

І Н С Т Р У К Ц І Я
для медичного застосування лікарського засобу
АЛЕРОН
(ALERON)

Склад:

діюча речовина: левоцетиризин;

1 таблетка містить левоцетиризину дигідрохлориду 5 мг;

допоміжні речовини: крохмаль кукурудзяний, лактози моногідрат, целюлоза мікрокристалічна, натрію крохмальгліколят (тип А), кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат;

оболонка: Opadry White 1185 F 18378 (полівініл алкогільгідролізований, титану діоксид (Е 171), поліетиленгліколь 3350, тальк).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: круглі таблетки білого кольору, двоопуклі, вкриті оболонкою, гладкі з обох боків.

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 та антисеротонінової дії.

Фармакокінетика.

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

Препарат швидко всмоктується при застосуванні внутрішньо, прийом їжі не впливає на ступінь усмоктування, але знижує його швидкість.

Відсутня інформація щодо розподілу препарату у тканинах людини, а також щодо проникнення левоцетиризину крізь гематоенцефалічний бар'єр. Об'єм розподілу – 0,4 л/кг. Зв'язування з білками плазми – 90 %.

В організмі метаболізму піддається близько 14 % левоцетиризину. Враховуючи низький ступінь метаболізму, відсутність посилення пригнічувальної дії, взаємодія левоцетиризину з іншими речовинами (і навпаки) малоімовірна.

Екскреція препарату відбувається в основному за рахунок клубочкової фільтрації та активної канальцевої секреції. Період напіввиведення (T_{1/2}) становить 7,9 ± 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 із 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. Проникає у грудне молоко.

Клінічні характеристики.

Показання.

Симптоматичне лікування алергічного риніту (у тому числі цілорічного алергічного риніту) та кропив'янки.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до левоцетиризину, до інших похідних піперазину, а також до інших компонентів препарату; тяжка форма хронічної ниркової недостатності (кліренс креатиніну < 10 мл/хв); рідкісна спадкова непереносимість галактози, дефіцит ферменту лактази або порушення засвоєння глюкози/галактози.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Дослідження з левоцетиризином щодо взаємодії не проводили. Дослідження з цетиризином (поєднання рацемату) показали, що одночасне застосування з антипірином, псевдоефедриним, циметидином, кетоконазолом, еритроміцином, азитроміцином, гліпізидом або діазепамом не чинить клінічно значущих несприятливих взаємодій. Сумісне застосування з теофіліном (400 мг/добу) знижує на 16 % загальний кліренс левоцетиризину (кінетика теофіліну не змінюється). При дослідженні багаторазового застосування 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 знижує швидкість його абсорбції.

Особливості застосування.

З обережністю застосовувати пацієнтам із хронічною нирковою недостатністю (необхідна корекція режиму дозування) та пацієнтам літнього віку (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 левоцетиризин може збільшити ризик затримки сечі.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Левоцетиризин протипоказаний для застосування у період вагітності. Левоцетиризин 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 під час 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 прийому 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 ($КЛ_{кр}$) пацієнта у мл/хв. $КЛ_{кр}$ (мл/хв) має бути оцінений за вмістом креатиніну у сироватці крові (мг/дл) за допомогою наступної формули:

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

Корекція дози препарату хворим із порушеною функцією нирок:

Функція нирок	Кліренс креатиніну, мл/хв	Доза і кількість прийомів
Нормальна функція нирок	≥ 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 2 доби
Порушення важкого ступеня	< 30	5 мг 1 раз на 3 доби
Кінцева стадія захворювання нирок Пацієнти, які перебувають на діалізі	< 10	Протипоказано

Дітям із порушеннями функції нирок дозу препарату необхідно скоригувати індивідуально з урахуванням ниркового кліренсу пацієнта та його маси тіла.

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

Тривалість застосування: пацієнтів із періодичним алергічним ринітом (тривалість симптомів захворювання становить < 4 днів 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 днів на тиждень та протягом більше 4 тижнів) у період контакту з алергенами пацієнту можна запропонувати постійну терапію. 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 ця лікарська форма не дає змоги проводити необхідну корекцію режиму дозування. Даній категорії пацієнтів рекомендується застосування левоцетиризину у лікарській 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 прийому препарату. Гемодіаліз для виведення левоцетиризину з організму не ефективний.

Побічні реакції.

З боку нервової системи: сонливість, головний біль, підвищена втомлюваність, слабкість, астения, 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 травного тракту: діарея, блювання, запор, сухість у роті, нудота, біль у животі.

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

З боку кістково-м'язової системи: міалгія.

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

З боку харчування та обміну речовин: підвищений апетит.

Загальні порушення та стан у місці введення: набряк.

Термін придатності. 2 роки.

Не застосовувати після закінчення терміну придатності, зазначеного на упаковці.

Умови зберігання.

Зберігати в сухому, захищеному від світла місці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері; по 1 або по 3 блістери у картонній коробці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Виробник.

Емкйор Фармасьютікалс Лтд., Індія

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Плот № Р-1 та Р-2, І.Т.В.Т. Парк, Фаза-II, М.I.D.C. Хінджаваді, Пуна, Махараштра, 411057,

Індія