

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ СУПРАСТИНЕКС

Торговое название препарата: Супрастинекс

Действующее вещество (МНН): левоцетиризин (levocetirizine)

Лекарственная форма: капли для приема внутрь.

Состав

активное вещество: 5 мг левоцетиризина дигидрохлорида в 1 мл капель для приема внутрь, что соответствует 4,21 мг левоцетиризина;

вспомогательные вещества: глицерин 85%, пропиленгликоль, натрия сахаринат, натрия ацетата тригидрат, метил-парагидроксибензоат, пропил-парагидроксибензоат, ледяная уксусная кислота, вода очищенная;

вспомогательное вещество с известным эффектом: метил-парагидроксибензоат, пропил-парагидроксибензоат, пропиленгликоль.

Описание: бесцветная или почти бесцветная сладкая жидкость без осадка, со слабым запахом уксусной кислоты.

Фармакотерапевтическая группа: антигистаминные препараты системного применения, производные пиперазина.

Код АТХ: R06AE09

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Механизм действия

Левоцетиризин, (R) энантиомер цетиризина, является сильным избирательным антагонистом периферических гистаминных H₁-рецепторов.

Исследования фармакодинамики у здоровых добровольцев показали, что при половинной дозе активность левоцетиризина при нанесении как на кожу, так и на слизистую оболочку носа, сравнима с активностью цетиризина.

Фармакодинамические эффекты

Фармакодинамическая активность левоцетиризина изучалась в рандомизированных контролируемых исследованиях.

Левоцетиризин в дозе 5 мг эффективно тормозил вызванное гистамином развитие отеков и покраснение кожи, более полное угнетение этой реакции на гистамин наблюдалось в течение первых 12 часов и продолжалась в течение 24 часов.

Контроль аллергических симптомов, вызванных вдыханием пыльцы растений, наблюдался через 1 час после приема препарата.

Клиническая эффективность и безопасность

Эффективность и безопасность левоцетиризина была продемонстрирована у взрослых пациентов, страдающих сезонным аллергическим ринитом или круглогодичным аллергическим ринитом. Левоцетиризин эффективно снижал симптомы аллергического ринита и значительно улучшал качество жизни пациентов.

У пациентов с идиопатической крапивницей левоцетиризин значительно уменьшал зуд как на первой неделе и на протяжении всего периода лечения и значительно улучшал качество жизни.

ЭКГ не выявила значительного действия левоцетиризина на интервал QT.

Дети и подростки

Левоцетиризин является эффективным и безопасным лекарственным средством у детей в возрасте 6-12 лет, страдающих сезонным или персистирующим аллергическим ринитом. Левоцетиризин достоверно улучшал симптомы заболевания и повышал качество жизни, связанное со здоровьем.

Клиническая безопасность была установлена и у детей до 6 лет

Фармакокинетика

Фармакокинетика левоцетиризина линейна, не зависима от дозы и времени и имеет малые различия у разных испытуемых. Фармакокинетические профили левоцетиризина и цетиризина сходны. При всасывании или выведении не происходит превращения левоцетиризина в цетиризин.

Всасывание

После приема внутрь левоцетиризин быстро и в значительной степени всасывается. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 0,9 часов после приема. Равновесное состояние достигается через два дня. Обычные пиковые концентрации после однократного и многократного (по 5 мг ежедневно) приема составляют соответственно 270 нг/мл и 308 нг/мл. Степень всасывания зависит от дозы и не зависит от приема пищи, однако в случае приема пищи пиковая концентрация снижается и наступает позже.

Распределение

Данные о распределении препарата в тканях человека и проникновении через гематоэнцефалический барьер отсутствуют. Левоцетиризин на 90% связывается с белками плазмы крови. Распределение левоцетиризина ограничено, так как объем распределения составляет 0,4 л/кг.

Биотрансформация

У человека менее 14% введенной дозы левоцетиризина метаболизируется, в связи с чем, считается, что различия, связанные с генетическими различиями или сопутствующим приемом лекарственных средств - ингибиторов ферментов, являются незначительными. Благодаря малой степени метаболизма и отсутствия возможного подавления метаболизма, взаимодействие левоцетиризина с другими веществами (и других веществ с левоцетиризином) маловероятно.

Выведение

Период полувыведения из плазмы крови равен $7,9 \pm 1,9$ часов. Средний кажущийся клиренс из всего организма составляет 0,63 мл/мин на 1 кг. Основной путь выведения левоцетиризина и его метаболитов - через почки; таким путем выводится в среднем 85,4% дозы. Выведение через кишечник составляет лишь 12,9% от дозы. Левоцетиризин выделяется как при помощи почечной клубочковой фильтрации, так и активной канальцевой секреции.

Специальные группы пациентов

Нарушение функции почек

Кажущийся клиренс левоцетиризина из всего организма коррелирует с клиренсом креатинина. Поэтому рекомендуется уточнять интервалы между приемами левоцетиризина на основании клиренса креатинина у пациентов с умеренным или выраженным нарушением функции почек. В анурической стадии почечных заболеваний общий клиренс из всего организма снижается примерно на 80% по сравнению со здоровыми испытуемыми. При стандартной процедуре 4-часового гемодиализа выводится менее чем 10% левоцетиризина.

Нарушение функции печени

Фармакокинетика левоцетиризина у пациентов с печеночной недостаточностью не была изучена. У пациентов с хроническим нарушением функции печени (гепатоцеллюлярный, холестатический или билиарный цирроз), получавших однократную дозу 10 мг или 20 мг рацемическое соединение цетиризина период полувыведения увеличивался на 50%, а клиренс уменьшался на 40%, по сравнению со здоровыми лицами.

Дети и подростки

У детей в возрасте от 6 до 11 лет с массой тела от 20 до 40 кг при однократном приеме 5 мг левоцетиризина внутрь показали, что максимальная концентрация в крови (C_{max}) и площадь под кривой концентрация-время (AUC) примерно в 2 раза превышают таковые у взрослых здоровых людей. Прием левоцетиризина в дозе 1,25 мг у детей в возрасте от 6 месяцев до 5 лет приводит к концентрации в плазме, соответствующей таковой, определяемой у взрослых при приеме 5 мг препарата 1 раз в сутки.

Пожилые пациенты

Данные по фармакокинетике у пожилых пациентов ограничены. При повторном приеме 30 мг левоцетиризина 1 раз в сутки в течение 6 дней у 9 пожилых пациентов (возраст от 65 до 74 лет) общий клиренс снижается примерно на 33% ниже. Левоцетиризин выводится преимущественно почками, поэтому у пожилых пациентов доза левоцетиризина должна быть скорректирована в зависимости от функции почек.

Пол

Показано, что у женщин время полужизни левоцетиризина было несколько короче, чем у мужчин, однако, пероральный клиренс скорректированный по массе тела у женщин и мужчин сравним. У мужчин и женщин суточные дозы и интервалы между дозами одинаковы.

Этническая принадлежность

Влияние этнической принадлежности на левоцетиризин не изучали. Так как левоцетиризин, прежде всего, выводится почками, и известно, что с точки зрения клиренса креатинина этнические различия отсутствуют, не ожидается различий между фармакокинетическими параметрами у лиц различных этнических групп. Для рацемата цетиризина таких различий не было выявлено.

Фармакокинетическая фармакодинамическая связь:

Действие левоцетиризина на вызванные гистамином кожные реакции по фазе не совпадают с концентрацией в плазме.

Показания к применению

Симптоматическое лечение аллергического ринита (в том числе персистирующего аллергического ринита) и хронической идиопатической крапивницы у взрослых и детей в возрасте от 2 лет и старше.

Способ применения и дозы

Режим дозирования

Взрослые и подростки (в возрасте 12 лет и старше)

Ежедневная рекомендуемая доза составляет 5 мг (1 мл капль или 20 капль из капльницы).

Пожилые пациенты

Пожилым пациентам с умеренным или выраженным нарушением функции почек рекомендуется уточнение дозы (см. ниже раздел "Пациенты с нарушением функции почек").

Дети в возрасте от 6 до 12 лет

Ежедневная рекомендуемая доза равна 5 мг (1 мл капль или 20 капль из капльницы).

Дети в возрасте от 2 до 6 лет

Ежедневная рекомендуемая доза равна 2,5 мг за два приема в равных дозах по 1,25 мг (2 раза по 0,25 мл капль = 2 × 5 капль из капльницы).

Младенцы и дети в возрасте до 2 лет

Несмотря на имеющиеся клинические данные о применении капель левоцетиризина у детей в возрасте от 6 месяцев до 12 лет (см. разделы 4.8, 5.1 и 5.2), эти данные недостаточны для рекомендации данного препарата младенцам и детям до 2 лет (см. раздел 4.4).

Пациенты с нарушением функции почек

Периодичность введения следует устанавливать индивидуально в соответствии с функцией почек. В приведенной ниже таблице указаны необходимые изменения дозы. Для использования этой таблицы следует определить клиренс креатинина у пациента (КК) в мл/мин. После определения уровня креатинина сыворотки крови (мг/дл) значение КК (мл/мин) можно оценить по следующей формуле:

$$КК = \frac{[140 - \text{возраст (годы)}] \times \text{масса тела (кг)}}{72 \times \text{креатинин сыворотки (мг/100 мл)}} \quad (\times 0,85 \text{ для женщин})$$

Коррекция доз для пациентов с нарушением функции почек:

Группа	Клиренс креатинина (мл/мин)	Доза и частота приема
Нормальная функция почек	≥ 80	5 мг один раз в день
Легкое нарушение функции почек	50 – 79	5 мг один раз в день
Умеренное нарушение функции почек	30 – 49	5 мг через день
Тяжелое нарушение функции почек	< 30	5 мг каждые 3 дня
Конечная стадия заболевания почек – пациенты на диализе	< 10	Противопоказано

У детей с нарушениями функции почек доза должна определяться индивидуально, учитывая почечный клиренс и массу тела пациента. Отсутствуют специфические данные о детях с нарушениями функции почек.

Пациенты с нарушением функции печени

При назначении препарата больным с изолированным нарушением функции печени каких-либо изменений дозы не требуется. Пациентам с сочетанным нарушением функции печени и почек рекомендуется уточнение дозы (см. выше раздел "Пациенты с нарушением функции почек").

Продолжительность приема препарата:

Продолжительность курса лечения периодического аллергического ринита (с продолжительностью симптомов < 4 дней в неделю или с продолжительностью менее 4 недель в году) зависит от вида заболевания, длительности и течения симптомов и анамнеза заболевания. Лечение можно прекратить после исчезновения симптомов и возобновить при повторном появлении симптомов.

Для лечения персистирующего аллергического ринита (с продолжительностью симптомов > 4 дней в неделю или с продолжительностью более 4 недель в году) пациенту можно рекомендовать продолжительное лечение на период воздействия аллергенов. В настоящее время имеется клинический опыт применения левоцетиризина, на протяжении, по крайней мере, 6 месяцев. Имеется опыт применения рацемата цетиризина на протяжении до одного года при хронической крапивнице и хроническом аллергическом рините.

Способ применения

Необходимое число капель следует отмерять с помощью капельницы в столовую ложку или стакан воды. Капли следует принимать внутрь немедленно после разведения независимо от приема пищи.

Побочные действия

Взрослые и подростки старше 12 лет

У мужчин и женщин в возрасте от 12 до 71 года наиболее часто (частота выше 1%) встречались следующие побочные реакции: головная боль, сонливость, сухость во рту, усталость. Нечасто наблюдались астения и боль в животе.

У детей в возрасте от 6-11 месяцев (до 1 года) до 6 лет при приеме 1,25 мг левоцетиризина один или два раза в день в течение 2 недель наблюдались следующие побочные реакции, частота которых превышала 1%: диарея, рвота, запор, сонливость, нарушение сна, головная боль.

Зарегистрированные в пострегистрационном периоде побочные реакции приводятся по системам органов.

Частота этих реакций неизвестна (нельзя определить на основании имеющихся данных).

Нарушения со стороны иммунной системы

Гиперчувствительность (аллергия), в том числе анафилаксия;

Нарушения со стороны обмена веществ и питания

повышение аппетита;

Нарушения психики

агрессия, возбужденное состояние (ажитация), галлюцинации, депрессия, бессонница, суицидальные мысли, кошмарные сновидения;

Нарушения со стороны нервной системы

конвульсии, парестезия (нарушение чувствительности), головокружение, обморок, тремор (дрожь), нарушение вкусовых восприятий (дисгевзия);

Нарушения со стороны органа зрения

нарушения зрения, размытость зрительных образов, непроизвольные, круговые движения глаз (окулогирия);

Нарушения со стороны органа слуха и равновесия

головокружение с ощущением вращения (вертиго);

Нарушения со стороны сердца

сильное сердцебиение, тахикардия;

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

одышка (диспноэ);

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

тошнота, рвота, диарея;

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

воспаление печени (гепатит);

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

ангионевротический отек, фиксированная лекарственная сыпь, зуд, кожная сыпь, крапивница

Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани

боль в мышцах, боль в суставах;

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

болезненное или затрудненное выведение мочи, неспособность полного опорожнения мочевого пузыря;

Общие расстройства и нарушения в месте введения

отеки;

Влияние на результаты лабораторных и инструментальных исследований

Увеличение массы тела, изменение показателей функциональных печеночных проб.

Капли Супрастинекс 5 мг/мл могут вызвать аллергические реакции (иногда поздние), так как содержат метилпарагидроксибензоат и пропилпарагидроксибензоат.

Описание избранных побочных реакций

После отмены препарата Супрастинекс капли для приема внутрь может возникнуть кожный зуд даже при отсутствии таких симптомов в начале лечения. Обычно, эти симптомы спонтанно проходят, но в некоторых случаях они могут быть достаточно тяжелыми, требующими возобновления лечения. Эти симптомы обычно исчезают после возобновления лечения.

Сообщение о возможных побочных реакциях

Предоставление данных о предполагаемых побочных реакциях препарата является очень важным моментом, позволяющим осуществлять непрерывный мониторинг соотношения риск/польза лекарственного средства. Медицинским работникам следует предоставлять информацию о любых предполагаемых неблагоприятных реакциях по указанным в конце инструкции контактам, а также через национальную систему сбора информации.

Противопоказания

- Аллергия на левоцетиризина гидрохлорид, цетиризин, другие производные пиперазина или на любое из вспомогательных веществ препарата, приведенных в разделе 6.1.
- Тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина ниже 10 мл/мин).

Лекарственные взаимодействия

Исследований взаимодействий левоцетиризина с другими препаратами не проводилось.

Степень всасывания левоцетиризина не снижается в присутствии пищи, но скорость всасывания снижается.

У чувствительных пациентов одновременный прием цетиризина или левоцетиризина и алкоголя или других средств, угнетающих ЦНС, может оказать воздействие на центральную нервную систему, понижая психическое бодрствование и работоспособность.

Особые указания

- Дети: несмотря на имеющиеся клинические данные о применении капель левоцетиризина у детей в возрасте от 6 месяцев до 12 лет, эти данные недостаточны для рекомендации данного препарата младенцам и детям до 2 лет.
- Одновременное употребление алкоголя требует осторожности.
- Особую осторожность следует проявлять у пациентов с факторами, предрасполагающими к задержке мочи (например, травмы спинного мозга или гиперплазии предстательной железы), так как левоцетиризин может повысить риск задержки мочи.
- Следует применять с осторожностью у больных эпилепсией и лиц с риском развития судорог.
- Также как и в случае применения других антигистаминных препаратов, приём препарата следует прекратить, по крайней мере, за 3 дня до проведения алергологического кожного теста.
- После отмены цетиризина может возникнуть кожный зуд даже при отсутствии таких симптомов в начале лечения. Обычно, эти симптомы спонтанно проходят, но в некоторых случаях они могут быть достаточно тяжелыми, требующими возобновления лечения. Обычно, эти симптомы исчезают после возобновления лечения.

- Капли Супрастинекс 5 мг/мл могут вызвать аллергические реакции (иногда поздние), так как содержат метилпарагидроксибензоат (E218, 1,35 мг/мл) и пропилпарагидроксибензоат (E216, 0,15 мг/мл).

Данный препарат содержит пропиленгликоль (E1520, 350 мг/мл).

Беременность и период грудного вскармливания

Беременность

Данные клинических исследований левоцетиризина при беременности ограничены или отсутствуют. В то же время накоплено достаточное количество данных (исход более 1000 беременностей) о цетиризине (рацемате левоцетиризина), согласно которым не было выявлено аномалий развития плода, а также токсичности для плода и новорожденного.

При необходимости возможно назначение данного препарата беременным женщинам.

Грудное вскармливание

Было установлено, что цетиризин (рацемат левоцетиризина) выделяются в грудное молоко человека. Таким образом, весьма вероятно, что левоцетиризин выделяется в грудное молоко человека. У младенцев, кормящие матери которых получали левоцетиризин, наблюдались побочные реакции, связанные с левоцетиризином. Поэтому следует соблюдать осторожность при назначении этого препарата в период грудного вскармливания.

Фертильность

Отсутствуют данные о влиянии левоцетиризина на фертильность.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

После приема рекомендованных доз левоцетиризина не наблюдалось нарушения уровня бодрствования, времени реакции или способности управлять транспортными средствами. Однако некоторые пациенты могут испытывать сонливость, утомляемость или астению во время приема левоцетиризина. Поэтому пациенты, имеющие намерение управлять автомобилем, выполнять потенциально опасную деятельность или работать с механизмами, должны учитывать свою реакцию на препарат.

Передозировка

Симптомы передозировки

Значительная передозировка у взрослых может привести к сонливости, у детей - сначала к возбуждению и беспокойству, которые сменяются сонливостью.

Лечение

Специфический антидот к левоцетиризину неизвестен.

В случае передозировки рекомендовано симптоматическое и поддерживающее лечение. Через короткий промежуток времени после приема препарата внутрь можно сделать промывание желудка. Левоцетиризин не может быть эффективно удален с помощью гемодиализа.

Форма выпуска

Стеклянные флаконы коричневого цвета с резьбой для навинчивания крышки, объемом 20 мл, с полиэтиленовой капельницей и полипропиленовой крышкой с внутренним полиэтиленовым слоем, снабженной специальной защитой от открывания детьми и контролем первого вскрытия. 1 флакон помещают в картонную пачку вместе с инструкцией по медицинскому применению.

Срок годности

4 года.

Открытый флакон хранить не более 6-ти недель!

Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Датой истечения срока годности считается последний день указанного месяца.

Лекарственные средства не следует выбрасывать в бытовые отходы или сточные воды. Если необходимо удалить в отходы препарат, который больше не нужен, проконсультируйтесь с фармацевтом. Эти меры помогут предотвратить загрязнение окружающей среды.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25°C. Не замораживать!

Хранить в оригинальной упаковке.

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска из аптек

Без рецепта.

Владелец регистрационного удостоверения

ЗАО «Фармацевтический завод ЭГИС»

1106 Будапешт, ул. Керестури, 30-38

ВЕНГРИЯ

Производственная площадка

ЗАО «Фармацевтический завод ЭГИС»

9900 Кёрменд, ул. Матяш Кирай, 65

ВЕНГРИЯ

Наименование и адрес организации, принимающей претензии (предложения) по качеству лекарственных средств на территории Республики Узбекистан:

Представительство ЗАО «Фармацевтический завод ЭГИС» в Узбекистане

г. Ташкент, ул. Афросиаб, дом 4Б

Тел.: (99871) 1404119, факс: (99871) 1404490