Зенаро



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	**1 таб.**
левоцетиризина дигидрохлорид	5 мг

7 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Левоцетиризин, (R)-энантиомер цетиризина, является ингибитором периферических H_1-гистаминовых рецепторов, сродство которого в 2 раза выше, чем у цетиризина. После однократного приема левоцетиризина наблюдалось связывание H_1-гистаминовых рецепторов на 90 % через 4 часа и на 57 % через 24 часа.

Оказывает влияние на гистаминозависимую стадию аллергических реакций; уменьшает миграцию эозинофилов, уменьшает сосудистую проницаемость, ограничивает высвобождение медиаторов воспаления. Предупреждает развитие и облегчает течение аллергических реакций, оказывает антиэкссудативное, противозудное действие; практически не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия. В терапевтических дозах практически не оказывает седативного действия. Действие начинается через 12 минут после приема однократной дозы у 50 % пациентов, через 1 час у 95 % пациентов и продолжается в течение 24 часов. Не оказывает влияния на интервал QT на ЭКГ.

Фармакокинетика

Фармакокинетика носит линейный характер, не зависит от дозы и времени, и варьируется незначительно у разных людей.

Абсорбция

После приема внутрь абсорбция левоцетиризина происходит быстро и в большом количестве. Максимальная плазменная концентрация достигается через 0,9 часа после приема препарата. Равновесная концентрация устанавливается через 2 дня. Максимальная плазменная концентрация после однократного приема 5 мг левоцетиризина составляет 270 нг/мл, а после повторного приема в дозе 5 мг - 308 нг/мл. Степень абсорбции зависит от дозы и не нарушается при приеме пищи, но при приеме пищи максимальная концентрация снижается, и замедляется ее достижение.

Распределение

Левоцетиризин на 90 % связывается с белками плазмы. Объем распределения составляет 0,4 л/кг. Данные по

распределению левоцетиризина в тканях и его проникновению через гематоэнцефалический барьер у человека отсутствуют. Левоцетиризин проникает в грудное молоко.

Метаболизм

У людей метаболизируется менее 14 % дозы левоцетиризина, так как предполагаемые различия в фармакокинетическом профиле левоцетиризина вследствие генетического полиморфизма или одновременного приема ингибиторов ферментов незначительны. Метаболические превращения заключаются в окислении ароматического кольца, N- и O-деалкилировании и конъюгации с таурином. Процесс деалкилирования, главным образом, осуществляется с помощью изофермента CYP3A4, в то время как окисление ароматического кольца происходит с помощью многих и/или неустановленных CYP-изоформ. Левоцетиризин при приеме внутрь в дозе 5 мг и/или при превышении максимальных концентраций в плазме крови, не оказывает влияния на активность CYP-изоферментов 1A2,2C9, 2C19, 2D6,2E1, 3A4.

Благодаря ограниченному метаболизму и отсутствию метаболической ингибирующей активности, взаимодействие левоцетиризина на уровне метаболизма с другими веществами маловероятно.

Выведение

$T_{1/2}$ у взрослых составляет 7,9 ± 1,9 ч. Средний наблюдаемый общий клиренс - 0,63 мл/мин/кг. Левоцетиризин преимущественно выводится с мочой, в среднем, около 85,4 % от принятой дозы путем гломерулярной фильтрации и активной канальцевой секреции. Выведение через кишечник (с калом) составляет только 12,9 % от принятой дозы.

Пациенты с почечной недостаточностью

Общий клиренс левоцетиризина зависит от клиренса креатинина (КК). Поэтому пациентам с умеренной и тяжелой почечной недостаточностью рекомендуется увеличение интервалов между приемами препарата в соответствии с КК. У пациентов с анурией и терминальной стадией почечной недостаточности общий клиренс левоцетиризина снижается приблизительно на 80 % по сравнению со здоровыми людьми. Количество левоцетиризина, выводимого при стандартной 4-х часовой процедуре гемодиализа составляет менее 10 %.

Показания к применению:

— лечение симптомов круглогодичного (персистирующего) и сезонного (интермиттирующего) аллергических ринитов и аллергического конъюнктивита, таких как зуд, чихание, заложенность носа, ринорея, слезотечение, гиперемия конъюнктивы;

— поллиноз (сенная лихорадка);

— крапивница, в т.ч. хроническая идиопатическая крапивница;

— отек Квинке (в качестве вспомогательной терапии);

— другие аллергические дерматозы, сопровождающиеся зудом и высыпаниями.

Относится к болезням:

- Аллергический ринит
- Аллергия
- Дерматит
- Зуд
- Конъюнктивит
- Крапивница
- Лихорадка
- Поллиноз
- Ринит
- Сенная лихорадка

Противопоказания:

— гиперчувствителыюсть к левоцетиризину и другим производным пиперазина или к любому из вспомогательных компонентов препарата;

— терминальная почечная недостаточность с КК менее 10 мл/мин;

— беременность;

— детский возраст до 6 лет (для данной лекарственной формы);

— врожденная непереносимость галактозы, дефицит лактазы или мальабсорбция глюкозы-галактозы (из-за содержания в препарате лактозы).

С осторожностью:

— необходимо соблюдать осторожность при одновременном приеме с алкоголем (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»);

— хроническая почечная недостаточность с КК более 10 мл/мин, но менее 50 мл/мин (требуется коррекция режима дозирования);

— пожилой возраст (возможно снижение клубочковой фильтрации).

Способ применения и дозы:

Таблетку следует принимать внутрь, не разжевывая и запивая жидкостью, независимо от приема пищи. Рекомендуется принимать суточную дозу в один прием. Взрослые, подростки и дети старше 6 лет Рекомендуемая суточная доза составляет 5 мг (1 таблетка).

Пациенты пожилого возраста

У пожилых пациентов с умеренной и тяжелой почечной недостаточностью рекомендуется коррекция дозы (см. «Пациенты с нарушением функции почек» ниже).

Пациенты с нарушением функции почек

Интервал между приемами препарата определяют индивидуально с учетом функции почек. Информация о коррекции дозы приведена в таблице ниже. Для ее использования должен быть рассчитан клиренс креатинина (КК) у пациента в мл/мин на основании концентрации креатинина в сыворотке (мг/дл) с использованием следующей формулы:

$$\frac{[140 - \text{возрастает})] \times \text{вес (кг)}}{72 \times \text{креатинин сыворотки крови (мг/дл)}} = КК$$

× 0,85 для женщин

Коррекция дозы у пациентов с нарушением функции почек:

Группа	Клиренс креатинина (мл/мин)	Доза и кратность приема
Нормальная функция	>80	5 мг один раз в сутки
Легкая ХПН	50-79	5 мг один раз в сутки
Умеренная ХПН	30-49	5 мг один раз в 2 суток
Тяжелая ХПН	<30	5 мг один раз в 3 суток
Терминальная ХПН — пациенты на диализе	<10	Противопоказано

У детей с нарушением функции почек дозу корректируют индивидуально с учетом клиренса креатинина и веса тела. Отдельных данных по применению у детей с нарушением функции почек нет.

Пациенты с нарушением функции печени

При изолированном нарушении функции печени коррекции дозы не требуется. У пациентов с печеночно-почечной недостаточностью рекомендуется коррекция дозы (см. «Пациенты с нарушением функции почек» выше).

Продолжительность лечения

Лечение аллергического ринита проводят в соответствии с течением заболевания; прием препарата можно прекратить при исчезновении симптомов и возобновить при рецидиве. В случае хронического аллергического ринита может быть прописано продолжительное лечение в период действия аллергенов. В настоящее время клинический опыт применения левоцетиризина в виде таблеток, покрытых пленочной оболочкой, 5 мг ограничен 6-ю месяцами.

Побочное действие:

Побочные эффекты левоцетиризина разделены по системно-органным классам в соответствии с классификацией Медицинского словаря по нормативно-правовой деятельности (MedDRA) с указанием частоты их встречаемости: часто (≥ 1/100 и 1/10); нечасто (≥ 1/1000 и < 1/100); очень редко (< 1/10000).

Нарушения со стороны иммунной системы:

Очень редко: реакции гиперчувствительности, в том числе анафилактические реакции.

Нарушения со стороны нервной системы:

Часто: головная боль.

Нечасто: сонливость

Очень редко: агрессия, возбуждение, галлюцинации, депрессия, судороги.

Нарушения со стороны органа зрения:

Очень редко: зрительные расстройства.

Нарушения со стороны сердца:

Очень редко: ощущение сердцебиения, тахикардия.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:

Очень редко: одышка.

Нарушения со стороны ЖКТ:

Часто: сухость слизистой оболочки полости рта.

Нечасто: боли в животе.

Очень редко: тошнота, диарея.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей:

Очень редко: гепатит.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:

Очень редко: ангионевротический отек, зуд, сыпь, включая лекарственную сыпь, крапивница.

Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани:

Очень редко: миалгия.

Общие нарушения:

Часто: утомляемость.

Нечасто: астения

Нарушения со стороны лабораторных и инструментальных данных:

Очень редко: нарушение показателей функции печени, увеличение массы тела.

Передозировка:

Симптомы

Симптомы передозировки могут включать сонливость у взрослых и возбуждение, а также беспокойство, сменяющиеся сонливостью, у детей.

Лечение

Специфических антидотов левоцетиризина нет.

В случае передозировки рекомендуется симптоматическое или поддерживающее лечение. Если после приема препарата прошло немного времени, следует провести промывание желудка. Левоцетиризин практически не выводится при гемодиализе.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата при беременности противопоказано.

Левоцетиризин выделяется с грудным молоком, поэтому при необходимости применения препарата при лактации рекомендуется прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

С левоцетиризином не проводилось исследований по лекарственному взаимодействию, включая исследования с индукторами изофермента CYP3A4.

Степень всасывания левоцетиризина не снижалась под воздействием пищи, хотя скорость всасывания уменьшалась.

У чувствительных пациентов одновременный прием левоцетиризина и алкоголя или других веществ, угнетающе воздействующих на центральную нервную систему (ЦНС), может усиливать влияние на ЦНС.

Особые указания и меры предосторожности:

Во время лечения препаратом не рекомендуется принимать этанол.

Влияние на способность управлять транспортными средствами или заниматься другими потенциально опасными видами деятельности

Левоцетиризин, при его приеме в рекомендованных дозах, не оказывает отрицательного влияния на внимание и скорость психомоторных реакций и способность управлять транспортными средствами. Тем не менее, в период приема препарата целесообразно воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Интервал между приемами препарата определяют индивидуально с учетом функции почек. Информация о коррекции дозы приведена в таблице.

У детей с нарушением функции почек дозу корректируют индивидуально с учетом клиренса креатинина и веса тела. Отдельных данных по применению у детей с нарушением функции почек нет.

При нарушениях функции печени

При изолированном нарушении функции печени коррекции дозы не требуется. У пациентов с печеночно-почечной недостаточностью рекомендуется коррекция дозы (см. «Пациенты с нарушением функции почек» выше).

Применение в пожилом возрасте

У пожилых пациентов с умеренной и тяжелой почечной недостаточностью рекомендуется коррекция дозы (см. «Пациенты с нарушением функции почек» ниже).

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 6 лет.

Условия хранения:

Хранить при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

Без рецепта.

Источник: http://drugs.thead.ru/Zenaro