

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ПОЛИНОСА

Торговое название препарата: Полиноса

Действующее вещество (МНН): левоцетиризина гидрохлорид

Лекарственная форма: капли приема внутрь, раствор 5 мг/мл

Состав:

1 мл препарата содержит:

активное вещество: левоцетиризина гидрохлорид - 5,0 мг

вспомогательные вещества: глицерин, пропиленгликоль, натрия сахарин, натрия ацетат тригидрат, метилпарагидроксибензоат, пропилпарагидроксибензоат, кислота уксусная ледяная, вода для инъекций до 1 мл.

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

Фармакотерапевтическая группа: Антигистаминные средства для системного применения. Производные пиперазина.

Код АТХ: R06AE09

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Левоцетиризин - активное вещество препарата Полиноса - это стабильный R-энантиомер цетиризина, относится к группе конкурентных антагонистов гистамина.

Фармакологическое действие обусловлено блокированием H₁-гистаминовых рецепторов. Сродство к H₁-гистаминовым рецепторам левоцетиризина в 2 раза выше, чем в цетиризина. Влияет на гистамин зависимую стадию развития аллергической реакции, уменьшает миграцию эозинофилов, сосудистую проницаемость, ограничивает высвобождение медиаторов воспаления. Предупреждает развитие и облегчает течение аллергических реакций, оказывает антиэкссудативное, противоаллергическое, противовоспалительное действие, почти не оказывает антихолинергического и антисеротонинового действия. В терапевтических дозах практически не оказывает седативного эффекта.

Фармакокинетика

Фармакокинетические параметры левоцетиризина имеют линейную зависимость и почти не отличаются от таковых у цетиризина.

Абсорбция. Препарат после перорального введения быстро и интенсивно поглощается. Степень всасывания препарата не зависит от дозы и не меняется с приемом пищи, но максимальная концентрация (C_{max}) препарата уменьшается и достигает своего максимального значения позже. Биодоступность достигает 100%.

У 50% больных действие препарата развивается через 12 минут после приема однократной дозы, а в 95% - через 0,5-1 час. C_{max} в плазме крови достигается через 50 минут после однократного приема внутрь терапевтической дозы и сохраняется в течение 2 дней. C_{max} составляет 270 нг / мл после однократного применения и 308 нг / мл - после повторного применения в дозе 5 мг соответственно.

Распределение. Отсутствует информация о распределении препарата в тканях человека, а также о проникновении левоцетиризина сквозь гематоэнцефалический барьер. В исследованиях наибольшая концентрация зафиксирована в печени и почках, а самая

низкая - в тканях центральной нервной системы. Объем распределения - 0,4 л / кг. Связывание с белками плазмы крови - 90%.

Метаболизм. В организме человека метаболизму подвергается около 14% левоцетиризина. Процесс метаболизма включает оксидацию, N- и O-деалкилирования и сообщения с таурином. Деалкилирования в первую очередь происходит при участии цитохрома CYP 3A4, тогда как в процессе окисления участвуют многочисленные и (или) неопределенные изоформы CYP. Левоцетиризин не влияет на активность цитохромных изоферментов 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1, 3A4 в концентрациях, значительно превышающих максимальные после принятия дозы 5 мг перорально. Учитывая низкую степень метаболизма и отсутствие способности к подавлению метаболизма, взаимодействие левоцетиризина с другими веществами (и наоборот) маловероятно.

Вывод. Экскреция препарата происходит в основном за счет клубочковой фильтрации и активной канальцевой секреции. Период полувыведения препарата из плазмы крови у взрослых ($T_{1/2}$) составляет $7,9 \pm 1,9$ часа. Период полувыведения короче у маленьких детей. Общий клиренс у взрослых - 0,63 мл / мин / кг. В основном вывода левоцетиризина и его метаболитов из организма с мочой (выводится в среднем 85,4% введенной дозы препарата). С фекалиями выводится 12,9% дозы препарата.

Очевидный клиренс левоцетиризина для организма коррелирует с клиренсом креатинина. Поэтому *у пациентов с умеренными и тяжелыми нарушениями функции почек* рекомендуется подбирать интервалы между приемами левоцетиризина с учетом клиренса креатинина. При анурии при конечной терминальной стадии заболевания почек общий клиренс организма пациентов, по сравнению с общим клиренсом организма у лиц без таких нарушений, уменьшается примерно на 80%. Количество левоцетиризина, что выводится при стандартной 4 - часовой процедуры гемодиализа, составила <10%.

Показания к применению

Лечение симптомов:

- круглогодичного (персистирующего) и сезонного (интермиттирующего) аллергических ринитов;
- аллергического конъюнктивита (зуд, чихание, заложенность носа, ринорея, слезотечение, гиперемия конъюнктивы);
- поллиноза (сенная лихорадка);
- крапивницы (в том числе хроническая идиопатическая, отек Квинке);
- аллергических дерматозов, сопровождающихся зудом и высыпаниями.

Способ применения и дозы

Препарат Полиноса назначать взрослым и детям в возрасте от 6 месяцев внутрь, независимо от приема пищи. Капли можно растворить в небольшом количестве воды. Если применяется разведения, то следует учитывать, особенно по применению детям, объем воды, к которому прилагаются капли, должно быть адаптировано в соответствии с количеством воды, которое может проглотить пациент. Разбавленный раствор следует принимать немедленно.

Рекомендуемые дозы:

младенцы в возрасте от 6 месяцев до 12 месяцев Рекомендуемая доза составляет 1,25 мг (5 капель) 1 раз в сутки

дети в возрасте от 1 года до 6 лет рекомендуемая доза составляет 2,5 мг (10 капель). Указанную дозу применять по 1,25 мг (5 капель) 2 раза в сутки;

дети в возрасте от 6 до 12 лет рекомендуемая доза составляет 5 мг (20 капель) 1 раз в сутки

дети старше 12 лет и взрослые: рекомендуемая доза составляет 5 мг (20 капель) 1 раз в сутки.

Пациентам пожилого возраста с нормальной функцией почек коррекция дозы препарата не требуется.

Пациентам с нарушенной функцией почек расчет дозы необходимо проводить с учетом клиренса креатинина в соответствии с таблицей.

Для применения этой таблицы дозировку необходимо оценить клиренс креатинина ($КЛ_{кр}$) пациента в мл / мин. $КЛ_{кр}$ (мл / мин) должен быть оценен по содержанию креатинина в сыворотке крови (мг / дл) по следующей формуле:

Коррекция дозы для больных с нарушенной функцией почек

Почечная недостаточность	С1 креатинина, мл/мин	Доза и кратность приема
Отсутствует (норма)	≥ 80	5 мг/сут
Легкая	50–79	5 мг/сут
Средняя	30–49	5 мг 1 раз в 2 дня
Тяжелая	< 30	5 мг 1 раз в 3 дня
Терминальная стадия — пациенты, находящиеся на гемодиализе	< 10	прием препарата противопоказан

Детям с нарушениями функции почек дозу препарата следует скорректировать индивидуально с учетом почечного клиренса пациента и его массы тела.

Пациентам с исключительно печеночной недостаточностью коррекция режима дозирования не требуется.

Пациентам с печеночной и почечной недостаточностью корректировать режим дозирования в соответствии с приведенной выше таблицы.

Длительность применения:

-Пациентов с периодическим аллергическим ринитом (продолжительность симптомов заболевания составляет 4 дней в неделю и в течение более 4 недель) в период контакта с аллергенами пациенту можно предложить постоянную терапию.

-При хронических заболеваниях (хронический аллергический ринит, хроническая крапивница) продолжительность лечения составляет до 1 года.

Дети

Применение новорожденным и младенцам в возрасте до 6 месяцев не рекомендуется из-за ограниченности данных в этой возрастной категории.

Побочные действия

Со стороны нервной системы: сонливость, головная боль, повышенная утомляемость, слабость, астения, судороги, парестезии, головокружение, обморок, тремор, дисгевзия.

Со стороны психики: нарушение сна, возбуждение, галлюцинации, депрессия, агрессия, бессонница, суицидальные мысли.

Со стороны опорно-двигательной системы: миалгия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: тахикардия.

Со стороны органа зрения: нарушение зрения, нечеткость зрения.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: гепатит.

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

Со стороны иммунной системы: гиперчувствительность, в том числе анафилаксия.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: одышка.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: сухость во рту, тошнота, рвота, запор, диарея, боль в животе.

Со стороны кожи и подкожных тканей: ангионевротический отек, устойчивые медикаментозные высыпания, зуд, сыпь, крапивница.

Со стороны костно-мышечной системы, соединительной ткани и костей: миалгия.

Результаты исследований: увеличена масса тела, отклонения функции печени от нормальных значений.

Нарушение питания и обмена веществ: повышенный аппетит.

Общие нарушения и состояние в месте введения: отек.

Прием препарата следует прекратить при появлении любого из вышеперечисленных побочных эффектов и когда причина его развития не может быть установлена однозначно.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к левоцетиризину или к любой другой составляющей данной лекарственной формы, или к любым производным пиперазина.

Тяжелая форма хронической почечной недостаточности (клиренс креатинина)

Дети до 6 месяцев.

Беременность и период лактации.

Лекарственные взаимодействия

-Исследования с левоцетиризином относительно взаимодействия не проводились. Исследования с цетиризином (соединение рацемата) показали, что одновременное применение с антипирином, псевдоэфедрином, циметидином, кетоконазолом, эритромицином, азитромицином, глипизидом или диазепамом не оказывает клинически значимых неблагоприятных взаимодействий.

-Совместное применение с теофиллином (400 мг/сутки) снижает на 16 % общий клиренс цетиризина (кинетика теофиллина не изменяется).

-При исследовании многократного введения ритонавира (600 мг 2 раза в сутки) и цетиризина (10 мг в сутки) степень экспозиции цетиризина увеличивалась приблизительно на 40 %, тогда как распределение ритонавира несколько изменялось (-11 %) относительно параллельного применения цетиризина.

-Совместное применение с макролидами или кетоконазолом не вызывало достоверных изменений на ЭКГ.

-У чувствительных пациентов одновременный прием препарата с алкоголем или другими средствами, угнетающими ЦНС, может оказать воздействие на центральную нервную систему.

-Прием пищи не влияет на степень всасывания препарата, но снижает скорость его абсорбции.

Особые указания

С осторожностью применять пациентам с хронической почечной недостаточностью (необходима коррекция режима дозирования) и пациентам пожилого возраста (возможно снижение клубочковой фильтрации). Во время применения препарата следует воздерживаться от употребления алкоголя.

Наличие у пациентов определенных факторов, провоцирующих задержку мочи (например, травмы спинного мозга, гиперплазия предстательной железы), необходимо принимать во внимание при назначении препарата, поскольку левоцетиризин в составе препарата Полиноса может увеличить риск задержки мочи.

Нет данных относительно усиления эффекта седативных средств при применении в терапевтических дозах, но следует избегать применения седативных средств во время приема препарата.

Передозировка

Симптомы: у взрослых передозировка может сопровождаться сонливостью; у детей – вначале возбуждение и повышенная раздражительность с последующей сонливостью.

Лечение. Специфического антидота к левоцетиризину нет. В случае появления симптомов передозировки рекомендуется симптоматическая и поддерживающая терапия. Следует

рассмотреть необходимость промывания желудка через короткое время после применения препарата, активированный уголь, симптоматическая терапия. Гемодиализ для выведения левоцетиризина из организма не эффективен.

Применение при беременности и в период лактации

Адекватных и строго контролируемых клинических исследований по безопасности применения препарата у беременных женщин не проводилось, поэтому препарат Полиноса не следует назначать при беременности.

Левоцетиризин проникает в грудное молоко, поэтому при необходимости применения препарата Полиноса кормление грудью следует прекратить.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и занятиями потенциально опасными видами деятельности

Следует воздерживаться от управления транспортом или работы с другими механизмами во время лечения препаратом.

Форма выпуска

Во флаконах-капельницах из полиэтилена или полипропилена с крышкой, завинчивающейся по 10 мл. По 1 флакону-капельнице вместе с инструкцией по применению в картонной пачке.

Условия хранения

Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C.

Следует хранить в недоступном для детей

Срок годности

2 года.

Не применять после истечения срока годности.

Условия отпуска из аптек

Без рецепта.

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

СП ООО "Jurabek Laboratories"

Республика Узбекистан, 100003, г. Ташкент, ул. Алмазар 165,

тел/факс: (99878) 1500303

Web: www.jurabek.uz