

УТВЕРЖДЕНО
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
12.07.13 № 593
Регистрационное удостоверение
№ UA/8612/01/01

ИЗМЕНЕНИЯ ВНЕСЕНЫ
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
23.01.14 № 67

ИНСТРУКЦИЯ
для медицинского применения препарата

L-ЦЕТ®

Состав лекарственного средства:

действующее вещество: levocetirizine dihydrochloride;

1 таблетка, покрытая оболочкой, содержит левоцетиризина дигидрохлорида 5 мг;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, натрия кроскармеллоза, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат, покрытие Opadry II 85G 51300 зеленый*;

* Opadry II 85G 51300 зеленый: спирт поливиниловый, тальк, титана диоксид (E 171), полиэтиленгликоль, лецитин, индигокармин (E 132), хинолиновый желтый (E 104), желтый запад FCF (E 110).

Лекарственная форма. Таблетки, покрытые оболочкой.

Круглые, двояковыпуклые таблетки, покрытые оболочкой зеленого цвета.

Название и месторасположение производителя.

КУСУМ ХЕЛТХКЕР ПВТ ЛТД/

KUSUM HEALTHCARE PVT LTD.

СП-289 (А), РИИКО Индастриал ареа, Чопанки, Бхивади, Дист. Алвар (Раджастан), Индия/

SP-289 (A), RIICO Industrial area, Chopanki, Bhiwadi, Dist. Alwar (Rajasthan), India

Фармакотерапевтическая группа.

Антигистаминные средства для системного применения. Код АТС R06A E09.

Левецетиризин - это активный стабильный R- энантиомер цетиризина, который относится к группе конкурентных антагонистов H₁-гистаминовых рецепторов. Сродство относительно H₁-гистаминовых рецепторов у левецетиризина в 2 раза выше, чем у цетиризина. Влияет на гистаминзависимую стадию развития аллергической реакции, уменьшает миграцию эозинофилов, проницаемость сосудов, ограничивает высвобождение медиаторов воспаления. Предупреждает развитие и облегчает течение аллергических реакций, оказывает антиэкссудативное, противозудное, противовоспалительное действие, почти не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия. В терапевтических дозах практически не оказывает седативного действия.

Фармакокинетические параметры левецетиризина меняются линейно и почти не отличаются от таковых у цетиризина.

Всасывание. Левоцетиризин быстро всасывается после приема внутрь. Прием пищи не влияет на степень всасывания, но снижает его скорость. Биодоступность достигает 100 %. У 50 % больных, действие препарата развивается через 12 минут после приема однократной дозы, а у 95 % - через 0,5-1 час.

Максимальная концентрация (C_{max}) достигается через 50 минут после однократного приема и сохраняется 2 дня.

Распределение. Отсутствует информация о распределении препарата в тканях человека, а также о проникновении левоцетиризина через гематоэнцефалический барьер. В ходе исследований на животных, наибольшая концентрация была зафиксирована в печени и почках, а самая низкая - в тканях центральной нервной системы. Объем распределения - 0,4 л/кг. Связывание с белками плазмы крови – 90 %.

Биотрансформация. В организме человека метаболизму подвергается около 14 % левоцетиризина. Процесс метаболизма включает оксидацию, N- и O-деалкилирование и сообщение с таурином. Деалкилирование в первую очередь происходит с участием цитохрома CYP 3A4, в то время как в процессе окисления задействован целый ряд цитохромных изоформ. Левоцетиризин не влияет на активность цитохромных изоферментов 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4 в концентрациях, которые даже превышают максимальные после приема 5 мг перорально. Поскольку степень метаболизма низкая и не усиливает угнетающее действие, взаимодействие левоцетиризина с другими веществами (и наоборот) маловероятно.

Выведение. Экскреция препарата происходит в основном за счет клубочковой фильтрации и активной канальцевой секреции. Период полувыведения ($T_{1/2}$) у взрослых составляет $7,9 \pm 1,9$ часа, общий клиренс - 0,63 мл/мин/кг. 85,4 % дозы выводится в неизменном виде с мочой, около 12,9 % - с калом.

У больных с нарушениями функции почек (клиренс креатинина < 40 мл/мин) клиренс препарата уменьшается, а $T_{1/2}$ удлиняется (таким образом, у больных, которые находятся на гемодиализе, общий клиренс уменьшается на 80 %), а это требует подбора соответствующего режима дозирования. При проведении стандартного 4-часового гемодиализа, выводится незначительная часть (менее 10 %) левоцетиризина.

Показания к применению.

Симптоматическое лечение аллергических ринитов, в том числе круглогодичных аллергических ринитов, хроническая идиопатическая крапивница.

Противопоказания.

Повышенная чувствительность к левоцетиридину, других производных пиперазина или к любому другому компоненту препарата.

Тяжелая хроническая почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 10 мл/мин).

Соответствующие меры предосторожности при применении.

Не следует превышать рекомендуемую дозу.

С осторожностью применять пациентам с хронической почечной недостаточностью (требуется корректировка режима дозирования); пациентам пожилого возраста с хронической почечной недостаточностью (возможно снижение клубочковой фильтрации). При применении препарата следует воздерживаться от употребления алкоголя. Прием пищи не влияет на степень всасывания препарата, но снижает скорость абсорбции.

При наличии у пациентов определенных факторов, которые провоцируют задержку мочи (например, травмы спинного мозга, гиперплазия предстательной железы), необходимо уделить особое внимание при назначении препарата, поскольку левоцетиридин может увеличить риск задержки мочи.

Особые предостережения.

Применение в период беременности или кормления грудью.

В период беременности применение левоцетиризина противопоказано. Цетиризин проникает в грудное молоко, поэтому в случае возникновения необходимости применения препарата, кормление грудью следует прекратить.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами.

Следует воздерживаться от управления транспортными средствами или работы с другими механизмами на период лечения.

Дети.

Применение препарата в виде таблеток не рекомендуется детям до 6 лет, поскольку эта лекарственная форма не позволяет проводить необходимую корректировку режима дозирования.

Способ применения и дозы.

Препарат назначать взрослым и детям старше 6 лет внутрь при суточной дозе 5 мг 1 раз в сутки. Принимать таблетку независимо от приема пищи. Таблетку необходимо глотать целиком, запивая небольшим количеством воды.

Больным пожилого возраста с нормальной функцией почек корректировка дозы препарата не требуется.

Больным с нарушенной функцией почек расчет дозы необходимо проводить с учетом клиренса креатинина согласно таблице.

Для применения этой таблицы дозирования, необходимо оценить клиренс креатинина (КЛкр) пациента в мл/мин. КЛкр (мл/мин) должен быть оценен по содержанию креатинина в сыворотке крови (мг/дл) с помощью следующей формулы:

$$\text{КЛкр} = \frac{[140 - \text{возраст (года)}] \times \text{масса тела (кг)}}{72 \times \text{креатинин сыворотки крови (мг/дл)}} \quad (\times 0,85 \text{ для женщин})$$

Корректировка дозы препарата больным с нарушенной функцией почек:

Функция почек	Клиренс креатинина, мл/мин	Доза и количество приемов
Нормальная функция почек	≥ 80	5 мг 1 раз в сутки
Нарушение легкой степени	50-79	5 мг 1 раз в сутки
Нарушение умеренной степени	30-49	5 мг 1 раз в 2 суток
Нарушение тяжелой степени	<30	5 мг 1 раз в 3 дня
Конечная стадия заболевания почек Пациенты, которые находятся на диализе	<10	Противопоказано

Больным детского возраста с нарушениями функции почек дозу препарата следует корректировать индивидуально с учетом почечного клиренса пациента и его массы тела.

Больным с печеночной недостаточностью коррекция режима дозирования не требуется. Больным с печеночной и почечной недостаточностью, режим дозирования корректируют в соответствии с вышеприведенной таблицей.

Длительность применения: пациентов с периодическим аллергическим ринитом (продолжительность симптомов заболевания составляет <4 дней в неделю или в течение менее 4 недель) следует лечить в соответствии с заболеванием и анамнезом; в случае исчезновения симптомов лечение можно прекратить, или восстановить вновь при их повторном возникновении. В случае устойчивого аллергического ринита (продолжительность симптомов заболевания

составляет > 4 дней в неделю и в течение более 4 недель) в период контакта с аллергенами пациенту может быть предложена постоянная терапия. При хронических заболеваниях (хронический аллергический ринит, хроническая крапивница) продолжительность лечения составляет до 1 года.

Передозировка.

Симптомы: симптомы передозировки могут включать сонливость у взрослых и начальное возбуждение и повышенную раздражительность с последующей сонливостью у детей.

Лечение. Специфического антидота для левоцетиризина нет. В случае появления симптомов передозировки рекомендуется симптоматическая и поддерживающая терапия. Следует рассмотреть необходимость промывания желудка через короткое время после приема препарата. Гемодиализ для вывода левоцетиризина из организма не эффективен.

Побочные эффекты.

Неврологические расстройства: головная боль, повышенная утомляемость, слабость, астения, судороги, парестезии, головокружение, вертиго, обморок, тремор, дисгевзия.

Психические расстройства: сонливость, нарушение сна, возбуждение, галлюцинации, депрессия, агрессия, бессонница, суицидальные мысли.

Со стороны сердечно - сосудистой системы : тахикардия , усиленное сердцебиение .

Со стороны органов зрения : нечеткость зрения.

Со стороны пищеварительной системы: гепатит .

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

Со стороны иммунной системы : гиперчувствительность, в том числе анафилаксия .

Со стороны системы крови и лимфатической системы: тромбоцитопения.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: одышка .

Со стороны желудочно - кишечного тракта : повышение аппетита, диарея, рвота, запор, сухость во рту, тошнота, боль в животе .

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: ангионевротический отек, устойчивые медикаментозные высыпания, зуд, сыпь, крапивница .

Со стороны костно - мышечной системы , соединительной ткани и костей: миалгия .

Прочие: увеличение массы тела, отклонение от нормы функциональных печеночных проб.

Общие нарушения и состояние в месте введения: отек .

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Одновременное применение с антипирином, псевдоэфедрином , циметидином, кетоконазолом, эритромицином, азитромицином , глипезидом или диазепамом не оказывает клинически значимых неблагоприятных взаимодействий . Совместное применение с теофиллином (400 мг/сут) снижает клиренс левоцетиризина на 16 % , при этом кинетика теофиллина не изменяется. При исследовании многократного введения ритонавира (600 мг 2 раза в сутки) и цетиризина (10 мг) степень экспозиции цетиризина увеличивалась примерно на 40 % , тогда как распределение ритонавира несколько менялось (- 11 %) до параллельного введения цетиризина .

Одновременное применение левоцетиризина с препаратами, которые подавляют функцию ЦНС (транквилизаторы, трициклические антидепрессанты, ингибиторы МАО) и алкоголем может вызвать сонливость.

Нет данных об усилении действия седативных средств, при использовании левоцетиризина в терапевтических дозах. Но следует избегать использования седативных средств, при применении препарата.

Прием пищи не влияет на степень всасывания препарата, но снижает скорость абсорбции.

Срок годности. 3 года.

Условия хранения.

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка.

По 10 таблеток в блистере, по 1 или 3 или 10 блистеров в картонной упаковке.

Категория отпуска. Без рецепта.

Дата последнего пересмотра. 23.01.2014 № 67