

ИНСТРУКЦИЯ для медицинского применения препарата

L-ЦЕТ®

Состав лекарственного средства:

действующее вещество: levocetirizine dihydrochloride;

5 мл сиропа содержат левоцетиризина дигидрохлорида 2,5 мг;

вспомогательные вещества: глицерин, пропиленгликоль, натрия метилпарагидроксибензоат (Е 219), натрия пропилпарагидроксибензоат (Е 217), сахароза, кислота уксусная ледяная, натрия ацетат тригидрат, вкусовая добавка мяты перечной, вкусовая добавка банана, хинолиновый желтый (Е 104), вода очищенная.

Лекарственная форма. Сироп.

Прозрачная вязкая жидкость желтого цвета с характерным запахом.

Название и месторасположение производителя.

ООО «КУСУМ ФАРМ».

Украина, г. Сумы, ул. Скрябина, 54.

Фармакотерапевтическая группа.

Антигистаминные средства для системного применения. Производные пиперазина.

Код АТС R06A E09.

Левецетиризин – это активный стабильный R-энантиомер цетиризина, который относится к группе конкурентных антагонистов гистамина. Фармакологическое действие обусловлено блокированием H₁-гистаминовых рецепторов. Родственность к H₁-гистаминовым рецепторам у левецетиризина в 2 раза выше, чем у цетиризина. Влияет на гистаминзависимую стадию развития аллергических реакций, уменьшает проницаемость сосудов и миграцию эозинофилов, ограничивает высвобождение медиаторов воспаления. Предупреждает развитие и значительно облегчает течение аллергических реакций, оказывает антиэкссудативное, противозудное, противовоспалительное действие, практически не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия. В терапевтических дозах практически не производит седативный эффект.

Фармакокинетические параметры левецетиризина имеют линейную зависимость и почти не отличаются от таковых у цетиризина.

Абсорбция. Препарат быстро всасывается при применении внутрь, прием пищи не влияет на степень всасывания, но снижает его скорость; биодоступность достигает 100%.

У 50% больных действие препарата развивается через 12 мин после приема однократной дозы, а у 95% – через 0,5–1 час. Максимальная концентрация (C_{max}) в сыворотке достигается через 50 мин после однократного приема внутрь терапевтической дозы и удерживается на протяжении 2 дней. C_{max} составляет 207 нг/мл после однократного применения и 308 нг/мл – после повторного применения в дозе 5 мг соответственно.

Распределение. Отсутствует информация относительно распределения препарата в тканях человека, а также относительно проникновения левецетиризина сквозь гематоэнцефалический барьер. В исследованиях самая большая концентрация зафиксирована в печени и почках, а наиболее низкая – в тканях центральной нервной системы. Объем распределения – 0,4 л/кг. Связывание с белками плазмы – 90%.

Биотрансформация. В организме человека метаболизму подвергается приблизительно 14% левецетиризина. Процесс метаболизма включает оксидацию, N- и O-деалкилирование и соединение с таурином. Деалкилирование, в первую очередь, происходит при участии цитохрома CYP 3A4, в то время как в процессе оксидации задействован целый ряд цитохромных изоформ. Левецетиризин не влияет на активность цитохромных изоферментов 1A2, 2C9, 2C19, 2D6,

2E1, 3A4 в концентрациях, которые даже превышают максимальные после приема дозы 5 мг перорально. Учитывая низкую степень метаболизма, отсутствие усиления угнетающего действия, взаимодействие левоцетиризина с другими веществами (и наоборот) маловероятно.
Выведение. Экскреция препарата происходит в основном за счет клубочковой фильтрации и активной канальцевой секреции. Период полувыведения составляет $7,9 \pm 1,9$ часов, общий клиренс – 0,63 мл/мин/кг. Не накапливается, полностью выводится из организма за 96 часов. 85,4% дозы препарата выводится в неизменном виде с мочой, приблизительно 12,9% – с фекалиями.

У больных с нарушениями функции почек (клиренс креатинина < 40 мл/мин) клиренс препарата уменьшается, а период полувыведения удлиняется (так, у больных, которые находятся на гемодиализе, общий клиренс уменьшается на 80%), а это требует подбора соответствующего режима дозирования. При проведении стандартного 4-часового гемодиализа удаляется незначительная часть (меньше 10%) левоцетиризина. Выделяется в грудное молоко.

Показания к применению.

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

Противопоказания.

Гиперчувствительность к левоцетиризину, цетиризину или его первичному соединению – гидразину. Тяжелая форма хронической почечной недостаточности (клиренс креатинина < 10 мл/мин).

Надлежащие меры безопасности при применении.

Во время применения препарата следует удерживаться от употребления алкоголя.

Особые предостережения.

Препарат следует принимать регулярно в одно и то же время. Препарат у некоторых больных служит причиной сонливости, поэтому рекомендуется принимать его вечером.

Если пациент забыл принять препарат в определенное время, необходимо принять его как можно скорее. Если остается всего несколько часов до приема следующей дозы, необходимо пропустить предыдущую дозу и принимать только дозу, которая отвечает схеме.

С осторожностью применять при хронической почечной недостаточности (необходима коррекция режима дозирования).

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

Поскольку препарат содержит сахарозу, пациентам с наследственной непереносимостью фруктозы, синдромом нарушения всасывания глюкозы/галактозы и дефицитом сахарозы/изомальтазы прием препарата не рекомендован.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Препарат противопоказан в период беременности.

Во время кормления грудью применение препарата необходимо прекратить.

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

Следует удерживаться от управления автотранспортом или работы с другими механизмами во время применения препарата.

Дети. Препарат не применяют детям возрастом до 2 лет.

Способ применения и дозы.

Препарат назначают взрослым и детям возрастом от 2 лет внутрь, натошак.

Взрослым и детям старше 6 лет назначают по 5 мг (10 мл сиропа) 1 раз в сутки. Детям возрастом от 2 до 6 лет – по 1,25 мг (2,5 мл сиропа) 2 раза в сутки.

Больным пожилого возраста (при условии нормальной функции почек) нет необходимости в снижении дозы.

Для больных с хронической почечной недостаточностью доза препарата зависит от клиренса креатинина. При значении клиренса от 30 до 49 мл/мин дозу снижают в два раза – 10 мл сиропа через день; при значении клиренса от 10 до 29 мл/мин дозу препарата снижают в 3 раза – 10 мл сиропа один раз в 3 дня. При значении клиренса креатинина меньше 10 мл/мин прием препарата противопоказан. Больным с печеночной недостаточностью коррекция режима дозирования не нужна.

Максимальная суточная доза – 10 мг (20 мл сиропа).

Продолжительность лечения зависит от вида, тяжести и проявлений заболевания: при полинозе назначают в среднем на протяжении 3–6 недель; в случае кратковременного контакта с аллергеном (пыльца растений) достаточно применять препарат на протяжении 1 недели. При хронических заболеваниях (круглогодичный ринит, идиопатическая крапивница) продолжительность лечения – до 12 месяцев.

Передозировка.

При передозировке возможно усиление побочного действия препарата.

Симптомы: у взрослых – сонливость, у детей – психическое и двигательное возбуждение, которое сменяется сонливостью.

Лечение: симптоматическая и поддерживающаяся терапия, промывание желудка. Специфического антидота к левоцетиризину не существует. Гемодиализ не эффективный.

Побочные эффекты.

Со стороны нервной системы: головная боль, сонливость, утомляемость, слабость.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ощущение сердцебиения.

Со стороны органов зрения: нарушение зрения.

Со стороны гепатобилиарной системы: гепатит.

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

Со стороны дыхательной системы: одышка.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, тошнота.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: зуд, высыпания, крапивница.

Другие: увеличение массы тела, боль в животе, миалгии, могут меняться показатели печеночных проб.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Одновременное применение препарата с псевдоэфедрином, циметидином, кетоконазолом, эритромицином, азитромицином, глипезидом или диазепамом не оказывает клинически значимых неблагоприятных взаимодействий. Совместное применение с теофиллином (400 мг/сутки) снижает на 16% общий клиренс левоцетиризина (кинетика теофиллина не изменяется). При применении в терапевтических дозах нет данных об усилении действия успокоительных средств, однако желательно удерживаться от применения седативных средств во время проведения терапии.

Срок годности. 3 года.

Условия хранения.

Хранить при температуре не выше 25 °С, в защищенном от света и недоступном для детей месте.

После первого вскрытия флакона препарат хранить не больше 4 недель.

Упаковка.

По 100 мл во флаконах. Каждый флакон в картонной коробке с мерной ложкой.

Категория отпуска.

Без рецепта.