

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
КСИЗАЛ®
(XYZAL)

Склад лікарського засобу:

діюча речовина: levocetirizine;

1 таблетка містить левоцетиризину дигідрохлориду 5 мг;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, кремнію діоксид колоїдний безводний, лактози моногідрат, магнію стеарат, Опадрай® Y-1-7000 (гіпромелоза (E 464), титану діоксид (E 171), макрогол 400).

Лікарська форма.

Білі або майже білі таблетки овальної форми, покриті плівковою оболонкою, з логотипом «Y» з одного боку таблетки.

Назва та місцезнаходження Виробника.

UCB PHARMA S.P.A., Italy.

ЮСБ ФАРМА С.П.А., Італія.

Via Praglia, 15, I-10044 Pianezza, Turin, Italy.

Via Прагліа 15, I-10044 Піанезза, Турін, Італія.

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

Фармакодинаміка. Левоцетиризин - це активний стабільний R-енантіомер цетиризину, що відноситься до групи конкурентних антагоністів гістаміну. Фармакологічна дія зумовлена блокуванням H₁-гістамінових рецепторів. Спорідненість до H₁-гістамінових рецепторів у левоцетиризину у 2 рази вище, ніж у цетиризину. Впливає на гістамінзалежну стадію розвитку алергійної реакції, зменшує міграцію еозинофілів, судинну проникність, обмежує вивільнення медіаторів запалення. Попереджає розвиток та полегшує перебіг алергійних реакцій, чинить антиексудативну, протисвербіжну, протизапальну дію, практично не чинить антихолінергічної і антисеротонінової дії. У терапевтичних дозах практично не виявляє седативного ефекту.

Фармакокінетика. Фармакокінетичні параметри левоцетиризину мають лінійну залежність і майже не відрізняються від таких у цетиризину.

Абсорбція. Препарат швидко всмоктується при застосуванні внутрішньо, прийом їжі не впливає на ступінь усмоктування, але знижує його швидкість; біодоступність досягає 100 %. У 50 % хворих дія препарату розвивається через 12 хв після приймання одноразової дози, а у 95 % — через 0,5-1 годину. Максимальна концентрація (C_{max}) у сироватці досягається через 50 хв після одноразового прийому внутрішньо терапевтичної дози та утримується протягом 2 днів. Максимальна концентрація (C_{max}) становить 207 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. Об'єм розподілу — 0,4 л/кг. Зв'язування з білками плазми — 90 %.

Біотрансформація. В організмі людини метаболізму піддається близько 14 % левоцетиризину. Процес метаболізму включає оксидацію, N- та O- деалкілування і сполучення з таурином. Деалкілування, в першу чергу, відбувається за участю цитохрому CYP 3A4, у той час як у процесі оксидації задіяна ціла низка цитохромних ізоформ. Левоцетиризин не впливає на активність цитохромних ізоферментів 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4 у концентраціях, що навіть перевищують пікові після прийняття дози 5 мг перорально. Враховуючи низький ступінь метаболізму, відсутність посилення пригнічувальної дії, взаємодія левоцетиризину з іншими речовинами (і навпаки) малоімовірна.

Виведення. Екскреція препарату відбувається в основному за рахунок клубочкової фільтрації та

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

активної каналцевої секреції. Період напіввиведення ($T_{1/2}$) становить $7,9 \pm 1,9$ години, загальний кліренс— 0,63 мл/хв/кг. Не накопичується, повністю виводиться з організму за 96 годин. 85,4 % дози препарату виводиться у незмінену вигляді із сечею, близько 12,9 % – з фекаліями.

У хворих з порушеннями функції нирок (кліренс креатиніну <40 мл/хв) кліренс препарату зменшується, а період напіввиведення ($T_{1/2}$) подовжується (так, у хворих, які перебувають на гемодіалізі, загальний кліренс зменшується на 80 %), а це вимагає підбору відповідного режиму дозування. При проведенні стандартного 4-годинного гемодіалізу видаляється незначна частина (менше 10 %) левоцетиризину. Виділяється в грудне молоко.

Показання до застосування.

- Симптоматичне лікування алергійних ринітів, у тому числі цілорічних алергійних ринітів;
- хронічна ідіопатична кропив'янка.

Протипоказання. Гіперчутливість до левоцетиризину, інших похідних піперазину, а також до інших компонентів препарату; дитячий вік до 6 років; тяжка форма хронічної ниркової недостатності (кліренс креатиніну <10 мл/хв); тяжка спадкова непереносимість галактози, дефіцит ферменту лактази (β -галактозидази) або порушення засвоєння глюкози і галактози; вагітність та період годування груддю.

Особливі застереження. З обережністю застосовують пацієнтам з хронічною нирковою недостатністю (потрібна корекція режиму дозування); пацієнтам літнього віку (можливе зниження клубочкової фільтрації). Під час застосування препарату слід утримуватись від вживання алкоголю. Прийом їжі не впливає на ступінь усмоктування препарату, але знижує швидкість його абсорбції.

Застосування в період вагітності або годування груддю.

Не застосовувати у період вагітності. Препарат виділяється у грудне молоко, тому за необхідності застосування препарату годування груддю потрібно припинити.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами. Слід утримуватись від керування автотранспортом або роботи з іншими механізмами під час лікування препаратом.

Діти. У зв'язку з відсутністю даних щодо безпеки й ефективності препарату у дітей віком до 6 років не рекомендується застосовувати засіб пацієнтам цієї вікової категорії.

Спосіб застосування та дози.

Препарат призначають дорослим та дітям віком від 6 років внутрішньо у добовій дозі 5 мг 1 раз на добу. Приймають таблетку з їжею або натщесерце, не розжовуючи, запиваючи невеликою кількістю води. Хворим літнього віку при нормальній функції нирок зниження дози не потрібне; для хворих із хронічною нирковою недостатністю розрахунок дози необхідно проводити з урахуванням кліренсу креатиніну відповідно до таблиці.

Функція нирок	Кліренс креатиніну, мл/хв	Доза й кількість прийомів
Норма	≥ 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

Хворим з печінковою недостатністю корекція режиму дозування не потрібна. Хворим з печінковою та нирковою недостатністю коригують режим дозування відповідно до наведеної вище таблиці.

Тривалість лікування залежить від виду, тяжкості та проявів захворювання: при полінозі призначають у середньому протягом 3 - 6 тижнів; у випадку короткочасного контакту з алергеном (пилок рослин) достатньо застосовувати препарат протягом 1 тижня. При хронічних захворюваннях (цілорічний риніт, ідіопатична кропив'янка) тривалість лікування – до 12 місяців.

Передозування. *Симптоми:* може супроводжуватися ознаками інтоксикації у вигляді сонливості; у

дітей передозування може супроводжуватися занепокоєнням і підвищеною дратівливістю.

Лікування: з появою симптомів передозування (особливо у дітей) прийом препарату необхідно припинити; проводять промивання шлунка, застосовують активоване вугілля; терапія - симптоматична. Специфічного антидоту немає, гемодіаліз не ефективний.

Побічні ефекти.

З боку нервової системи: головний біль, сонливість, стомлюваність, слабкість.

З боку серцево-судинної системи: відчуття серцебиття.

З боку органа зору: порушення зору.

З боку гепатобіліарної системи: гепатит.

З боку імунної системи: гіперчутливість, у тому числі анафілаксія, ангіоневротичний набряк.

З боку органів дихання: задишка.

З боку травної системи: сухість у роті, нудота.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: свербіж, висип, кропив'янка.

Інші: збільшення маси тіла; біль у животі; міалгії; можуть змінюватися показники печінкових проб.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Одночасне застосування з псевдоефедрином, циметидином, кетоконазолом, еритроміцином, азитроміцином, гліпезидом або діазепамом не чинить клінічно значущих несприятливих взаємодій. Сумісне застосування з теофіліном (400 мг/добу) знижує на 16 % загальний кліренс левоцетиризину (кінетика теофіліну не змінюється). При застосуванні в терапевтичних дозах немає даних про посилення дії заспокійливих засобів. Але бажано утримуватися від застосування седативних засобів під час проведення терапії.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. Зберігати в сухому місці при температурі не вище 25 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 7 або 10 таблеток у блістері, № 7 (1x7) або № 14 (2x7), або № 10 (1x10), або № 20 (2x10) у пачці картонній.

Категорія відпуску. Без рецепта.