

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата

Зодак® Экспресс

Регистрационный номер: ЛП-002216

Торговое наименование: Зодак® Экспресс

Международное непатентованное наименование: левоцетиризин

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав

В 1 таблетке содержится:

Активное вещество: левоцетиризина дигидрохлорид - 5,00 мг.

Вспомогательные вещества: ядро: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, карбоксиметилкрахмал натрия, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат; *пленочная оболочка:* гипромеллоза 2910/5, макрогол - 6000, тальк, титана диоксид E171.

Описание

Продолговатые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, белого или почти белого цвета, с гравировкой «е» на одной стороне.

Фармакотерапевтическая группа

Противоаллергическое средство – H₁-гистаминовых рецепторов блокатор.

Код АТХ: R06AE09

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Левоцетиризин – активное вещество препарата – это R-энантиомер цетиризина, мощный и селективный антагонист гистамина, блокирующий H₁-гистаминовые рецепторы.

Левоцетиризин оказывает влияние на гистаминозависимую стадию аллергических реакций, а также уменьшает миграцию эозинофилов, уменьшает проницаемость сосудов, ограничивает высвобождение медиаторов воспаления.

Левоцетиризин предупреждает развитие и облегчает течение аллергических реакций, обладает противоэкссудативным, противозудным действием, практически не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия. В терапевтических дозах практически не оказывает седативного эффекта.

После приема внутрь противоаллергическое действие левоцетиризина продолжается в

течение 24 часов.

Фармакокинетика

Фармакокинетические параметры левоцетиризина изменяются линейно и практически не отличаются от фармакокинетики цетиризина.

Всасывание

После приема внутрь препарат быстро и полностью абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. Прием пищи не влияет на полноту абсорбции, хотя скорость ее уменьшается. У взрослых после однократного приема препарата в терапевтической дозе (5 мг) максимальная концентрация (C_{max}) в плазме крови достигается через 0,9 ч и составляет 270 нг/мл, после повторного приема в дозе 5 мг - 308 нг/мл. Равновесная концентрация достигается через 2 суток.

Распределение

Левоцетиризин на 90 % связывается с белками плазмы крови. Объем распределения (V_d) составляет 0,4 л/кг. Биодоступность достигает 100 %.

Метаболизм

В небольших количествах (< 14%) левоцетиризин метаболизируется в организме путем N- и O-деалкилирования (в отличие от других антагонистов H₁-гистаминовых рецепторов, которые метаболизируются в печени с помощью системы цитохромов) с образованием фармакологически неактивного метаболита.

Из-за незначительного метаболизма и отсутствия метаболического потенциала взаимодействие левоцетиризина с другими лекарственными препаратами представляется маловероятным.

Выведение

У взрослых период полувыведения ($T_{1/2}$) составляет $7,9 \pm 1,9$ ч; у маленьких детей $T_{1/2}$ укорочен. У взрослых общий клиренс составляет 0,63 мл/мин/кг. Около 85,4 % принятой дозы препарата выводится почками в неизменном виде путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции; около 12,9 % - через кишечник.

Фармакокинетика у особых групп пациентов

Пациенты с почечной недостаточностью

У пациентов с почечной недостаточностью (клиренс креатинина (КК) < 40 мл/мин) клиренс препарата уменьшается, а $T_{1/2}$ удлиняется (так, у больных, находящихся на гемодиализе, общий клиренс снижается на 80 %), что требует соответствующего изменения режима дозирования. Менее 10 % левоцетиризина удаляется в ходе стандартной 4-часовой процедуры гемодиализа.

Дети

Данные по исследованию фармакокинетики препарата у 14 детей в возрасте от 6 до 11 лет с массой тела от 20 до 40 кг при пероральном приеме однократно 5 мг левоцетиризина показали, что показатели C_{max} и площадь под кривой (AUC) примерно в два раза превышают аналогичные показатели у взрослых здоровых людей при перекрестном контроле. Средний показатель C_{max} составил 450 нг/мл, максимальная концентрация достигалась в среднем через 1,2 часа, общий клиренс с учетом массы тела был на 30% выше, а период полувыведения на 24% короче у детей, чем соответствующие показатели у взрослых. Ретроспективный фармакокинетический анализ проведен у 324 пациентов (у детей в возрасте от 1 до 11 лет и взрослых в возрасте от 18 до 55 лет), получавших одну или несколько доз левоцетиризина от 1,25 мг до 30 мг. Данные, полученные в ходе анализа, показали, что прием препарата в дозе 1,25 мг у детей в возрасте до 5 лет приводит к концентрации в плазме, соответствующей таковой у взрослых при приеме 5 мг препарата один раз в сутки.

Пожилые пациенты

Данные по фармакокинетике у пожилых пациентов ограничены. При повторном приеме 30 мг левоцетиризина один раз в сутки в течение 6 дней у пожилых пациентов (возраст от 65 до 74 лет) общий клиренс был приблизительно на 33% ниже, чем таковой у взрослых более молодого возраста. Было показано, что распределение рацемата цетиризина больше зависит от функции почек, чем от возраста. Это утверждение также может быть применимо и к левоцетиризину, так как оба препарата и левоцетиризин, и цетиризин выводятся преимущественно с мочой. Поэтому, у пожилых пациентов доза левоцетиризина должна быть скорректирована в зависимости от функции почек.

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 том числе хроническая идиопатическая крапивница);
- другие аллергические дерматозы, сопровождающиеся кожным зудом и высыпаниями.

Противопоказания

- Гиперчувствительность к левоцетиризину, цетиризину, гидроксизину, и другим производным пиперазина или к любому из вспомогательных компонентов препарата;
- терминальная стадия почечной недостаточности (КК менее 10 мл/мин);

- 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

- Хроническая почечная недостаточность (требуется коррекция режима дозирования);
- у пациентов пожилого возраста (при возрастном снижении скорости клубочковой фильтрации);
- у пациентов с предрасполагающими факторами к задержке мочи (повреждения спинного мозга, гиперплазия предстательной железы и др.);
- хронические заболевания печени (гепатоцеллюлярный, холестатический или билиарный цирроз печени) (коррекция дозы требуется только при сопутствующем снижении скорости клубочковой фильтрации);
- одновременный прием с алкоголем (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»);
- при беременности и в период грудного вскармливания.
- У пациентов с эпилепсией и риском развития судорог (см. раздел «Особые указания»).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Данные по применению левоцетиризина во время беременности практически отсутствуют или ограничены (менее 300 исходов беременностей). Однако, применение цетиризина, рацемата левоцетиризина, при беременности (более 1000 исходов беременностей) не сопровождалось пороками развития и внутриутробным и неонатальным токсическим воздействием. В исследованиях на животных не выявлено прямого или косвенного неблагоприятного влияния на течение беременности, эмбриональное и фетальное развитие, роды и постнатальное развитие.

При назначении левоцетиризина беременным следует соблюдать осторожность.

Период грудного вскармливания

Цетиризин, рацемат левоцетиризина, экскретируется с грудным молоком. Поэтому также вероятно и выделение левоцетиризина с грудным молоком. У детей, находящихся на грудном вскармливании, возможно появление побочных реакций на левоцетиризин. Поэтому необходимо соблюдать осторожность при назначении левоцетиризина в период грудного вскармливания.

Фертильность

Клинические данные по левоцетиризину отсутствуют.

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).

Если после лечения улучшения не наступает или появляются новые симптомы, необходимо проконсультироваться с врачом.

Применяйте препарат только согласно тому способу применения и в тех дозах, которые указаны в инструкции. В случае необходимости, пожалуйста, проконсультируйтесь с врачом перед применением лекарственного препарата.

Пациенты пожилого возраста

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

Пациенты с нарушением функции почек

При назначении препарата пациентам с нарушением функции почек в случае, когда альтернативное лечение не может быть назначено, дозу следует корректировать в зависимости от величины КК, поскольку левоцетиризин выводится из организма в основном почками.

КК для мужчин можно рассчитать, исходя из концентрации сывороточного креатинина, по следующей формуле:

$$\text{КК (мл/мин)} = \frac{[140 - \text{возраст (годы)}] \times \text{масса тела (кг)}}{72 \times \text{КК}_{\text{сыворот}} \text{ (мг/дл)}}$$

КК для женщин можно рассчитать, умножив полученное значение на коэффициент 0,85.

Коррекция дозы у пациентов с нарушением функции почек:

Почечная недостаточность	КК (мл/мин)	Доза и кратность приема
Норма	≥ 80	5 мг один раз в сутки
Легкая	50-79	5 мг один раз в сутки
Умеренная	30-49	5 мг один раз в 2 суток
Тяжелая	<30	5 мг один раз в 3 суток
Терминальная стадия — пациенты на диализе	<10	Противопоказано

У детей с нарушением функции почек дозу корректируют индивидуально с учетом КК и массы тела. Специальных рекомендаций по применению у детей с нарушением функции почек нет.

Пациенты с нарушением функции печени

При изолированном нарушении функции печени коррекции дозы не требуется.

Взрослым пациентам с нарушением функции печени и почек дозирование осуществляют согласно таблице, приведенной выше.

Продолжительность лечения

При лечении сезонного (интермиттирующего) ринита (наличие симптомов менее 4 дней в неделю или их общая продолжительность менее 4-х недель) продолжительность лечения зависит от длительности симптоматики; лечение может быть прекращено при исчезновении симптомов и возобновлено при появлении симптомов.

При лечении круглогодичного (персистирующего) аллергического ринита (наличие симптомов более 4-х дней в неделю и их общая продолжительность более 4-х недель) лечение может продолжаться в течение всего периода воздействия аллергенов.

Имеется клинический опыт непрерывного применения левоцетиризина в лекарственной форме таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 5 мг у взрослых пациентов длительностью до 6 месяцев.

Если вы принимаете или недавно принимали другие препараты, сообщите об этом лечащему врачу.

Если Вы забыли принять препарат Зодак® Экспресс, не принимайте двойную дозу для компенсации пропущенной, примите следующую дозу в обычное время.

Побочное действие

По данным Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ) нежелательные эффекты классифицированы в соответствии с их частотой развития следующим образом: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$) и очень редко ($< 1/10000$); частота неизвестна (частоту возникновения явлений нельзя определить на основании имеющихся данных).

Клинические исследования

Во время проведения клинических исследований у мужчин и женщин 12 - 71 лет наиболее часто встречались следующие побочные реакции: головная боль, сонливость, сухость во рту, утомляемость, нечасто: астения и боль в животе.

Во время проведения клинических исследований у детей в возрасте от 6 до 12 лет

наиболее часто встречались головная боль и сонливость.

Пострегистрационные исследования

В период пострегистрационного применения препарата наблюдались следующие побочные эффекты, частота которых неизвестна.

Нарушения со стороны иммунной системы

Реакции гиперчувствительности, в том числе анафилактические реакции.

Нарушения психики

Тревога, агрессивность, агитация, галлюцинации, депрессия, бессонница, суицидальные мысли.

Нарушения со стороны нервной системы

Судороги, тромбоз синусов твердой мозговой оболочки, парестезия, головокружение, обморок, тремор, дизгевзия.

Нарушения со стороны обмена веществ и питания

Повышенный аппетит.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения

Вертиго.

Нарушения со стороны органа зрения

Нарушение зрения, нечеткость зрительного восприятия, воспалительные проявления, произвольные движения глазных яблок (нистагм).

Нарушения со стороны сердца

Стенокардия, ощущение сердцебиения, тахикардия

Нарушения со стороны сосудов

Тромбоз яремной вены.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Одышка, усиление симптомов ринита.

Нарушения со стороны желудочно - кишечного тракта

Тошнота, рвота, диарея.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Гепатит.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

Дизурия, задержка мочи.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Ангионевротический отек, кожный зуд, кожная сыпь, стойкая лекарственная эритема, крапивница, гипотрихоз, трещины, фотосенсибилизация.

Нарушения со стороны скелетно - мышечной и соединительной ткани

Миалгия, артралгия.

Общие расстройства и нарушения в месте введения

Периферические отеки, сухость слизистых оболочек.

Влияние на результаты лабораторных и инструментальных исследований

Отклонение от нормы показателей функции печени, увеличение массы тела, перекрестная реактивность.

Если любые из указанных побочных эффектов усугубляются, или Вы заметили любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

Передозировка

Симптомы

Симптомы передозировки могут включать сонливость у взрослых, возбуждение и 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.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Изучение взаимодействия левоцетиризина с другими лекарственными препаратами, включая исследования с индукторами изофермента CYP3A4, не проводилось.

При изучении лекарственного взаимодействия рацемата цетиризина с антипирином, феназоном, псевдоэфедрином, циметидином, кетоконазолом, эритромицином, азитромицином, глипизидом и диазепамом клинически значимых лекарственных взаимодействий не выявлено.

При одновременном назначении с теофиллином (400 мг в сутки) общий клиренс цетиризина снижается на 16 % (кинетика теофиллина не меняется).

В исследовании при одновременном приеме ритановира (600 мг 2 раза в день) и цетиризина (10 мг в день) показано, что экспозиция цетиризина увеличивалась на 40 %, а экспозиция ритановира изменялась незначительно (-11 %).

В ряде случаев при одновременном применении левоцетиризина с алкоголем или лекарственными препаратами, оказывающими подавляющее влияние на центральную нервную систему (ЦНС), возможно усиление их влияния на ЦНС, хотя не доказано, что рацемат цетиризина потенцирует эффект алкоголя.

Особые указания

Применение препарата в форме таблеток, покрытых пленочной оболочкой, противопоказано у детей до 6 лет, так как такая форма выпуска не обеспечивает возможности коррекции дозы.

Пациентам с почечной недостаточностью умеренной степени тяжести и тяжелой почечной недостаточностью рекомендуется увеличение интервалов между приемами препарата Зодак® Экспресс в соответствии с показателем КК.

При применении препарата Зодак® Экспресс у пациентов с повреждением спинного мозга, гиперплазией предстательной железы, а также при наличии других предрасполагающих факторов к задержке мочи, требуется соблюдение осторожности, так как левоцетиризин может увеличивать риск развития задержки мочи.

При применении препарата Зодак® Экспресс у пациентов с эпилепсией и у пациентов с риском возникновения судорог требуется соблюдение осторожности, поскольку левоцетиризин может вызывать развитие судорожного синдрома (см. раздел «С осторожностью»).

Во время применения препарата Зодак® Экспресс пациентам рекомендуется воздержаться от употребления алкогольных напитков.

В состав продукта входит лактозы моногидрат; пациентам с редкими наследственными заболеваниями, сопровождающимися непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы (дефицит лактазы Лаппа) или при синдроме мальабсорбции глюкозы/галактозы данный лекарственный препарат противопоказан.

Внимательно прочтите инструкцию перед тем, как начать применение препарата. Сохраните инструкцию, она может понадобиться вновь. Если у Вас возникли вопросы, обратитесь к врачу. Лекарственный препарат, которым Вы лечитесь предназначен лично Вам, и его не следует передавать другим лицам, поскольку оно может причинить им вред даже при наличии тех же симптомов, что и у Вас.

Влияние лекарственного препарата на способность управлять транспортными средствами и механизмами

Левоцетиризин может привести к повышенной сонливости, следовательно, он может оказывать влияние на способность управлять автомобилем или работать с техникой. В период лечения необходимо воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 5 мг.

По 7 или 10 таблеток в PVC/Aclar/PVC/Al или Al/Al блистер. По 1 или 4 блистера по 7 таблеток; по 2 блистера по 10 таблеток вместе с инструкцией по применению помещают в картонную пачку.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

Отпускают без рецепта.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение

АО «Санофи Россия», Россия.

Производитель и фасовщик (первичная упаковка)

Зентива к.с., Чешская Республика.

У кабеловны 130, 10237, Прага 10, Долни Мехолупы, Чешская Республика.

Упаковщик (вторичная (потребительская) упаковка) и выпускающий контроль качества

1. Зентива к.с., Чешская Республика.

У кабеловны 130, 10237, Прага 10, Долни Мехолупы, Чешская Республика.

2. АО «ОРТАТ», Россия

157092, Костромская обл., Сусанинский район, с. Северное, мкр. Харитоново

Претензии по качеству препарата направлять по адресу в России

125009, г. Москва, ул. Тверская, 22.

Телефон: (495) 721-14-00.

Факс: (495) 721-14-11.