

**ІНСТРУКЦІЯ**  
**для медичного застосування лікарського засобу**

**АЛЕРОН НЕО**  
**(ALERON NEO)**

**Склад:**

*діюча речовина:* левоцетиризин ;

1 таблетка містить левоцетиризину дигідрохлориду 5 мг

*допоміжні речовини:* лактози моногідрат, целюлоза мікрокристалічна, магнію стеарат;

*оболонка:* Opadry® white – гіпромелоза, титану діоксид (Е 171), поліетиленгліколь (ПЕГ 400).

**Лікарська форма.** Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

*Основні фізико-хімічні властивості:* овальні двоопуклі таблетки, вкриті плівковою оболонкою білого або майже білого кольору, з відтиском «L9CZ» з одного боку та «5» – з іншого.

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

**Фармакологічні властивості.**

*Фармакодинаміка.*

Левецетиризин (R-енантіомер цетиризину) є селективним та потужним антагоністом периферичних H<sub>1</sub>-рецепторів. Фармакологічна дія зумовлена блокуванням H<sub>1</sub>-гістамінових рецепторів. Спорідненість до H<sub>1</sub>-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 алергічних реакцій, чинить антиексудативну, протисвербіжну, протизапальну дію, майже не чинить антихолінергічної та антисеротонінової дії.

*Фармакокінетика.*

Фармакокінетика левоцетиризину є лінійною і не залежить від дози та часу. Міжіндивідуальна варіабельність є незначною. Фармакокінетичні параметри левоцетиризину майже не відрізняються від таких у цетиризину.

*Абсорбція.* Препарат після перорального введення швидко та інтенсивно поглинається. Ступінь всмоктування препарату не залежить від дози препарату та не змінюється з прийомом їжі, але максимальна концентрація (C<sub>max</sub>) препарату зменшується та досягає свого максимального значення пізніше.

Біодоступність досягає 100 %.

У 50 % хворих дія препарату розвивається через 12 хв після прийому одноразової дози, а у 95 % — через 0,5-1 годину. C<sub>max</sub> у сироватці крові досягається через 50 хв після одноразового прийому внутрішньотерапевтичної дози та утримується протягом 2 днів. C<sub>max</sub> становить 270 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.

Ступінь зв'язування левоцетиризину з білками плазми крові становить 90 %. Об'єм розподілу левоцетиризину обмежений і становить 0,4 л/кг.

*Біотрансформація.* В організмі людини метаболізму піддається менш ніж

14 % прийнятої дози левоцетиризину, а тому вважається, що різниця, спричинена генетичним поліморфізмом або одночасним застосуванням інгібіторів ферментів, є незначною. Метаболічне перетворення полягає в окисненні ароматичного кільця, N- та

O-деалкілюванні та кон'югації з таурином. Процес деалкілювання переважно проходить з участю CYP 3A4, в той час як в окисненні ароматичного кільця беруть участь численні та/або невизначені ізоформи CYP. Левецетиризин не впливає на активність цитохромних ізоферментів 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4

у концентраціях, що значно перевищують максимальні після прийняття дози 5 мг перорально. Враховуючи низький ступінь метаболізму та відсутність здатності до пригнічення метаболізму, взаємодія левоцетиризину з іншими речовинами (і навпаки) малоімовірна.

**Виведення.** Екскреція препарату відбувається в основному за рахунок клубочкової фільтрації та активної канальцевої секреції. Період напіввиведення препарату з плазми крові у дорослих ( $T_{1/2}$ ) становить  $7,9 \pm 1,9$  години. Загальний кліренс у дорослих –

0,63 мл/хв/кг. В основному виведення левоцетиризину та його метаболітів з організму відбувається із сечею (виводиться в середньому 85,4 % застосованої дози препарату). З фекаліями виводиться лише 12,9 % застосованої дози препарату.

**Ниркова недостатність.** Кліренс левоцетиризину корелює з кліренсом креатиніну. Тому у пацієнтів із помірною та тяжкою нирковою недостатністю рекомендується індивідуально встановлювати інтервали між прийомами левоцетиризину, виходячи з кліренсу креатиніну. У хворих з анурією у термінальній фазі ниркової недостатності загальний кліренс зменшується приблизно на 80 % порівняно зі здоровими добровольцями. При проведенні стандартного 4-годинного гемодіалізу видаляється менше 10 % левоцетиризину.

## **Клінічні характеристики.**

### **Показання.**

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

### **Протипоказання.**

Підвищена чутливість до левоцетиризину або до будь-якого іншого компонента препарату, 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.**

Дослідження з левоцетиризином щодо взаємодії не проводилися. Дослідження з цетиризином (з'єднання рацемату) показали, що одночасне застосування з антипірином, псевдоефедрином, 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 цетиризину (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.

Прийом їжі не впливає на ступінь всмоктування препарату, але знижує швидкість всмоктування.

Немає даних щодо посилення ефекту седативних засобів при застосуванні у терапевтичних дозах. Але слід уникати застосування седативних засобів під час прийому препарату. Оскільки у чутливих людей одночасне застосування цетиризину або левоцетиризину з алкоголем або іншими засобами, що пригнічують центральну нервову систему (наприклад, седативні засоби) може вплинути на центральну нервову систему. Хоча рацемічний цетиризин і не продемонстрував потенціювання дії алкоголю.

### **Особливості застосування.**

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

### **Застосування у період вагітності або годування груддю.**

Левоцетиризин 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 утриматися 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 перорально у добовій дозі 5 мг 1 раз на добу незалежно від прийому їжі. Таблетку необхідно ковтати цілою, запиваючи невеликою кількістю води.

*Застосування пацієнтам літнього віку.* Хворим літнього віку із нормальною функцією нирок корекція дози препарату не потрібна. У разі наявності у пацієнтів даної категорії порушень функції нирок корекцію дози необхідно проводити з урахуванням кліренсу креатиніну відповідно до таблиці.

*Застосування пацієнтам з порушенням функції нирок.*

Дозування повинно бути індивідуальним відповідно до функції нирок.

Хворим із порушеною функцією нирок розрахунок дози необхідно проводити з урахуванням кліренсу креатиніну відповідно до таблиці «Корекція дози препарату для хворих із порушеною функцією нирок». Для застосування цієї таблиці дозування необхідно визначити кліренс креатиніну ( $КЛ_{кр}$ ) пацієнта у мл/хв.  $КЛ_{кр}$  (мл/хв) має бути визначений за вмістом креатиніну у сироватці крові (мг/дл) за допомогою наступної формули:

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

Корекція дози препарату для хворих із порушеною функцією нирок:

Функція нирок	Кліренс креатиніну, мл/хв	Доза і частота прийомів
Нормальна функція нирок	$\geq 80$	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 тяжкого ступеня	$< 30$	5 мг 1 раз на 3 доби
Термінальна стадія хвороби нирок – пацієнти, які перебувають на діалізі	$< 10$	Застосування протипоказане

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

*Застосування пацієнтам із порушенням функції печінки.*

Пацієнти винятково із порушеннями функції печінки не потребують коригування дози.

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 можна запропонувати постійну терапію. При хронічних захворюваннях (хронічний алергічний риніт, хронічна кропив'янка) тривалість лікування становить до 1 року.

**Діти.** Ефективність та безпека застосування препарату дітям віком до 6 років не встановлена, тому препарат не застосовувати пацієнтам цієї вікової категорії.

### **Передозування.**

**Симптоми:** симптоми передозування можуть включати сонливість у дорослих та початкове збудження і підвищену дратівливість у дітей, які змінюються сонливістю.

**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 неефективний.

### **Побічні реакції.**

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

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

**З боку серця:** відчуття 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:** 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 у недоступному для дітей місці.

**Упаковка.** По 7 таблеток у блістері, по 1 або 2, або 4 блістери у картонній коробці, або по 10 таблеток у блістері, 1 або 3 блістери у картонній коробці.

**Категорія відпуску.** Без рецепта.

**Виробник, відповідальний за дозвіл до реалізації.**

Сінтон Іспанія С.Ел.

**Місцезнаходження виробника та адреса його місця провадження діяльності.**

Кастело 1, Полігоно Лас Салінас, 08830, Сант Бої де Лобрегат, Іспанія

**Заявник.**

Актавіс груп АТ, Ісландія.

**Місцезнаходження заявника та/або представника заявника.**

Рейк'явікурвегур 76-78, 220 Хафнарфйордур, Ісландія.