

**ИНСТРУКЦИЯ**  
**по медицинскому применению препарата**  
**СУПРАСТИНЕКС®**

**Регистрационный номер:** \_\_\_\_\_

**Торговое название:** СУПРАСТИНЕКС®

**Международное непатентованное название:** левоцетиризин

**Лекарственная форма:** капли для приема внутрь

**Состав:**

*Действующее вещество:* левоцетиризина дигидрохлорид 0,1 г (в 1 мл содержится 5 мг левоцетиризина дигидрохлорида). Вспомогательные вещества: глицерол (85%) 5 г, пропиленгликоль 7 г, натрия сахаринат 0,2 г, натрия ацетата тригидрат 0,12 г, метилпарагидроксибензоат 0,027 г, пропилпарагидроксибензоат 0,003 г, уксусная кислота ледяная 0,010 г, вода очищенная до 20 мл.

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

**Фармакотерапевтическая группа:** противоаллергическое средство H<sub>1</sub>-гистаминовых рецепторов блокатор

**Код АТХ:** R06AE09

## **ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА**

### *Фармакодинамика*

Левоцетиризин – активное вещество препарата Супрастинекс® - это R-энантиомер цетиризина, который относится к группе конкурентных антагонистов гистамина и блокирует H<sub>1</sub>-гистаминовые рецепторы.

Левоцетиризин оказывает влияние на гистаминозависимую стадию аллергических реакций, а также уменьшает миграцию эозинофилов, уменьшает проницаемость сосудов, ограничивает высвобождение медиаторов воспаления.

Левоцетиризин предупреждает развитие и облегчает течение аллергических реакций, обладает противоэкссудативным, противозудным действием, практически не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия. В терапевтических дозах практически не оказывает седативного эффекта.

Действие начинается через 12 мин после приема однократной дозы у 50% пациентов, через 1 час – у 95% и продолжается в течение 24 ч.

### *Фармакокинетика*

Фармакокинетические параметры левоцетиризина изменяются линейно и практически не отличаются от фармакокинетики цетиризина.

*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<sub>max</sub>) 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 сут.

*Распределение.* Левоцетиризин на 90% связывается с белками плазмы крови. Объем распределения (V<sub>d</sub>) составляет 0,4 л/кг. Биодоступность достигает 100%.

*Метаболизм.* В небольших количествах (<14%) метаболизируется в организме путем N- и O-деалкилирования (в отличие от других антагонистов H<sub>1</sub>-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.

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**

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;

Другие аллергические дерматозы, сопровождающиеся зудом и высыпаниями.

### **Противопоказания**

Повышенная чувствительность к левоцетиризину или производным пиперазина, а также другим компонентам препарата;

Терминальная стадия почечной недостаточности (клиренс креатинина менее 10 мл/мин);

Детский возраст до 2 лет (из-за отсутствия клинических данных);

Беременность и период грудного вскармливания (см. раздел «Применение при беременности и в период грудного вскармливания»).

### **С осторожностью**

При хронической почечной недостаточности (необходима коррекция режима дозирования);

У лиц пожилого возраста (при возрастном снижении клубочковой фильтрации);

У пациентов с повреждением спинного мозга, гиперплазией предстательной железы, а также при наличии других предрасполагающих факторов к задержке мочи, поскольку левоцетиризин может увеличивать риск задержки мочи.

При одновременном употреблении с алкоголем (см. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами).

### **Применение при беременности и в период грудного вскармливания**

Доклинические исследования не выявили каких-либо прямых или косвенных неблагоприятных эффектов 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 противопоказано.

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

### **Способ применения и дозы**

Препарат принимают внутрь во время приема пищи или натощак. Для приема препарата следует использовать чайную ложку. При необходимости дозу препарата можно разбавить в небольшом количестве воды непосредственно перед употреблением.

*Взрослые и дети старше 6 лет:* суточная доза составляет 5 мг (20 капель) однократно.

*Дети от 2 до 6 лет:* по 1,25 мг (5 капель) 2 раза в день; суточная доза – 2,5 мг (10 капель).

Поскольку левоцетиризин выводится из организма почками, при применении препарата пациентам с почечной недостаточностью и пациентам пожилого возраста дозу следует корректировать в зависимости от величины клиренса креатинина (КК).

Клиренс креатинина для мужчин можно рассчитать, исходя из концентрации сывороточного креатинина, по следующей формуле:

$$[140 - \text{возраст (годы)}] \times \text{масса тела (кг)}$$

$$\text{КК (мл/мин)} = \frac{\text{результат}}{\text{-----}}$$

$$72 \times \text{КК сыворотки (мг/дл)}$$

КК для женщин можно рассчитать, умножив полученное значение на коэффициент 0,85.

| <b>Почечная недостаточность</b>                        | <b>КК (мл/мин)</b> | <b>Режим дозирования</b>       |
|--|--------------------|--------------------------------|
| Норма  | > 80               | 5 мг/сут                       |
| Легкая   | 50-79              | 5 мг/сут                       |
| Средняя  | 30-49              | 5 мг/сут × 1 раз в 2 дня       |
| Тяжелая  | < 30               | 5 мг/сут × 1 раз в 3 дня       |
| Терминальная стадия – пациенты, находящиеся на диализе | < 10               | Прием препарата противопоказан |

Пациентам с почечной и печеночной недостаточностью дозирование осуществляется по таблице, приведенной выше.

Пациентам с нарушением только функции печени коррекции режима дозирования не требуется.

*Продолжительность приема препарата:*

При лечении сезонного (интермиттирующего) аллергического ринита (наличие симптомов менее 4 дней в неделю или их общая продолжительность менее 4-х недель) длительность лечения зависит от характера заболевания; лечение может быть прекращено при исчезновении симптомов и возобновлено при появлении симптомов.

При лечении круглогодичного (персистирующего) аллергического ринита (наличие симптомов более 4-х дней в неделю и их общая продолжительность более 4-х недель) лечение может продолжаться в течение всего периода воздействия аллергенов.

Имеется клинический опыт непрерывного применения препарата у взрослых пациентов длительностью до 6 месяцев.

### **Побочное действие**

Во время проведения клинических исследований у лиц мужского и женского пола 12–71 лет часто ( $\geq 1/100$ ,  $< 1/10$ ) встречались следующие нежелательные явления: головная боль, сонливость, сухость во рту, утомляемость; нечасто ( $\geq 1/1000$ ,  $< 1/100$ ) - встречались астения и боль в животе. У детей от 6 до 12 лет часто ( $\geq 1/100$ ,  $< 1/10$ ) встречались головная боль и сонливость.

В период пострегистрационного применения препарата наблюдались следующие побочные эффекты, частота которых неизвестна из-за недостаточности данных:

*Со стороны иммунной системы:* реакции гиперчувствительности, включая анафилаксию.

*Со стороны метаболизма и расстройства питания:* повышение аппетита.

*Со стороны психики:* тревога, агрессия, возбуждение, бессонница, галлюцинации, депрессия, суицидальные мысли.

*Со стороны нервной системы:* судороги, тромбоз синусов твердой мозговой оболочки, парестезия, головокружение, обморок, тремор, дисгевзия.

*Со стороны слуха:* вертиго.

*Со стороны органа зрения:* нарушение зрения, нечеткость зрительного восприятия, воспалительные проявления.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* ощущение сердцебиения, тахикардия, тромбоз яремной вены.

*Со стороны дыхательной системы:* одышка, усиление симптомов ринита.

*Со стороны пищеварительной системы:* тошнота, рвота.

*Гепатобилиарные расстройства:* гепатит, изменение функциональных проб печени.

*Со стороны почек и мочевыделительной системы:* дизурия, задержка мочи.

*Со стороны кожи и мягких тканей:* ангионевротический отек, стойкая лекарственная эритема, сыпь, зуд, крапивница, гипотрихоз, трещины, фотосенсибилизация.

*Со стороны костно-мышечной системы:* боль в мышцах.

*Общие расстройства:* периферические отеки, увеличение массы тела.

*Прочее:* перекрестная реактивность.

Если любые указанные в инструкции побочные эффекты усугубляются, или Вы заметили другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, следует сообщить об этом врачу.

### **Передозировка**

Симптомы: сонливость (у взрослых), возбуждение и беспокойство, сменяющиеся сонливостью (у детей).

Лечение: необходимо промыть желудок или принять активированный уголь, если после приема препарата прошло мало времени. Рекомендуется проведение симптоматической и поддерживающей терапии. Специфического антидота нет. Гемодиализ не эффективен.

### **Взаимодействие с другими препаратами**

Изучение взаимодействия левоцетиризина с другими лекарственными препаратами не проводилось. При изучении лекарственного взаимодействия рацемата цетиризина с феназоном, 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 изменялась (-10%).

В ряде случаев при одновременном применении левоцетиризина с алкоголем или лекарственными препаратами, оказывающими подавляющее влияние на центральную нервную систему (ЦНС), возможно усиление их влияния на ЦНС, хотя не доказано, что рацемат цетиризина потенцирует эффект алкоголя.

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

### **Особые указания**

У пациентов с повреждением спинного мозга, гиперплазией предстательной железы, а так же при наличии других предрасполагающих факторов к задержке мочи, поскольку левоцетиризин может увеличивать риск задержки мочи.

Капли Супрастинекс® могут вызвать аллергические реакции (иногда поздние), так как содержат метилпарагидроксибензоат и пропилпарагидроксибензоат.

Препарат Супрастинекс® в каплях противопоказан детям в возрасте до 2 лет из-за отсутствия клинических данных.

Препарат следует назначать с осторожностью при хронической почечной недостаточности, лицам пожилого возраста, при одновременном применении препарата с алкоголем (см. раздел «С осторожностью»).

### ***Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами***

Левоцетиризин может привести к повышенной сонливости, и следовательно может оказывать влияние на способность управлять автомобилем или работать с техникой. В период лечения необходимо воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

### **Форма выпуска**

*Капли для приема внутрь 5 мг/мл:* 20 мл во флаконе коричневого стекла с ПЭ капельницей и ПП крышкой с внутренним ПЭ слоем, снабженной специальной защитой от открывания детьми и контролем первого вскрытия. 1 флакон помещают в картонную пачку вместе с инструкцией по применению.

**Срок годности**

4 года. Открытый флакон хранить не более 6 недель. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

**Условия хранения**

При температуре не выше 25°С . Не замораживать.  
Хранить в недоступном для детей месте.

**Условия отпуска из аптек**

Без рецепта.

**Держатель регистрационного удостоверения**

ЗАО «Фармацевтический завод ЭГИС», Венгрия  
1106 Budapest, Kereszturi ut 30-38, Hungary  
Телефон: (36-1) 803-5555,  
Факс: (36-1) 803-5529

**Наименование и фактический адрес организации-производителя лекарственного препарата**

ЗАО «Фармацевтический завод ЭГИС», Венгрия  
9900 Kormend, Matyas kiraly ut 65, Hungary

**Претензии потребителей следует направлять по адресу:**

ООО «ЭГИС-РУС», Россия  
121108, г. Москва, ул. Ивана Франко, д. 8, телефон: (495) 363-39-66