Левоцетиризин Сандоз



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

◊ ***Таблетки, покрытые пленочной оболочкой*** белого или почти белого цвета, овальные, двояковыпуклые, с гравировкой "L9CZ" на одной стороне и "5" на другй стороне; на поперечном разрезе ядро таблетки белого или почти белого цвета.

	1 таб.
левоцетиризина дигидрохлорид	5 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат 64.0 мг, целлюлоза микрокристаллическая 30.0 мг, магния стеарат 1.0 мг.
Состав пленочной оболочки: опадрай белый 3.0 мг гипромеллоза 1.875 мг, титана диоксид 0.9375 мг, макрогол 400 - 0.1876 мг).

10 шт. - блистеры из ПВХ/ПВДХ/алюминиевой фольги (3) - пачки картонные.

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/Levocetirizin_Sandoz