

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

**Аллерсет**  
**(Allercet)**

**Склад:**

*діюча речовина:* левоцетиризину дигідрохлорид;

1 таблетка, вкрита плівковою оболонкою, містить левоцетиризину дигідрохлориду 5 мг;

*допоміжні речовини:* лактоза, моногідрат (Pharmatose 200M), целюлоза мікрокристалічна (Avicel PH 102), лактоза, моногідрат (Super Tab 11SD), кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат;

*склад плівкового покриття:* Опадрай Y-1-7000 білий (гіпромелоза, титану діоксид (E 171), макрогол).

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

*Основні фізико-хімічні властивості:* овальні двоопуклі таблетки, вкриті плівковою оболонкою, білого кольору, з гравіюванням «I» та «12» з одного боку та роздільною рискою з іншого боку.

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

**Фармакологічні властивості.**

*Фармакодинаміка.*

Левоцетиризин – це активний стабільний R-енантіомер цетиризину, що належить до групи конкурентних антагоністів гістаміну. Фармакологічна дія зумовлена блокуванням H<sub>1</sub>-гістамінових рецепторів. Спорідненість із H<sub>1</sub>-гістаміновими рецепторами у левоцетиризину у 2 рази вища, ніж у цетиризину. Левоцетиризин впливає на гістамінзалежну стадію розвитку алергічної реакції, зменшує міграцію еозинофілів, судинну проникність, обмежує вивільнення медіаторів запалення. Попереджає розвиток та пригнічує перебіг алергічних реакцій, чинить антиексудативну, протисвербіжну, протизапальну дію, майже не чинить антихолінергічної та антисеротонінової дії.

*Фармакокінетика.*

Фармакокінетичні параметри левоцетиризину мають лінійну залежність та не залежать від дози та часу і мають низьку варіабельність у різних пацієнтів. Фармакокінетичний профіль при введенні єдиного енантіомера такий самий, як і при застосуванні цетиризину. В процесі абсорбції або виведення не спостерігається хіральної інверсії.

*Абсорбція.* Препарат після перорального застосування швидко та інтенсивно поглинається. Ступінь всмоктування препарату не залежить від дози препарату та не змінюється із вживанням їжі, але максимальна концентрація (C<sub>max</sub>) препарату зменшується та досягається пізніше. Біодоступність становить 100 %.

Дія препарату розвивається через 12 хвилин після прийому одноразової дози у 50 % хворих, а через 0,5–1 годину — у 95 % хворих. У дорослих C<sub>max</sub> у сироватці крові досягається через 50 хвилин після одноразового прийому внутрішньо терапевтичної дози. Рівноважна концентрація у крові досягається після 2 днів прийому препарату. C<sub>max</sub> становить 270 нг/мл після одноразового застосування і 308 нг/мл після повторного застосування дози 5 мг 1 раз



Узгоджено з матеріалами  
реєстраційного досьє



на добу.

**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 (ЦНС). Розподіл левоцетиризину обмежений, тому що об'єм розподілу становить 0,4 л/кг. Зв'язування з білками плазми крові людини – 90 %.

**Біотрансформація.** В організмі людини рівень метаболізму становить менше 14 % від дози левоцетиризину, тому відмінність в результаті генетичного поліморфізму або супутнього прийому ферментних інгібіторів, як очікується, буде незначною. Процес метаболізму включає ароматичну оксидацію, N- та O-деалкілювання і сполучення з таурином. Деалкілювання відбувається насамперед за участю цитохрому CYP 3A4, тоді як у процесі ароматичної оксидації беруть участь численні та/або невизначені ізоформи CYP. Левоцетиризин не впливає на активність цитохромних ізоферментів 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4 у концентраціях, що значно перевищують максимальні, після перорального застосування дози у 5 мг. З огляду на низький ступінь метаболізму та відсутність здатності до пригнічення метаболізму, взаємодія левоцетиризину з іншими речовинами (і навпаки) малоімовірна.

**Виведення.** Екскреція препарату відбувається двома шляхами: за рахунок клубочкової фільтрації та активної каналцевої секреції. Період напіввиведення препарату з плазми крові у дорослих ( $T_{1/2}$ ) становить  $7,9 \pm 1,9$  години.  $T_{1/2}$  препарату у дітей молодшого віку коротший. Середній очевидний загальний кліренс у дорослих – 0,63 мл/хв/кг. В основному виведення левоцетиризину та його метаболітів з організму відбувається із сечею (виводиться у середньому 85,4 % застосованої дози препарату). З фекаліями виводиться лише 12,9 % застосованої дози препарату.

#### Особливі популяції

##### *Порушення функції нирок*

Очевидний кліренс левоцетиризину корелює із кліренсом креатиніну, тому пацієнтам із помірними та тяжкими порушеннями функції нирок рекомендується підбирати інтервали між прийомами левоцетиризину з урахуванням кліренсу креатиніну. При анурії у пацієнтів із термінальною стадією захворювання нирок загальний кліренс зменшується приблизно на 80 % порівняно із загальним кліренсом у осіб без таких порушень. Кількість левоцетиризину, що виводиться під час стандартної 4-годинної процедури гемодіалізу, становила <10 %.

#### **Клінічні характеристики.**

##### **Показання.**

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

##### **Противоказання.**


Підвищена чутливість до левоцетиризину, цетиризину, гідроксизину та до будь-яких інших похідних піперазину або до будь-якої іншої допоміжної речовини препарату.

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 взаємодії левоцетиризину (у т.ч. з індукторами CYP3A4) не проводили. Дослідження взаємодії цетиризину (сполука рацемату) показали, що при одночасному застосуванні з антипірином, азитроміцином, циметидином, діазепамом, еритроміцином, гліпізидом, кетоконазолом або псевдоефедрином не було виявлено клінічно значущих несприятливих ефектів. При сумісному застосуванні з теофіліном (400 мг на добу) у дослідженні багаторазового застосування спостерігалось невелике зниження (на 16 %)

 Згоджено з матеріалами  
реєстраційного дос'є



кліренсу цетиризину (розподіл теофіліну не змінювався). При дослідженні багаторазового введення ритонавіру (600 мг 2 рази на добу) та цетиризину (10 мг на добу) експозиція цетиризину збільшувалася приблизно на 40 %, тоді як розподіл ритонавіру при супутньому застосуванні цетиризину дещо змінювався (-11 %).

Немає даних щодо посилення ефекту седативних засобів при застосуванні у терапевтичних дозах, але слід уникати застосування седативних засобів під час прийому препарату.

Вживання їжі не впливає на ступінь всмоктування препарату, але одночасне вживання їжі знижує швидкість його абсорбції.

Одночасне застосування цетиризину або левоцетиризину з алкоголем або іншими депресантами ЦНС у чутливих пацієнтів може спричинити додаткове зниження уваги та здатності до виконання роботи.

### **Особливості застосування.**

Препарат слід 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 (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

При призначенні препарату пацієнтам із факторами, що провокують затримку сечі (наприклад, травмами спинного мозку, гіперплазією передміхурової залози), необхідно брати до уваги, що левоцетиризин збільшує ризик затримки сечі.

Левоцетиризин слід з обережністю застосовувати пацієнтам з епілепсією та ризиком виникнення судом, оскільки його застосування може призвести до посилення нападу.

Антигістамінні препарати пригнічують відповідь на шкірну алергічну пробу, прийом препарату необхідно припинити за 3 дні до її проведення (період виведення).

Можлива поява свербіжів після припинення застосування левоцетиризину, навіть якщо цей симптом не був наявний до початку лікування. Симптом може зникнути самостійно. У деяких випадках симптом може бути інтенсивним і може виникнути потреба у повторному лікуванні. Симптом повинен зникнути після початку повторного лікування.

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 призначати левоцетиризин у лікарській формі, придатній для застосування у педіатрії.

При встановленні непереносимості деяких цукрів необхідно проконсультуватися з лікарем, перш ніж приймати цей лікарський засіб.

### **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.

### **Фертильність**

Немає клінічних даних (включаючи дослідження на тваринах) щодо впливу левоцетиризину на фертильність.

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

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

### **Спосіб застосування та дози.**

Препарат призначати дорослим та дітям віком від 6 років.

### **Рекомендовані дози**

Дорослі та діти віком від 12 років: добова доза становить 5 мг (1 таблетка, вкрита плівковою



Узгоджено з матеріалами  
реєстраційного досьє



оболонкою) 1 раз на добу.

#### *Пацієнти літнього віку*

Пацієнтам літнього віку з нормальною функцією нирок корекція дози препарату не потрібна.

Коригування дози рекомендовано пацієнтам літнього віку із порушеннями функції нирок від помірного до важкого ступеня (див. підрозділ «Ниркова недостатність»).

#### *Ниркова недостатність*

Пацієнтам із порушеннями функції нирок розрахунок дози необхідно проводити з урахуванням ступеня порушення функції нирок (кліренсу креатиніну) відповідно до таблиці, наведеної нижче.

Для цього потрібно визначити кліренс креатиніну (КЛ<sub>кр</sub>) пацієнта у мл/хв за вмістом креатиніну в сироватці крові (мг/дл), використовуючи таку формулу:

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

#### Корекція дози препарату для пацієнтів із порушеннями функції нирок

Функція нирок	Кліренс креатиніну, мл/хв	Доза та 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
Термінальна стадія захворювання нирок Пацієнти, які перебувають на діалізі	<10	Протипоказано

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

Специфічних даних щодо застосування дітям із порушеннями функції нирок немає.

#### *Печінкова недостатність*

Пацієнтам із печінковою недостатністю корекція режиму дозування не потрібна. Пацієнтам із печінковою та нирковою недостатністю слід коригувати режим дозування відповідно до наведеної вище таблиці.

#### *Педіатрична популяція*

Діти віком від 6 до 12 років: рекомендована добова доза – 5 мг (1 таблетка, вкрита плівковою оболонкою).

Для дітей віком від 2 до 6 років неможливо коригувати дози препарату у даній лікарській формі. Рекомендовано призначати левоцетиризин у лікарській формі, придатній для застосування в педіатрії.

#### Спосіб застосування

Приймати таблетку внутрішньо, незалежно від вживання їжі. Таблетку необхідно ковтати цілою, запиваючи невеликою кількістю води. Рекомендовано застосовувати добову дозу за один прийом.

#### Тривалість застосування

Пацієнтів із періодичним алергічним ринітом (тривалість прояву симптомів захворювання становить менше 4 днів на тиждень або менше 4 тижнів на рік) слід лікувати відповідно до перебігу захворювання та анамнезу: лікування можна припинити, якщо симптоми зникнуть, та можна відновити знову при повторному виникненні симптомів. У разі стійкого

Узгоджено з матеріалами  
реєстраційного досьє



алергічного риніту (тривалість прояву симптомів захворювання становить більше 4 днів на тиждень або більше 4 тижнів на рік) у період контакту з алергенами пацієнту може бути запропонована постійна терапія. Існує клінічний досвід застосування левоцетиризину протягом щонайменше 6-місячного періоду лікування. 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 призначати левоцетиризин у лікарській формі, придатній для застосування в педіатрії.

#### **Передозування.**

*Симптоми.* Симптоми передозування у дорослих можуть включати сонливість. У дітей спочатку можуть виникнути збудження і підвищена дратівливість з подальшою сонливістю.

*Лікування.* Специфічного антидоту до левоцетиризину немає. У разі появи симптомів передозування рекомендується симптоматична та підтримуюча терапія. Можна розглянути можливість промивання шлунка через короткий час після застосування препарату. Гемодіаліз для виведення левоцетиризину з організму є неефективним.

#### **Побічні реакції.**

*З боку імунної системи:* гіперчутливість, включаючи анафілаксію.

*З боку обміну речовин та харчування:* підвищений апетит.

*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, жахливі сновидіння.

*З боку серця:* посилене серцебиття, тахікардія.

*З боку органів зору:* порушення зору, нечіткість зору, неконтрольовані кругові рухи очних яблук.

*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 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, артралгія.

*Загальні порушення:* набряк.

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

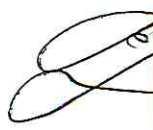
#### Опис окремих побічних реакцій

Повідомляли про свербіж після припинення застосування левоцетиризину.

**Термін придатності.** 3 роки.

#### **Умови зберігання.**

Зберігати при температурі не вище 30 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці.

 Узгоджено з матеріалами  
реєстраційного досьє



**Упаковка.**

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

**Категорія відпуску.** Без рецепта.

**Виробник.**

МІКРО ЛАБС ЛІМІТЕД/МІСРО ЛАБС ЛІМІТЕД.

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

Ділянка №. S.155 – S.159 та N1, Промислова зона Верна, Фаза III та Фаза IV, Верна Салкетт, In-403 722, Індія/PLOT NO. S.155 TO S.159 & N1 VERNA INDUSTRIAL ESTATE, PHASE III & PHASE IV, VERNA SALCETTE, IN-403 722, India.

**Дата останнього перегляду.**



Узгоджено з матеріалами  
реєстраційного досьє

Також узгоджено  
Лісєнко А.С.  
