

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування препарату

ЗИЛОЛА® (ZILOLA®)

Склад лікарського засобу:

діюча речовина: левоцетиризин;

1 таблетка містить 5 мг левоцетиризину дигідрохлориду;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна (тип 102), лактози моногідрат, кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат;

оболонка: опадрі білий (гіпромелоза (Е 464), титану діоксид (Е 171), макрогол 400).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Білого або майже білого кольору, довгасті, двоопуклі таблетки, вкриті плівковою оболонкою, з гравіруванням «R23» з одного боку. Довжина близько 8 мм, ширина близько 4,5 мм.

Назва і місцезнаходження виробника. ТОВ «Гедеон Ріхтер Польща»,
05-825, Гродзиськ Мазовецький, вул. Гранична, 35, Польща.
05-825, Гродзиськ Мазовецький, вул. кн. Ю. Понятовського, 5, Польща.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні засоби для системного застосування. Похідні піперазину.
Код АТС R06A E09.

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

Дані ЕКГ не показали відповідного впливу левоцетиризину на інтервал QT.

Фармакокінетичні параметри левоцетиризину змінюються лінійно, є дозо- і часонезалежними, володіють низькою індивідуальною варіабельністю та майже не відрізняються від таких, як уцетиризин.

Всмоктування. Левоцетиризин швидко всмоктується після застосування внутрішньо. Її прийом їжі не впливає на ступінь усмоктування, але знижує його швидкість. Максимальна концентрація (C_{max}) у сироватці досягається через 0,9 години після прийому терапевтичної дози і становить 207 нг/мл після одноразового застосування та 308 нг/мл – після повторного застосування у дозі 5 мг відповідно.

Рівноважні концентрації препарату у сироватці досягаються через 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 – 90%.

Біотрансформація. В організмі людини метаболізму піддається близько 14 % левоцетиризину. Процес метаболізму включає окисдацію, N- та O-деалкілування і сполучення з таурином. Деалкілування, в першу чергу, відбувається за участю цитохрому CYP 3A4, у той час як у процесі окиснення задіяна низка цитохромних ізоформ. Левоцетиризин не впливає на активність цитохромних ізоферментів 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4 у концентраціях, що навіть перевищують максимальні після прийняття 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 канальцевої секреції. Період напіввиведення ($T_{1/2}$) у дорослих становить $7,9 \pm 1,9$ години, загальний кліренс – 0,63 мл/хв/кг. Не накопичується, повністю виводиться з організму за 96 годин. 85,4 % дози препарату виводиться у незміненому вигляді із сечею, близько 12,9 % – з фекаліями. У хворих з 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 алергійних ринітів, у тому числі цілорічних алергійних ринітів, хронічна ідіопатична кропив'янка.

Протипоказання.

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

Тяжка ниркова недостатність при кліренсі креатиніну менше 0 мл/хв.

Тяжка спадкова непереносимість галактози, дефіцит ферменту лактази (β -галактозидази) або порушення засвоєння глюкози і галактози.

Вагітність та період годування груддю.

Дитячий вік до 6 років.

Особливі застереження.

З обережністю застосовують пацієнтам з хронічною нирковою недостатністю (потрібна корекція режиму дозування), пацієнтам літнього віку (можливе зниження клубочкової фільтрації).

Призначаючи препарат, необхідно звернути увагу на наявність у пацієнта певних факторів, що провокують затримку сечі (наприклад, травми спинного мозку, гіперплазія передміхурової залози), оскільки левоцетиризин може збільшувати ризик затримки сечі.

Під час застосування препарату слід утримуватися від вживання алкоголю.

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

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Левоцетиризин протипоказаний для застосування у період вагітності. Препарат проникає у грудне молоко, тому за необхідності застосування препарату у період лактації годування груддю потрібно припинити.

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

Слід утримуватися від керування автотранспортом або роботи з іншими механізмами під час лікування препаратом.

Діти.

Препарат у вигляді таблеток не застосовувати дітям віком до 6 років, оскільки ця лікарська форма не дає змоги проводити необхідну корекцію режиму дозування. Для цієї категорії пацієнтів рекомендується левоцетиризин у лікарській формі, придатній для застосування у педіатрії.

Спосіб застосування та дози.

Препарат призначають дорослим та дітям віком від 6 років внутрішньо у добовій дозі 5 мг 1 раз на добу. Приймають таблетку з їжею або натщесерце, не розжовуючи, запиваючи невеликою кількістю води.

Хворим літнього віку при нормальній функції нирок зниження дози не потрібне.

Дорослим хворим із хронічною нирковою недостатністю застосовувати після консультації з лікарем.

Розрахунок дози необхідно проводити з урахуванням кліренсу креатиніну відповідно до таблиці.

Функція нирок	Кліренс креатиніну, мл/хв	Доза й кількість прийомів
Норма	≥ 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 добу кожні 2 доби
Порушення тяжкого ступеня	<30	5 мг 1 раз на добу кожні 3 доби
Термінальна стадія ниркової недостатності - пацієнти на гемодіалізі	<10-	Протипоказано

Хворим з печінковою недостатністю корекція режиму дозування не потрібна. Хворим з печінковою та нирковою недостатністю коригують режим дозування відповідно до таблиці, наведеної вище, після консультації з лікарем.

У дітей з нирковою недостатністю корекцію дози необхідно проводити індивідуально, виходячи з показника кліренсу креатиніну і маси тіла пацієнта. Спеціальні данні щодо режиму прийому препарату дітьми з нирковою недостатністю відсутні.

Тривалість лікування залежить від виду, тяжкості та проявів симптомів захворювання та визначається лікарем. У випадку короткочасного контакту з алергеном (пилок рослин) достатньо застосовувати препарат протягом 1 тижня. Тривалість лікування в середньому становить 3-6 тижнів. Для лікування хронічної кропив'янки та хронічного алергічного риніту препарат застосовують протягом року.

Передозування.

Симптоми: може супроводжуватися ознаками інтоксикації у вигляді сонливості; у дітей передозування може супроводжуватися збудженням і невгамовністю, які змінюються сонливістю.

Лікування: з появою симптомів передозування (особливо у дітей) прийом препарату необхідно припинити; негайно звернутися до лікаря; проводять промивання шлунка, застосовують активоване вугілля; терапія симптоматична. Специфічного антидоту немає, гемодіаліз не ефективний.

Побічні ефекти.

Побічні реакції, виявлені під час застосування препарату, зазначені нижче.

З боку нервової системи: сонливість, головний біль, підвищена втомлюваність, астения, судоми, парестезія, запаморочення, непритомність, тремор, дисгевзія.

З боку органів зору: порушення зору, нечіткість зору.

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

З боку органів дихання: задишка.

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

З боку гепатобіліарної системи: гепатит.

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

З боку опорно-рухового апарату: біль у м'язах.

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

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

Порушення харчування та обміну речовин: підвищений апетит.

Загальні порушення та стан місця введення: набряк.

Результати досліджень: збільшення маси тіла, відхилення функціональних показників печінкових проб від норми.

Прийом препарату слід припинити у разі появи будь-якого з вищезазначених побічних ефектів та звернутися до лікаря.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Одночасне застосування з псевдоефедриним, циметидином, кетоконазолом, еритроміцином, азитроміцином, гліпезидом або діазепамом не виявляє клінічно значущих несприятливих взаємодій. Сумісне застосування з теофіліном (400 мг/добу) знижує на 16 % загальний кліренс левоцетиризину, при цьому кінетика теофіліну не змінюється. Левоцетиризин не посилює ефект алкоголю, однак у чутливих пацієнтів одночасне застосування препарату і алкоголю або інших препаратів, що пригнічують функцію центральної нервової системи, може впливати на функцію центральної нервової системи. Утримуватись від застосування седативних засобів під час проведення терапії.

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання. Цей лікарський засіб не потребує спеціальних температурних умов зберігання. Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 7 таблеток у блістері; по 1 або 4 блістери в пачці.

Категорія відпуску. Без рецепта.