# Алерсэт-Л



## Код АТХ:

- R06AE09

## Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Левоцетиризин

## Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru

## Форма выпуска:

***Форма выпуска, описание и состав***

***Таблетки, покрытые пленочной оболочкой*** светло-розового цвета, с риской на одной стороне; вид таблетки на поперечном разрезе: оболочка - светло-розового цвета, ядро - белого цвета.

| | **1 таб.** |
|---|---|
| левоцетиризина дигидрохлорид | 5 мг |

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 83 мг, лактоза - 23 мг, крахмал прежелатинизированный - 15.5 мг, магния стеарат - 3 мг.

*Состав оболочки:* инстакоат (IC-S-344) - 1 мг (гипромеллоза - 48%, диэтилфталат - 12%, этилцеллюлоза - 40%), гипромеллоза-Е15 - 3.11 мг, титана диоксид (Е171) - 0.8 мг, макрогол 400 - 0.64 мг, краситель железа оксид красный (Е172) - 0.1 мг, тальк - 0.8 мг.

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.

## Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты

## Фармакологические свойства:

***Фармакодинамика***

Противоаллергическое средство**.** Левоцетиризин, (R)-энантиомер цетиризина, является избирательным антагонистом периферических гистаминовых $H_1$-рецепторов. Сродство левоцетиризина (Ki = 3.2 нмоль/л) с гистаминовыми $H_1$-рецепторами в 2 раза выше, чем у цетиризина (Ki = 6.3 нмоль/л). Исследования фармакокинетики у здоровых добровольцев показали, что при нанесении на кожу и на слизистую оболочку носа активность левоцетиризина в

половине дозы сопоставима активности цетиризина в целой дозе.

Левоцетиризин подавляет активность эотаксин-индуцированной трансэндотелиальной миграции эозинофилов в клетках кожи и легких. Фармакодинамические исследования продемонстрировали три основных подавляющих эффекта левоцетиризина в дозе 5 мг в первые 6 ч после контакта с пыльцой: подавление выброса VCAM-1, изменение сосудистой проницаемости и уменьшение активации эозинофилов. Как и у цетиризина, действие в отношении гистамин-индуцированных кожных реакций не зависит от плазменных концентраций препарата.

Левоцетиризин предупреждает развитие и облегчает течение аллергических реакций, оказывает антиэкссудативное, противозудное действие; практически не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия.

Левоцетиризин в дозе 5 мг способствует угнетению воспалительно-эксудативной реакции на гистамин в той же степени, что и цетиризин в дозе 10 мг. ЭКГ не выявила значительного действия левоцетиризина на интервал QT.

***Фармакокинетика***

После приема внутрь левоцетиризин быстро всасывается из ЖКТ. Прием пищи не влияет на полноту всасывания, хотя скорость ее снижается. $C_{max}$ в плазме крови достигается через 0.9 ч после однократного приема внутрь. Равновесное состояние достигается через 2 дня. $C_{max}$ после однократного и повторного (по 5 мг ежедневно) приема составляют 270 нг/мл и 308 нг/мл соответственно.

Связывание с белками плазмы составляет 90%. Данные о распределении препарата в тканях и проникновении через ГЭБ отсутствуют. $V_d$ составляет 0.4 л/кг. Выделяется с грудным молоком.

Менее 14% введенной дозы метаболизируется в печени путем окисления ароматического кольца, N- и O-деалкилирования и коньюгации с таурином. Деалкилирование преимущественно катализируется CYP3A4, а в окислении ароматического кольца принимают участие изоформы CYP. Левоцетиризин не влияет на активность изоферментов CYP1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 и 3A4 в концентрациях, намного превышающих пиковые концентрации при пероральном приеме 5 мг. Вследствие незначительного метаболизма и отсутствия метаболического подавления взаимодействие левоцетиризина с другими веществами маловероятно.

$T_{1/2}$ составляет 7.9±1.9 ч. Общий клиренс составляет 0.63 мл/мин/кг. Левоцетиризин и его метаболит выводятся преимущественно почками (85.4% принятой дозы), путем клубочковой фильтрации и активной канальцевой секреции. Выведение через кишечник составляет 12.9%.

Фармакокинетика левоцетиризина линейна, не зависима от дозы и времени и имеет малые различия у разных испытуемых. Фармакокинетические профили одиночного энантиомера и цетиризина сходны. При всасывании или выведении не происходит хиральной инверсии.

Общий клиренс левоцетиризина коррелирует с КК (это следует учитывать при определении интервалов между приемами у пациентов с умеренным или выраженным нарушением функции почек). При анурии общий клиренс снижается примерно на 80% по сравнению со здоровыми испытуемыми. При стандартной процедуре 4-часового гемодиализа выводится менее чем 10% левоцетиризина.

## Показания к применению:

Симптоматическое лечение симптомов круглогодичного и сезонного аллергического ринита (в т.ч. персистирующего аллергического ринита) и аллергического конъюнктивита: чиханье, ринорея, слезотечение, гиперемия конъюнктивы; сенная лихорадка (поллиноз); крапивница (в т.ч. хроническая идиопатическая крапивница); другие аллергические дерматозы, сопровождающиеся зудом и сыпью; отек Квинке.

## Относится к болезням:

- Аллергия
- Дерматит
- Зуд
- Конъюнктивит
- Крапивница
- Лихорадка
- Отек Квинке
- Поллиноз
- Ринит
- Сенная лихорадка

## Противопоказания:

Почечная недостаточность тяжелой степени (КК ниже 10 мл/мин); детский возраст до 2 лет; повышенная чувствительность к левоцетиризину.

## Способ применения и дозы:

Принимают внутрь, независимо от приема пищи.

Взрослым и детям в возрасте старше 6 лет - по 5 мг 1 раз/сут.

Детям в возрасте 2-6 лет - по 1.25 мг 2 раза/сут.

Продолжительность лечения зависит от вида, длительности и течения симптомов. Для лечения сенной лихорадки требуется 3-6 недель, а при кратковременном воздействии пыльцы обычно достаточно приема препарата в течение 1 недели.

## Побочное действие:

*Со стороны ЦНС:* часто - головная боль, сонливость, повышенная утомляемость; нечасто - астения.

*Со стороны пищеварительной системы:* часто - сухость во рту; нечасто - боль в животе; очень редко - тошнота, нарушение функциональных печеночных проб.

*Аллергические реакции:* очень редко - ангионевротический отек, зуд, кожная сыпь, крапивница, анафилаксия.

*Прочие:* очень редко - увеличение массы тела, диспноэ.

## Применение при беременности и кормлении грудью:

Данные клинических исследований применения левоцетиризина при беременности отсутствуют. Не рекомендуется применять при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

## Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Диагнозы

- Детские колики
- Коклюш
- Круп
- Лечение и профилактика недержания мочи у детей

## Особые указания и меры предосторожности:

Пациентам пожилого возраста с умеренным или выраженным нарушением функции почек может потребоваться коррекция режима дозирования.

Пациентам с нарушением функции почек требуется коррекция режима дозирования в зависимости от КК.

Пациентам с изолированным нарушением функции печени каких-либо изменений дозы не требуется. Пациентам с сочетанным нарушением функции печени и почек рекомендуется уточнение дозы.

Пациентам следует воздержаться от употребления алкоголя во время применения левоцетиризина.

*Использование в педиатрии*

Левоцетиризин применяют у детей старше 2 лет в специальной лекарственной форме.

*Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами*

Сравнительные клинические исследования не выявили признаков нарушения уровня бодрствования, времени реакции или способности к управлению транспортными средствами после приема рекомендованных доз левоцетиризина. Однако некоторые пациенты могут испытывать сонливость, утомляемость или астению во время приема. Следует с осторожностью применять у пациентов, управляющих автотранспортом и занимающимся видами

деятельности, требующими быстроты психомоторных реакций.

**Источник:** http://drugs.thead.ru/Alerset-L