

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ГЛЕНЦЕТ

Склад:

діюча речовина: levocetirizine

1 таблетка містить левоцетиризину дигідрохлориду 5 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, целюлоза мікрокристалічна, кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат, Opadry white (Opadry Y 1-7000): титану діоксид (E 171), поліетиленгліколь, гіпромелоза

Лікарська форма. Таблетки, вкриті оболонкою

Основні фізико-хімічні властивості: білого кольору овальні двоопуклі таблетки, вкриті оболонкою, з лінією розлому з одного та гладенькою поверхнею з іншого боку; з написом G з обох боків від лінії розлому.

Фармакотерапевтична група.

Антигістамінні засоби для системного застосування. Похідні піперазину.

Код АТХ R06A E09.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Левоцетиризин – це активний стабільний R-енантіомер цетиризину, що відноситься до групи конкурентних антагоністів гістаміну. Фармакологічна дія зумовлена блокуванням H₁-гістамінових рецепторів. Спорідненість до H₁-гістамінових рецепторів у левоцетиризину у 2 рази вища, ніж у цетиризину. Впливає на гістамінзалежну стадію розвитку алергічної 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.

Фармакокінетика.

Фармакокінетичні параметри левоцетиризину мають лінійну залежність і майже не відрізняються від таких у цетиризину.

Абсорбція. Препарат швидко всмоктується при застосуванні внутрішньо, прийом їжі не впливає на наступний всмоктування, але знижує його швидкість; біодоступність досягає 100 %. У 50 % хворих дія препарату розвивається через 12 хвилини після прийому одноразової дози, а у 95 % – через 0,5-1 годину.

Максимальна концентрація у сироватці крові досягається через 50 хвилин після одноразового прийому внутрішньо терапевтичної дози та утримується протягом 2 днів. C_{max} становить 207 нг/мл після одноразового застосування і 308 нг/мл – після повторного застосування у дозі 5 мг відповідно.

Розподіл. Відсутня інформація щодо розподілу препарату у тканинах людини, а також щодо проникнення левоцетиризину крізь гематоенцефалічний бар'єр. У дослідженнях 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 крові – 90 %.

Біотрансформація. В організмі людини метаболізму піддається приблизно 14 % левоцетиризину. Процес метаболізму включає оксидацію, N- та O- деалкілювання і сполучення з таурином.

Деалкілювання, у першу чергу, відбувається з участю цитохрому CYP 3A4, у той час як у процесі оксидації задіяна ціла низка цитохромних ізоформ. Левоцетиризин не впливає на активність цитохромних ізоферментів 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4 у концентраціях, що навіть перевищують пікові після прийому дози 5 мг перорально. Враховуючи низький ступінь метаболізму, відсутність посилення пригнічувальної дії, взаємодія левоцетиризину з іншими речовинами (і навпаки) мало ймовірна.

Виведення. Екскреція препарату відбувається в основному за рахунок клубочкової фільтрації та активної канальцевої секреції. Період напіввиведення ($T_{1/2}$) становить $7,9 \pm 1,9$ години, загальний кліренс – 0,63 мл/хв/кг. 85,4 % дози препарату виводиться у незміненому вигляді із сечею, приблизно 12,9 % – з фекаліями. У хворих з порушеннями функції нирок (кліренс креатиніну < 40 мл/хв) кліренс препарату зменшується, а період напіввиведення ($T_{1/2}$) подовжується (так, у хворих, які перебувають на гемодіалізі, загальний кліренс зменшується на 80 %), а це вимагає підбору відповідного режиму дозування. При проведенні стандартного 4-годинного гемодіалізу видаляється незначна частина (менше 10 %) левоцетиризину. Екскретується в грудне молоко.

Клінічні характеристики.

Показання.

Симптоматичне лікування алергічного риніту, у тому числі цілорічного алергічного риніту та сезонного.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до левоцетиризину або до будь-якої іншої складової даної лікарської форми, або до будь-яких похідних піперазину.

Тяжка форма хронічної ниркової недостатності (кліренс креатиніну < 10 мл/хв).

Рідкісні спадкові захворювання непереносимості галактози, лактазна недостатність або порушення засвоєння глюкози і галактози.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Досліджень з левоцетиризином щодо взаємодії не проводили. Дослідження з цетиризином (з'єднання рацемату) показали, що одночасне застосування з антипірином, псевдоефедриним, циметидином, кетоконазолом, еритроміцином, азитроміцином, гліпезидом або діазепамом не чинить клінічно значущих несприятливих взаємодій. Сумісне застосування з теофіліном (400 мг/добу) знижує на 16 % загальний кліренс цетиризину (кінетика теофіліну не змінюється). При дослідженні багаторазового введення ритонавіру (600 мг 2 рази на добу) та цетиризину (10 мг на добу) ступінь експозиції цетиризину збільшувався приблизно на 40 %, тоді як розподіл ритонавіру дещо змінювався (-11 %) до паралельного застосування цетиризину. Немає даних щодо посилення ефекту седативних засобів при застосуванні у терапевтичних дозах. Але слід уникати застосування седативних засобів під час прийому препарату. Прийом їжі не впливає на ступінь всмоктування препарату, але одночасне вживання їжі знижує швидкість його абсорбції.

Особливості застосування.

З обережністю застосовувати пацієнтам із хронічною нирковою недостатністю (потрібна корекція режиму дозування) та пацієнтам літнього віку з нирковою недостатністю (можливе зниження клубочкової фільтрації). Під час застосування препарату слід утримуватися від вживання алкоголю.

При наявності у пацієнтів певних факторів, що провокують затримку сечі (наприклад, травми спинного мозку, гіперплазія передміхурової залози) необхідно приділити увагу при призначенні препарату, оскільки левоцетирин може збільшити ризик затримки сечі.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Левоцетирин протипоказаний для застосування у період вагітності. Цетиризин проникає у грудне молоко, тому при необхідності застосування препарату годування груддю слід припинити.

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

Слід утримуватися від керування автотранспортом або роботи з іншими механізмами на період лікування препаратом.

Спосіб застосування та дози.

Препарат призначати дорослим та дітям віком від 6 років внутрішньо у добовій дозі 5 мг

1 раз на добу. Приймати таблетку незалежно від вживання їжі. Таблетку необхідно ковтати цілою, запиваючи невеликою кількістю води.

Хворим літнього віку з нормальною функцією нирок корекція дози препарату не потрібна. Хворим із порушеною функцією нирок розрахунок дози необхідно проводити з урахуванням кліренсу креатиніну відповідно до таблиці.

Для застосування цієї таблиці дозування необхідно оцінити кліренс креатиніну ($К_{кр}$) пацієнта у мл/хв. $К_{кр}$ (мл/хв) має бути оцінений за вмістом креатиніну в сироватці крові (мг/дл) за допомогою наступної формули:

$$К_{кр} = \frac{[140 - \text{вік (роки)}] \times \text{маса тіла (кг)} (\times 0,85 \text{ для жінок})}{72 \times \text{креатинін сироватки крові (мг/дл)}}$$

Корекція дози препарату для хворих із порушеною функцією нирок

Функція нирок
Кліренс креатиніну, мл/хв
Доза та кількість прийомів

Нормальна функція нирок
Порушення ≥ 80 %
Порушення 50-79 %
Порушення 30-49 %
Кінцева стадія захворювання

Дітям із порушеннями функції нирок дозу препарату слід коригувати індивідуально з урахуванням ниркового кліренсу та маси тіла.

Хворим винятково з печінковою недостатністю корекція режиму дозування не потрібна. Хворим із печінковою та нирковою недостатністю коригувати режим дозування відповідно до наведеної вище таблиці.

Тривалість застосування: пацієнтів із періодичним алергічним ринітом (тривалість симптомів захворювання становить < 4 діб на тиждень або протягом менше 4 тижнів) слід лікувати відповідно до захворювання та анамнезу; лікування можна припинити, якщо симптоми зникнуть, та можна відновити знову при повторному виникненні симптомів. У разі стійкого алергічного риніту (тривалість симптомів захворювання становить > 4 діб на тиждень та протягом більше 4 тижнів) у період контакту з алергенами пацієнту може бути запропонована постійна терапія. При хронічних захворюваннях (хронічний алергічний риніт, хронічна кропив'янка) тривалість лікування становить до 1 року (дані доступні з клінічних досліджень при застосуванні рацемату).

Діти.

Препарат у вигляді таблеток не застосовувати дітям віком до 6 років, оскільки така лікарська форма не дає змоги проводити необхідну корекцію режиму дозування. Даній категорії пацієнтів рекомендується застосування левоцетиризину у лікарський формі, придатній для використання у педіатрії.

Передозування.

Симптоми: симптоми передозування можуть включати сонливість у дорослих та початкове збудження і підвищену дратівливість з наступною сонливістю у дітей.

Лікування. Специфічного антидоту до левоцетиризину немає. У випадку появи симптомів передозування рекомендується симптоматична та підтримуюча терапія. Слід розглянути необхідність промивання шлунка через короткий час після застосування препарату. Гемодіаліз для виведення левоцетиризину з організму не ефективний.

Побічні реакції.

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

З боку психіки: порушення сну, збудження, галюцинації, депресія, агресія, безсоння, суїцидальні думки.

З боку серця: посилене серцебиття, тахікардія.

З боку органів зору: порушення зору, нечіткість зору.

З боку органів слуху та рівноваги: вертиго.

З боку печінки та жовчовивідних шляхів: гепатит.

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

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

З боку дихальної системи, органів грудної клітки та середостіння: задишка.

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

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

З боку скелетно-м'язової системи, сполучної тканини та кісток: міалгія.

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

Порушення харчування та обміну речовин: підвищений апетит.

Загальні порушення та стан у місці введення: набряк.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері; по 1 або по 3, або по 10 блістерів в картонній упаковці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Виробник.

Гленмарк Фармасьютікалз Лтд./GlenmarkPharmaceuticalsLtd.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Ділянка № С-7, промислова зона Колваль, Колваль, Бардез, Гоа – 403 513, Індія