

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ

Торговое название препарата: Сетимед
Действующее вещество (МНН): левоцетиризин
Лекарственная форма: сироп для приема внутрь
Состав:
Каждые 5 мл содержат:
активное вещество: левоцетиризина дигидрохлорид 1Н - 2,5 мг;
вспомогательные вещества: лимонная кислота моногидрат, бронопол, сахароза, сорбитол жидкий (раствор 70%), динатрия эдетат, натрия бензоат, глицерол (глицерин), эссенция клубники, краситель закат желтый FCF, вода очищенная.

Описание: прозрачная жидкость светло-оранжевого цвета.
Фармакотерапевтическая группа: Антигистаминное средство.
Код АТХ: R06AE09
Фармакологическое действие
Фармакодинамика

Противоаллергическое средство. Левоцетиризин, (R)-энантиомер цетиризина, является избирательным антагонистом периферических гистаминовых H1-рецепторов.
Средство левоцетиризина ($K_i = 3.2$ нмоль/л) с гистаминовыми H1-рецепторами в 2 раза выше, чем у цетиризина ($K_i = 6.3$ нмоль/л). Исследования фармакокинетики у здоровых добровольцев показали, что при нанесении на кожу и на слизистую оболочку носа активность левоцетиризина в половине дозы сопоставима активности цетиризина в целой дозе.
Левоцетиризин подавляет активность зотаксин-индуцированной трансэндотелиальной миграции эозинофилов в клетках кожи и легких.
Фармакодинамические исследования продемонстрировали три основных подавляющих эффекта левоцетиризина в дозе 5 мг в первые 6 ч после контакта с пыльцой: подавление выброса VCAM-1, изменение сосудистой проницаемости и уменьшение активации эозинофилов. Как и у цетиризина, действие в отношении гистамин-индуцированных кожных реакций не зависит от плазменных концентраций препарата. Левоцетиризин предупреждает развитие и облегчает течение аллергических реакций, оказывает антиэкссудативное, противоэдематозное действие; практически не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия.
Левоцетиризин в дозе 5 мг способствует угнетению воспалительно-экссудативной реакции на гистамин в той же степени, что и цетиризин в дозе 10 мг. ЭКГ не выявила значительного действия левоцетиризина на интервал QT.

Фармакокинетика
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.

Показания к применению
Назначается взрослым и детям старше 6 лет при:
- симптоматическом лечении аллергического ринита (включая персистирующий аллергический ринит);
- крапивнице у взрослых и детей старше 2 лет.
Способ применения и дозы
Внутрь, с пищей или натошак, запивая небольшим количеством воды.

Дети:
Дети в возрасте от 2 до 6 лет: ежедневная рекомендуемая доза составляет 2,5 мг в 2 приема по 1,25 мг (2,5 мл сиропа дважды в день).
Дети в возрасте от 6 до 12 лет: рекомендованная дневная доза составляет 5 мг (10 мл сиропа).
Даже если и имеются некоторые данные по клиническим исследованиям у детей в возрасте от 6 месяцев до 12 лет, они не являются достаточным основанием для применения левоцетиризина у младенцев и детей до 2 лет. В связи с чем, назначение левоцетиризина новорожденным и детям до 2 лет не рекомендуется.
Сироп наливают в мерную чашечку или растворяют в небольшом количестве воды. Если используется разведение, особенно детям, следует использовать такой объем воды, который пациент в состоянии проглотить. Разбавленный сироп должен быть употреблен немедленно.
Рекомендации от 12 лет и старше, и взрослые: рекомендованная дневная доза составляет 5 мг (10 мл).
Пациенты пожилого возраста: у пожилых пациентов с почечной недостаточностью умеренной и тяжелой степени тяжести рекомендуется корректировка дозы.
Взрослые пациенты с почечной недостаточностью
Интервалы дозирования должны быть индивидуализированы в зависимости от функции почек. Обратитесь к следующей таблице и скорректируйте дозу, как указано. Чтобы использовать эту таблицу дозирования, требуется оценка клиренса креатинина пациента (КК) в мл/мин. КК (мл/мин) может быть оценен по креатинину сыворотки (мг/дл), определенной по следующей формуле:

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

Корректировка дозирования для пациентов с нарушением функции почек:

Почечная недостаточность	Клиренс креатинина (мл/мин)	Дозировка и частота
Норма	≥80	5 мг один раз в день
Легкая	60 – 79	5 мг один раз в день
Умеренная	30 – 49	5 мг один раз в 2 дня
Тяжелая	<30	5 мг один раз в 3 дня
Терминальная стадия – пациенты на диализе	<10	Имеется противопоказание

Дети, страдающие почечной недостаточностью
Доза должна быть скорректирована на индивидуальной основе с учетом почечного клиренса пациента и его/ее веса тела.
Пациенты с печеночной недостаточностью
Коррекция дозы не требуется пациентам только с печеночной недостаточностью. Пациентам с печеночной и почечной недостаточностью регуляция дозы рекомендуется.
Длительность использования:
Периодический аллергический ринит (симптомы <4 дня/неделю или менее чем 4 недели) должен рассматриваться в зависимости от заболевания и его истории, его можно остановить только после исчезновения симптомов, и может быть возобновлен снова, когда появляются симптомы. В случае стойкого аллергического ринита (симптомы >4 дней/неделю и в течение более 4 недель), непрерывная терапия может быть предложена пациенту в период контакта с аллергенами. Для хронической крапивницы и хронического аллергического ринита имеется

клинический опыт использования рацемата до одного года.
Побочные действия

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, парестезия, головокружение, обморок, тремор, дизгевзия.
Нарушения со стороны органа слуха и лабиринтные нарушения: вертиго.
Нарушения со стороны органа зрения: нарушение зрения, нечеткость зрительного восприятия, воспалительные проявления.
Нарушения со стороны сердца: стенокардия, ощущение сердцебиения, тахикардия.
Нарушения со стороны дыхательной системы: 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.

Противопоказания
- повышенная чувствительность к левоцетиризину или другим компонентам препарата;
- тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина меньше 10 мл/мин);
- дети до 2 лет;
- беременность и период лактации.

Лекарственные взаимодействия
Данные исследования взаимодействия с левоцетиризином (в том числе исследований с индукторами CYP3A4) отсутствуют; исследования соединения цетиризина с рацематом не показали каких-либо клинически значимых неблагоприятных взаимодействий (с антипиретиком, псевдоэфедрином, циметидином, кетоканазолом, эритромицином, азитромицином, глипизидом и диазепамом).
Небольшое снижение клиренса цетиризина (16%) наблюдалось в исследовании с несколькими дозами теофиллина (400 мг один раз в день), в то время как расположение теофиллина не изменяется при одновременном применении цетиризина.
При одновременном применении ритонавира (600 мг дважды в день) и цетиризина (10 мг в сутки), степень воздействия цетиризина была увеличена примерно на 40%, а расположение ритонавира было слегка изменено (-11%), что далее способствовало всасыванию цетиризина. Прием поглощения левоцетиризина не уменьшается с приемом пищи, хотя скорость всасывания снижается.
У чувствительных пациентов одновременное применение цетиризина или левоцетиризина и алкоголя или других депрессантов ЦНС может оказывать действие на центральную нервную систему, хотя было показано, что рацемат цетиризина не усиливает действие алкоголя.

Особые указания
Препарат применяют с осторожностью у пациентов с хронической почечной недостаточностью (необходима коррекция режима дозирования), у пациентов пожилого возраста (возможно снижение клубочковой фильтрации). Следует соблюдать осторожность у пациентов с предрасполагающими факторами задержки мочи (например, поражения спинного мозга, гиперплазия предстательной железы), так как левоцетиризин может увеличить риск развития задержки мочи. Во время применения препарата следует воздержаться от употребления алкоголя.
Применение при беременности и в период лактации
Доклинические исследования не выявили какие-либо прямые или косвенные нежелательные реакции левоцетиризина на развивающийся плод, а также на развитие в постнатальном периоде; течение беременности и родов также не изменялось.
Адекватных и строго контролируемых клинических исследований по безопасности применения препарата во время беременности не проводилось.
Применение препарата при беременности не рекомендуется.
Левоцетиризин выделяется с грудным молоком, поэтому при необходимости применения препарата при лактации рекомендуется прекратить грудное вскармливание.
Применение в педиатрии
В связи с отсутствием данных относительно безопасности и эффективности применения левоцетиризина у детей в возрасте до 2 лет, препарат не рекомендуется назначать пациентам этой возрастной категории.

Влияние на способность управлять автомобилем и сложными механизмами
В связи с тем, что в период лечения могут развиваться сонливость и головокружение, рекомендуется воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстрой психомоторных реакций.
Передозировка
Симптомы: признаки интоксикации в виде сонливости, у детей - беспокойства и повышенная раздражительность.
Лечение: при появлении симптомов передозировки (особенно у детей) прием препарата следует прекратить, необходимо промывание желудка, прием активированного угля, симптоматическая терапия. Специфического антидота нет. Гемодиализ не эффективен.

Форма выпуска
Первичная упаковка: По 50 мл сиропа во флаконах янтарного цвета
Вторичная упаковка: По 1 флакону в комплекте с 10 мл мерным стаканчиком вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном и русском языках помещающей в картонную упаковку.

Условия хранения
Хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°С.
Не замораживать. Хранить в недоступном для детей месте.
Срок годности
3 года.
Не использовать по истечении срока годности.
После вскрытия флакона содержимое использовать в течение 3 месяцев.
Условия отпуска из аптек
Без рецепта.

Владелец торговой марки и регистрационного удостоверения
VEGAPHARM LIFE SCIENCES PVT. LTD., Индия.

Производитель
Next Wave (India), Индия.

Наименование и адрес организации, принимающей претензии (предложения) по качеству лекарственного средства на территории Республики Узбекистан
ООО «Ameliya Pharm Service»
Узбекистан, г. Ташкент, 100015, ул. Ойбек, 36, БЦ «EAST LINE»,
E-mail: uzdrugsafety@evolelet.co.uk
Тел.: +99878 150 50 81, +99878 150 50 82

