



ИНСТРУКЦИЯ ПО ПРИМЕНЕНИЮ
ЗОДАК® ЭКСПРЕСС
ZODAC EXPRESS

Торговое название препарата: Зодак® Экспресс

Действующее вещество (МНН): левоцетиризина дигидрохлорид

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Состав:

В 1 таблетке содержится:

активное вещество: левоцетиризина дигидрохлорид – 5,00 мг;

вспомогательные вещества:

ядро: лактозы моногидрат – 67,50 мг, целлюлоза микрокристаллическая – 25,00 мг, карбоксиметилкрахмал натрия – 1,00 мг, кремния диоксид коллоидный – 0,50 мг, магния стеарат – 1,00 мг.

пленочная оболочка: гипромелоза 2910/5 – 3,30 мг, макрогол 6000 – 0,35 мг, тальк – 0,85 мг, титана диоксид E171 – 0,50 мг.

Описание: продолговатые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, белого или почти белого цвета с выдавленной буквой «e» на одной из сторон.

Фармакотерапевтическая группа: противоаллергическое средство – H1-гистаминовых рецепторов блокатор.

Код АТХ: R06AE09.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Левецетиризин, (R)-энантиомер цетиризина, является ингибитором периферических H1-гистаминовых рецепторов, средство которого в 2 раза выше, чем у цетиризина. После однократного приема левецетиризина наблюдалось связывание H1-гистаминовых рецепторов на 90% через 4 часа и на 57% через 24 часа.

Левецетиризин оказывает влияние на гистаминозависимую стадию аллергических реакций, уменьшает миграцию эозинофилов, уменьшает сосудистую проницаемость, ограничивает высвобождение медиаторов воспаления, предупреждает развитие и облегчает течение аллергических реакций, оказывает антиэкссудативное, противозудное действие, практически не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия, в терапевтических дозах практически не оказывает седативного действия. Действие левецетиризина начинается через 12 минут после приема однократной дозы у 50% пациентов, через 1 час у 95% пациентов и продолжается в течение 24 часов. Прием левецетиризина не оказывает влияния на интервал QT на ЭКГ.

Фармакокинетика

Фармакокинетика левецетиризина носит линейный характер, не зависит от дозы и времени и варьируется незначительно у разных пациентов.

После приема внутрь левецетиризин быстро и полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта.

Прием пищи не влияет на полноту абсорбции, хотя скорость ее снижается.

Максимальная плазменная концентрация достигается через 0,9 ч (54 мин) после приема препарата.

Равновесная концентрация устанавливается через 2 дня. Максимальная плазменная концентрация после однократного приема 5 мг левецетиризина составляет 270 нг/мл, а после повторного приема в дозе 5 мг – 308 нг/мл.

Левосетиризин на 90% связывается с белками плазмы. Объем распределения составляет 0,4 л/кг.

Данные по распределению левосетиризина в тканях и его проникновению через гематоэнцефалический барьер у человека отсутствуют.

Левосетиризин метаболизируется в небольших количествах (< 14%) 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.

Благодаря ограниченному метаболизму и отсутствию метаболической ингибирующей активности, взаимодействие левосетиризина на уровне метаболизма с другими веществами маловероятно.

Период полувыведения (T_{1/2}) у взрослых составляет 7-10 часов; у маленьких детей T_{1/2} укорочен.

Средний наблюдаемый общий клиренс – 0,63 мл/мин/кг. Левосетиризин преимущественно выводится в неизменном виде с мочой, в среднем, около 85,4% от принятой дозы путем клубочковой фильтрации и активной канальцевой секреции. Выведение через кишечник (с калом) составляет только 12,9% от принятой дозы.

Пациенты с почечной недостаточностью

Общий клиренс левосетиризина зависит от клиренса креатинина (КК). Поэтому пациентам с умеренной и тяжелой почечной недостаточностью рекомендуется увеличение интервалов между приемами препарата в соответствии с КК. У пациентов с анурией и терминальной стадией почечной недостаточности общий клиренс левосетиризина снижается приблизительно на 80% по сравнению со здоровыми людьми. Количество левосетиризина, выводимого при стандартной 4-х часовой процедуре гемодиализа, составляет менее 10%.

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.
- Отек Квинке (в качестве вспомогательной терапии).
- Другие аллергические дерматозы, сопровождающиеся зудом и высыпаниями.

Способ применения и дозы

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, следует принимать внутрь, не разжевывая и запивая жидкостью, независимо от приема пищи. Рекомендуется принимать суточную дозу в один прием.

Взрослые и подростки и дети старше 12 лет

Рекомендуемая суточная доза составляет 5 мг (1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой).

Пациенты пожилого возраста

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

Пациенты с нарушением функции почек: интервал между приемами препарата определяют индивидуально с учетом функции почек. Информация о коррекции дозы приведена в таблице ниже. Для ее использования необходимо рассчитать клиренс креатинина (КК) у пациента в мл/мин на основании концентрации креатинина в сыворотке (мг/дл) с использованием следующей формулы:

$$\text{КК} = \frac{[140 - \text{возраст(лет)}] \times \text{вес (кг)}}{72 \times \text{креатинин сыворотки (мг/дл)}} \times 0,85 \text{ для женщин}$$

Коррекция дозы у пациентов с нарушением функции почек:

Группа	Клиренс креатинина (мл/мин)	Доза и кратность приема
Нормальная функция	≥ 80	5 мг один раз в сутки
Легкая ХПН	50-79	5 мг один раз в сутки
Умеренная ХПН	30-49	5 мг один раз в 2 суток
Тяжелая ХПН	<30	5 мг один раз в 3 суток
Терминальная ХПН — пациенты на диализе	<10	Противопоказано

У детей с нарушением функции почек дозу корректируют индивидуально с учетом клиренса креатинина и веса тела. Отдельных данных о детях с нарушением функции почек нет.

Пациенты с нарушением функции печени

При изолированном нарушении функции печени коррекции дозы не требуется. У пациентов с печеночно-почечной недостаточностью рекомендуется коррекция дозы (см. «Пациенты с нарушением функции почек» выше).

Продолжительность лечения

Лечение аллергического ринита проводят в соответствии с течением заболевания; прием препарата можно прекратить при исчезновении симптомов и возобновить при рецидиве. В случае хронического аллергического ринита может быть прописано продолжительное лечение в период действия аллергенов.

В настоящее время клинический опыт применения левоцетиризина в виде таблеток, покрытых пленочной оболочкой, 5 мг ограничен 6-ю месяцами.

Побочные действия

Побочные эффекты левоцетиризина разделены по системно-органным классам в соответствии с классификацией Медицинского словаря по нормативно-правовой деятельности (MedDRA) с указанием частоты их встречаемости: часто ($\geq 1/100$ и $1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$ и $< 1/100$); очень редко ($< 1/10000$).

Частота побочных реакций, приведенных ниже, определялась соответственно следующему (классификация Всемирной организации здравоохранения): очень часто – более $1/10$; часто – от более $1/100$ до менее $1/10$; нечасто – от более $1/1000$ до менее $1/100$; редко – от более $1/10000$ до менее $1/1000$; очень редко – от менее $1/10000$, включая отдельные сообщения.

Нарушения со стороны иммунной системы

Очень редко: реакции гиперчувствительности, в том числе анафилактические реакции.

Нарушения со стороны нервной системы

Часто: головная боль.

Нечасто: сонливость.

Очень редко: агрессия, возбуждение, галлюцинации, депрессия, судороги.

Нарушения со стороны органов зрения

Очень редко: зрительные расстройства.

Нарушения со стороны сердца

Очень редко: ощущение сердцебиения, тахикардия.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Очень редко: одышка.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто: сухость слизистой оболочки полости рта.

Нечасто: боли в животе.

Очень редко: тошнота, диарея.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Очень редко: гепатит.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Очень редко: ангионевротический отек, зуд, сыпь, включая лекарственную сыпь, крапивница.

Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани

Очень редко: миалгия.

Общие нарушения

Часто: утомляемость.

Нечасто: астения.

Нарушения со стороны лабораторных и инструментальных данных

Очень редко: нарушение показателей функции печени, увеличение массы тела.

Противопоказания

- Гиперчувствительность к левоцетиризину и другим производным пиперазина или к любому из вспомогательных компонентов препарата.

- Терминальная почечная недостаточность с КК менее 10 мл/мин.

- Беременность.

- Детский 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

- Необходимо соблюдать осторожность при одновременном приеме с алкоголем (см. раздел «Лекарственные взаимодействия»).

- Хроническая почечная недостаточность с КК более 10 мл/мин, но менее 50 мл/мин (требуется коррекция режима дозирования).

- Пожилой возраст (возможно снижение клубочковой фильтрации).

Лекарственные взаимодействия

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

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

При одновременном назначении с теофиллином (400 мг/сут) 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 незначительно изменялась (-11 %).

У чувствительных пациентов одновременный прием левоцетиризина и алкоголя или других веществ, угнетающе воздействующих на центральную нервную систему (ЦНС), может усиливать влияние на ЦНС, хотя было показано, что рацемат цетиризина не усиливает действие алкоголя.

Особые указания

Во время лечения препаратом не рекомендуется принимать этанол.

Применение при беременности и лактации

Применение препарата при беременности противопоказано.

Левоцетиризин выделяется с грудным молоком, поэтому при необходимости применения препарата при лактации рекомендуется прекратить грудное вскармливание.

Влияние на способность управления транспортными средствами или заниматься другими потенциально опасными видами деятельности.

Левосетиризин, при его приеме в рекомендованных дозах, не оказывает отрицательного влияния на внимание и скорость психомоторных реакций и способность управлять транспортными средствами. Тем не менее, в период приема препарата целесообразно воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Передозировка

Симптомы

Симптомы передозировки могут включать сонливость у взрослых и возбуждение и беспокойство, сменяющиеся сонливостью, у детей.

Лечение

Специфических антидотов левосетиризина нет.

В случае передозировки рекомендуется симптоматическое или поддерживающее лечение. Если после приема препарата прошло немного времени, следует провести промывание желудка. Левосетиризин практически не выводится при гемодиализе.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 5 мг

По 7 или 10 таблеток в блистере из Ал/Ал, или ПВХ/Аклар/Ал или ПВХ/ПЕ/ПВДХ/Ал.

По 1 или 4 блистеру по 7 таблеток вместе с инструкцией по применению помещают в картонную пачку.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25°C.

Срок годности

2 года.

Условия отпуска из аптек

Без рецепта.

Производитель

ЗЕНТИВА к.с., Чешская Республика (У кабеловны 130, 10237, Прага 10, Долни Мехолупы, Чешская Республика)