

ЗАТВЕРДЖЕНО
Наказ Міністерства охорони
здоров'я України
12.07.13 № 593
Реєстраційне посвідчення
№ UA/8612/01/01

ЗМІНИ ВНЕСЕНО
Наказ Міністерства охорони
здоров'я України
23.01.14 № 67

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

L-ЦЕТ®

Склад лікарського засобу:

діюча речовина: levocetirizine dihydrochloride;

1 таблетка, вкрита оболонкою, містить левоцетиризину дигідрохлориду 5 мг;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, натрію кроскармелоза, магнію стеарат, кремнію діоксид колоїдний безводний, Opadry II 85G51300 зелений*;

*Opadry II 85G51300 зелений: спирт полівініловий, тальк, титану діоксид (E 171), поліетиленгліколь, лецитин, індигокармін (E 132), хіноліновий жовтий (E 104), жовтий захід FCF (E 110).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті оболонкою.

Круглі двоопуклі таблетки, вкриті оболонкою зеленого кольору.

Назва і місцезнаходження виробника.

КУСУМ ХЕЛТХКЕР ПБТ ЛТД/

KUSUM HEALTHCARE PVT LTD.

СП-289 (А), РІІКО Індастріал ареа, Чопанкі, Бхіваді, Діст. Алвар (Раджастан), Індія/

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

Фармакотерапевтична група.

Антигістамінні засоби для системного застосування. Код АТС R06A E09.

Левоцетиризин – це активний стабільний R-енантіомер цетиризину, що належить до групи конкурентних антагоністів H₁-гістамінових рецепторів. Спорідненість до H₁-гістамінових рецепторів у левоцетиризину у 2 рази вища, ніж у цетиризину. Впливає на гістамінзалежну стадію розвитку алергічної реакції, зменшує міграцію еозинофілів, судинну проникність, обмежує вивільнення медіаторів запалення. Попереджає розвиток та полегшує перебіг алергічних реакцій, чинить антиексудативну, протисвербіжну, протизапальну дію, майже не чинить антихолінергічної і антисеротонінової дії. У терапевтичних дозах майже не виявляє седативного ефекту.

Фармакокінетичні параметри левоцетиризину змінюються лінійно і майже не відрізняються від таких у цетиризину.

Всмоктування. Левоцетиризин швидко всмоктується після застосування внутрішньо. Прийом їжі не впливає на ступінь всмоктування, але знижує його швидкість. Біодоступність досягає 100 %. У

50 % хворих дія препарату розвивається через 12 хвилин після прийому одноразової дози, а у 95 % – через 0,5-1 годину.

Максимальна концентрація (C_{\max}) досягається через 50 хвилин після одноразового прийому та утримується 2 дні.

Розподіл. Відсутня інформація щодо розподілу препарату у тканинах людини, а також щодо проникнення левоцетиризину крізь гематоенцефалічний бар'єр. У ході досліджень на тваринах найбільша концентрація зафіксована у печінці та нирках, а найнижча – у тканинах центральної нервової системи. Об'єм розподілу – 0,4 л/кг. Зв'язування з білками плазми крові – 90 %.

Біотрансформація. В організмі людини метаболізму піддається близько 14 % левоцетиризину. Процес метаболізму включає окисдацію, N- та O-деалкілювання і сполучення з таурином. Деалкілювання у першу чергу відбувається з участю цитохрому CYP 3A4, у той час як у процесі окиснення задіяна ціла низка цитохромних ізоформ. Левоцетирин не впливає на активність цитохромних ізоферментів 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4 у концентраціях, що навіть перевищують максимальні після прийому дози 5 мг перорально. Оскільки ступінь метаболізму низький та немає посилення пригнічувальної дії, взаємодія левоцетиризину з іншими речовинами (і навпаки) малоімовірна.

Виведення. Екскреція препарату відбувається в основному за рахунок клубочкової фільтрації та активної каналцевої секреції. Період напіввиведення ($T_{1/2}$) у дорослих становить $7,9 \pm 1,9$ години, загальний кліренс – 0,63 мл/хв/кг. 85,4 % дози препарату виводиться у незміненому вигляді із сечею, близько 12,9 % – з фекаліями.

У хворих із порушеннями функції нирок (кліренс креатиніну < 40 мл/хв) кліренс препарату зменшується, а $T_{1/2}$ подовжується (так, у хворих, які перебувають на гемодіалізі, загальний кліренс зменшується на 80 %), а це потребує підбору відповідного режиму дозування. При проведенні стандартного 4-годинного гемодіалізу видаляється незначна частина (менше 10 %) левоцетиризину.

Показання для застосування.

Симптоматичне лікування алергічних ринітів, у тому числі цілорічних алергічних ринітів; хронічна ідіопатична кропив'янка.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до левоцетиризину, інших похідних піперазину або до будь-якого іншого компонента препарату.

Тяжка хронічна ниркова недостатність (кліренс креатиніну менше 10 мл/хв).

Належні заходи безпеки при застосуванні.

Не слід перевищувати рекомендовану дозу.

З обережністю застосовувати пацієнтам з хронічною нирковою недостатністю (потрібна корекція режиму дозування); пацієнтам літнього віку з хронічною нирковою недостатністю (можливе зниження клубочкової фільтрації). Під час застосування препарату слід утримуватися від вживання алкоголю. Прийом їжі не впливає на ступінь всмоктування препарату, але знижує швидкість його абсорбції.

При наявності у пацієнтів певних факторів, що провокують затримку сечі (наприклад, травми спинного мозку, гіперплазія передміхурової залози) необхідно приділити увагу при призначенні препарату, оскільки левоцетирин може збільшити ризик затримки сечі.

Особливі застереження.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Левоцетирин протипоказаний для застосування у період вагітності. Цетирин проникає у грудне молоко, тому при необхідності застосування препарату годування груддю слід припинити.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Слід утримуватися від керування автотранспортом або роботи з іншими механізмами на період лікування препаратом.

Діти.

Застосування препарату у вигляді таблеток не рекомендується дітям віком до 6 років, оскільки ця лікарська форма не дає змоги проводити необхідну корекцію режиму дозування.

Спосіб застосування та дози.

Препарат призначати дорослим та дітям віком від 6 років внутрішньо у добовій дозі 5 мг 1 раз на добу. Приймати таблетку незалежно від прийому їжі. Таблетку необхідно ковтати цілою, запиваючи невеликою кількістю води.

Хворим літнього віку з нормальною функцією нирок корекція дози препарату не потрібна.

Хворим із порушеною функцією нирок розрахунок дози необхідно проводити з урахуванням кліренсу креатиніну відповідно до таблиці.

Для застосування цієї таблиці дозування необхідно оцінити кліренс креатиніну (КЛ_{кр}) пацієнта у мл/хв. КЛ_{кр} (мл/хв) має бути оцінений за вмістом креатиніну у сироватці крові (мг/дл) за допомогою наступної формули:

$$\text{КЛ}_{\text{кр}} = \frac{[140 - \text{вік (роки)}] \times \text{маса тіла (кг)}}{72 \times \text{креатинін сироватки крові (мг/дл)}} \quad (\times 0,85 \text{ для жінок})$$

Корекція дози препарату хворим із порушеною функцією нирок:

Функція нирок	Кліренс креатинін, мл/хв	Доза і кількість прийомів
Нормальна функція нирок	≥ 80	5 мг 1 раз на добу
Порушення легкого ступеня	50-79	5 мг 1 раз на добу
Порушення помірного ступеня	30-49	5 мг 1 раз на 2 доби
Порушення тяжкого ступеня	< 30	5 мг 1 раз на 3 доби
Кінцева стадія захворювання нирок Пацієнти, які перебувають на діалізі	< 10	Протипоказано

Хворим дитячого віку, із порушеннями функції нирок дозу препарату слід коригувати індивідуально з урахуванням ниркового кліренсу пацієнта та його маси тіла.

Хворим із печінковою недостатністю корекція режиму дозування не потрібна. Хворим із печінковою та нирковою недостатністю коригують режим дозування відповідно до наведеної вище таблиці.

Тривалість застосування: пацієнтів із періодичним алергічним ринітом (тривалість симптомів захворювання становить < 4 дні на тиждень або протягом менше 4 тижнів) слід лікувати відповідно до захворювання та анамнезу; лікування можна припинити, якщо симптоми зникнуть, та можна відновити знову при повторному виникненні симптомів. У разі стійкого алергічного риніту (тривалість симптомів захворювання становить > 4 дні на тиждень та протягом більше 4 тижнів) у період контакту з алергенами пацієнту може бути запропонована постійна терапія. При хронічних захворюваннях (хронічний алергічний риніт, хронічна кропив'янка) тривалість лікування становить до 1 року.

Передозування.

Симптоми: симптоми передозування можуть включати сонливість у дорослих та початкове збудження і підвищену дратівливість з наступною сонливістю у дітей.

Лікування. Специфічного антидоту до левоцетиризину немає. У випадку появи симптомів передозування рекомендується симптоматична та підтримуюча терапія. Слід розглянути

необхідність промивання шлунка через короткий час після прийому препарату. Гемодіаліз для виведення левоцетиризину з організму не ефективний.

Побічні ефекти.

Неврологічні розлади: головний біль, підвищена втомлюваність, слабкість, астенія, судоми, парестезія, запаморочення, вертиго, непритомність, тремор, дисгевзія.

Психічні розлади: сонливість, порушення сну, збудження, галюцинації, депресія, агресія, безсоння, суїцидальні думки.

З боку серцево-судинної системи: тахікардія, посилене серцебиття.

З боку органів зору: нечіткість зору.

З боку гепатобіліарної системи: гепатит.

З боку нирок та сечовидільної системи: дизурія, затримка сечі.

З боку імунної системи: гіперчутливість, у тому числі анафілаксія.

З боку системи крові та лімфатичної системи: тромбоцитопенія.

З боку дихальної системи, органів грудної клітки та середостіння: задишка.

З боку шлунково-кишкового тракту: підвищення апетиту, діарея, блювання, запор, сухість у роті, нудота, біль у животі.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: ангіоневротичний набряк, стійкі медикаментозні висипання, свербіж, висипання, кропив'янка.

З боку скелетно-м'язової системи, сполучної тканини та кісток: міалгія.

Інші: збільшення маси тіла, відхилення функціональних печінкових проб від нормальних значень.

Загальні порушення та стан у місці введення: набряк.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Одночасне застосування з антипірином, псевдоефедрином, циметидином, кетоконазолом, еритроміцином, азитроміцином, гліпезидом або діазепамом не чинить клінічно значущих несприятливих взаємодій. Сумісне застосування з теофіліном (400 мг/добу) знижує загальний кліренс левоцетиризину на 16 %, при цьому кінетика теофіліну не змінюється. При дослідженні багаторазового введення ритонавіру (600 мг 2 рази на добу) та цетиризину (10 мг на добу) ступінь експозиції цетиризину збільшувався приблизно на 40 %, тоді як розподіл ритонавіру дещо змінювався (- 11 %) до паралельного введення цетиризину.

Одночасне застосування левоцетиризину з препаратами, що пригнічують функцію центральної нервової системи (транквілізатори, трициклічні антидепресанти, інгібітори MAO) та алкоголю може спричинити сонливість.

Немає даних про посилення ефекту седативних засобів при використанні левоцетиризину в терапевтичних дозах. Але слід уникати використання седативних засобів під час застосування препарату.

Прийом їжі не впливає на ступінь всмоктування препарату, але знижує швидкість його абсорбції.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері; по 1 або 3 або 10 блістерів у картонній упаковці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Дата останнього перегляду. 23.01.2014 № 67.