению у взрослых и детей в возрасте от 6 лет и старше для лечения:

- симптомов аллергического ринита (включая круглогодичный (персистирующий) и сезонный (интермиттирующий) аллергический ринит) и аллергического конъюнктивита, таких как зуд, чихание, заложенность носа, ринорея, слезотечение, гиперемия конъюнктивы;
- поллиноза (сенной лихорадки);
- крапивницы;
- других аллергических дерматозов, сопровождающихся кожным зудом и высыпаниями.

4.2. Режим дозирования и способ примененияРежим дозирования*Взрослые*

Суточная доза составляет 5 мг (1 таблетка) однократно.

Особые группы пациентов*Пациенты пожилого возраста*

Коррекция дозы у пациентов пожилого возраста при условии нормальной функции почек не требуется.

Пациенты с почечной недостаточностью

Пациентам с почечной недостаточностью режим дозирования препарата следует

корректировать в зависимости от функции почек (скорость клубочковой фильтрации [СКФ]).

Дозирование у пациентов с почечной недостаточностью:

Почечная недостаточность	СКФ (мл/мин)	Режим дозирования
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 (не требующие диализа)	5 мг через 3 дня
Терминальная стадия — пациенты, находящиеся на диализе	< 15	Прием препарата противопоказан

Пациенты с нарушением функции печени

У пациентов с нарушением только функции печени коррекция режима дозирования не требуется.

У пациентов с нарушением функции печени и функции почек рекомендуется коррекция дозирования (см. таблицу выше).

Продолжительность приема препарата

При лечении сезонного (интермиттирующего) аллергического 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 левоцетиризина в лекарственной форме таблеток, покрытых пленочной оболочкой, 5 мг, длительностью до 6 месяцев у взрослых пациентов.

Пропуск приема препарата

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

Дети

Дети от 0 до 6 лет

Препарат Зодак Экспресс в данной лекарственной форме не следует назначать детям в

возрасте от 0 до 6 лет в связи с невозможностью обеспечить режим дозирования.

Дети старше 6 лет

Режим дозирования для детей от 6 лет не отличается от режима дозирования для взрослых.

Способ применения

Для приема внутрь. Таблетку следует принимать целиком, не разжевывая, запивая необходимым количеством жидкости, независимо от приема пищи.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к левоцетиризину, цетиризину, гидроксизину, любому производному пиперазина или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- терминальная стадия почечной недостаточности (скорость клубочковой фильтрации [СКФ] менее 15 мл/мин);

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Интервалы между приемами препарата должны быть подобраны индивидуально в зависимости от почечной функции.

Рекомендуется соблюдать осторожность при одновременном приеме 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 вызывать обострение приступов.

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

Возможно появление зуда после прекращения приема левоцетиризина, даже если эти симптомы отсутствовали до начала лечения. Симптомы могут пройти самостоятельно. В некоторых случаях симптомы могут быть сильно выраженными и может потребоваться возобновление лечения до исчезновения данных симптомов.

Дети

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

Вспомогательные вещества

Препарат содержит лактозы моногидрат. Пациентам с редко встречающейся

наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы лопарей или глюкозо-галактозной мальабсорбцией не следует принимать этот препарат.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Изучение взаимодействия левоцетиризина с другими лекарственными препаратами не проводили. При изучении лекарственного взаимодействия рацемата цетиризина с азитромицином, циметидином, диазепамом, феназоном, эритромицином, глипизидом, кетоконазолом и псевдоэфедрином клинически значимых нежелательных взаимодействий не выявлено.

При одновременном назначении с теофиллином (400 мг в сутки) 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 изменялась незначительно (-11%).

У чувствительных пациентов одновременный прием левоцетиризина 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 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 беременности назначение левоцетиризина может быть рассмотрено в случае необходимости.

Лактация

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.

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

Левосетеризин может привести к повышенной сонливости, следовательно, он может оказывать влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами. В период лечения необходимо воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

Данные по безопасности, полученные при изучении цетиризина

Наблюдались следующие нежелательные реакции:

Редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$):

Встречались легкие и временные нежелательные явления, 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, поражения печени, анафилактического шока, нарушения кровообращения, глухоты, плохого самочувствия, зуда, васкулита, зрительных нарушений и кошмарных сновидений.

Данные клинических исследований

Клинические исследования показали, что нежелательные реакции наблюдали у 14,7% пациентов, принимавших левоцетиризин в дозе 5 мг, в сравнении с 11,3% у пациентов группы плацебо. 95% данных нежелательных реакций были легкими или умеренно выраженными.

В клинических исследованиях частота прекращения терапии вследствие развития нежелательных 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 один раз в сутки):

С частотой 1–10%:

<i>Нежелательные реакции</i>	<i>Левосетиризин, 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 левосетиризина была выше, чем в группе плацебо, в большинстве случаев это нежелательное явление было легкой или умеренной степени тяжести.

Нечасто (0,1–1%):

Боль в животе.

Пострегистрационные исследования

В период пострегистрационного применения препарата наблюдали следующие нежелательные реакции:

Нарушения со стороны иммунной системы:

Реакции гиперчувствительности, включая анафилаксию.

Нарушения метаболизма и питания:

Повышение аппетита.

Психические расстройства:

Тревога, агрессия, возбуждение, галлюцинации, депрессия, бессонница, 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:

Воспалительные проявления, нарушение зрения, нечеткость зрительного восприятия, 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:

Одышка, усиление симптомов ринита.

Нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки:

Ангioneвротический отек, экзантема, гипотрихоз, зуд, сыпь, трещины, крапивница, фотосенсибилизация/токсичность, стойкая лекарственная эритема.

Желудочно-кишечные нарушения:

Тошнота, рвота.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей:

Гепатит.

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 препарата и его лекарственные взаимодействия, сухость слизистых оболочек, отек.

Лабораторные и инструментальные данные:

Увеличение массы тела, изменение функциональных проб печени, перекрестная реактивность.

Описание отдельных нежелательных реакций

У малого количества пациентов наблюдали зуд после прекращения приема левоцетиризина.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного 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

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения

Российская Федерация, 109012, г. Москва, Славянская пл., д. 4, стр. 1

Тел.: +7 800 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

<https://roszdravnadzor.gov.ru>

4.9. Передозировка

Симптомы

Сонливость (у взрослых); вначале могут появиться возбуждение и беспокойство, затем сменяющиеся сонливостью (у детей).

Лечение

Необходимо провести промывание желудка 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 и фармакодинамические эффекты

Левосетиризин (активное вещество препарата Зодак Экспресс) — это R-энантиомер цетиризина, мощный и селективный антагонист гистамина, блокирующий H_1 -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. Прием пищи не влияет на полноту всасывания, хотя снижает его скорость. Максимальная концентрация (C_{max}) в плазме крови 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 (V_d) составляет 0,4 л/кг. Биодоступность достигает 100%.

Биотрансформация

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.

Элиминация

Период полувыведения (T_{1/2}) у взрослых составляет 7,9 ± 1,9 часа. 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 левоцетиризина изменяются линейно.

Пациенты с почечной недостаточностью

Кажущийся общий клиренс левоцетиризина коррелирует с клиренсом креатинина. Поэтому у пациентов с почечной недостаточностью средней и тяжелой степени тяжести режим дозирования препарата следует корректировать (см. раздел 4.2.).

У пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности в сравнении со здоровыми добровольцами с нормальной функцией почек общий клиренс снижается на 80%. Менее 10% левоцетиризина удаляется в ходе стандартной 4-часовой процедуры гемодиализа.

Пациенты с печеночной недостаточностью

Фармакокинетику левоцетиризина у пациентов с печеночной недостаточностью не изучали. У пациентов с хроническими заболеваниями печени (гепатоцеллюлярный, холестатический и билиарный цирроз), получавших рацемическое соединение цетиризина в дозе 10 или 20 мг однократно, наблюдали увеличение периода полувыведения на 50% и снижение клиренса препарата на 40% по сравнению со здоровыми людьми.

Лица пожилого возраста

Данные по фармакокинетики 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 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.

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 однократном пероральном приеме 5 мг левоцетиризина продемонстрировали, 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. Специальные фармакокинетические исследования у детей младше 6 лет не проводили. 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 один раз в сутки.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Лактозы моногидрат,
целлюлоза микрокристаллическая,
карбоксиметилкрахмал натрия,
кремния диоксид коллоидный,
магния стеарат,
пленочная оболочка: гипромеллоза 2910/5, макрогол 6000, тальк, титана диоксид Е-171.

6.2. Несовместимость

Неприменимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание упаковки

По 7 или 10 таблеток в PVC/PE/PVDC/Al или PVC/Aclar/PVDC/AL блистер. По 1 или 4 блистера по 7 таблеток; по 2 блистера по 10 таблеток вместе с листком-вкладышем помещают в картонную пачку.

Не все размеры упаковок могут быть доступны для реализации.

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

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Россия

ООО «Опелла Хелскеа»

125375, г. Москва, ул. Тверская, д. 22

Тел.: +7 495 721-14-00

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

ЛП-№(009786)-(PG-RU)

9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лекарственный препарат относится к категории отпуска без рецепта.

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