

เอกสารกำกับยาภาษาไทย

เลโวเซต

1. ชื่อผลิตภัณฑ์

เลโวเซต

2. ชื่อและความแรงของตัวยาสําคัญ

ยาเม็ดเคลือบฟิล์ม 1 เม็ด ประกอบด้วย เลโวซีทริซีน ไดไฮโดรคลอไรด์ 5 มิลลิกรัม

3. ลักษณะของผลิตภัณฑ์

เม็ดรูปรี นูน เคลือบฟิล์มสีขาว ด้านหนึ่งมีขีดแบ่งครึ่ง มีอักษร L และ C อยู่คนละข้างของขีดแบ่งครึ่ง อีกด้านหนึ่งมีตัวเลข 5 ตรงกลางเม็ด

4. เกสซ์พลศาสตร์/เกสซ์จลนศาสตร์

4.1 เกสซ์พลศาสตร์

กลไกการออกฤทธิ์ของยา

เลโวซีทริซีน เป็น active *R*-enantiomer ของซีทริซีน อยู่ในกลุ่ม second generation antihistamine ออกฤทธิ์ต้านฮีสตามีนแบบเฉพาะเจาะจงกับ H1-receptors และอยู่ในกลุ่มที่ห้ามั้งวงน้อย

4.2 เกสซ์จลนศาสตร์

เลโวซีทริซีน ถูกดูดซึมได้อย่างรวดเร็วจากทางเดินอาหาร ระดับยาในพลาสมาจะสูงสุดภายใน 0.9 ชั่วโมงหลังรับประทานยา อาหารที่มีไขมันสูงจะลดระดับยาในพลาสมาลงได้ประมาณ 36% และทำให้เวลาที่ยาในพลาสมาถึงระดับสูงสุดช้าลงประมาณ 1.25 ชั่วโมง แต่ไม่มีผลต่อ AUC แสดงว่าอาหารที่มีไขมันจะทำให้ยาถูกดูดซึมได้ช้าลง แต่ดูดซึมได้สมบูรณ์ ค่าเฉลี่ยปริมาณการกระจายตัวของยา 0.4 ลิตร/กิโลกรัม เลโวซีทริซีนจับกับโปรตีนในพลาสมาประมาณ 91 – 92% (ยาส่วนใหญ่จับกับอัลบูมิน) ยาเลโวซีทริซีน (น้อยกว่า 14%) จะถูกแปรรูปผ่านกระบวนการ aromatic oxidation, *N*-dealkylation, *O*-dealkylation and taurine conjugation เลโวซีทริซีนถูกขับออกทางปัสสาวะ 85.4% โดยผ่าน glomerular filtration และ active tubular secretion และขับออกทางอุจจาระ 12.9% ค่า half-life ของการกำจัดยา คือ 8 – 9 ชั่วโมง ในผู้ใหญ่

5. ข้อบ่งใช้

ใช้รักษาอาการที่เกิดจากการแพ้ต่างๆ เช่น เยื่อบุจมูกอักเสบจากภูมิแพ้ (เยื่อบุจมูกอักเสบ จากการแพ้ตามฤดูกาล, เยื่อบุจมูกอักเสบ จากการแพ้ตลอดปี, เยื่อบุอักเสบจากการแพ้ชนิด persistent rhinitis); อาการทางจมูก รวมถึง น้ำมูกไหล คัน จาม และคัดจมูก; อาการทางตา รวมถึงคัน แดง และน้ำตาไหล; ลมพิษเรื้อรัง; อาการทางผิวหนัง รวมถึง ผื่นนูนแดง ผื่นแดง คัน และอาการแพ้ทางผิวหนังอื่นๆ [1, p.1-3, 2 p.1-2, 3 p.1310, 4 p.289-290, 5 p.233, 235, 7

6. ขนาดยาที่แนะนำ

ผู้ใหญ่และเด็กอายุ 12 ปีขึ้นไป: รับประทานครั้งละ 1 เม็ด วันละ 1 ครั้ง

เด็กอายุ 6 – 12 ปี: รับประทานครั้งละ 1 เม็ด วันละ 1 ครั้ง [1 p.2, 2 p.1-2, 6 p.268-269, 272-274, 7, p.360]

ผู้ป่วยที่มีไตทำงานไม่ปกติ: ผู้ใหญ่และเด็กอายุ 12 ปีขึ้นไป ปรับขนาดยาที่ใช้ตามตารางการให้ยาที่แนะนำ

การปรับขนาดยาที่ใช้สำหรับผู้ป่วยที่มีไตทำงานไม่ปกติ

กลุ่มผู้ป่วย	Creatinine clearance (ml/min)	ขนาดและความถี่ที่ใช้ยา
อาการน้อย	50 – 80	½ เม็ด วันละ 1 ครั้ง
อาการปานกลาง	30 – 50	½ เม็ด วันละ 1 ครั้ง วันเว้นวัน
อาการหนัก	10 – 30	½ เม็ด สองครั้งต่อสัปดาห์ (วันละครั้ง ทุกๆ 3-4 วัน)
อาการขั้นสุดท้ายของโรคไต และผู้ป่วยที่อยู่ใน ในสภาวะต้องล้างไต	< 10	ห้ามใช้ยานี้

ผู้ป่วยที่มีตับผิดปกติ: ไม่จำเป็นต้องปรับขนาดยาที่ใช้ในผู้ป่วยที่มีตับผิดปกติเพียงอย่างเดียว

7. วิธีการใช้ยา

เลโวซิทรินีน ไดไฮโดรคลอไรด์ เป็นยาชนิดรับประทานวันละ 1 ครั้ง ก่อนนอน (สามารถรับประทานยาโดยไม่ต้องคำนึงถึงมื้ออาหาร)

8. ข้อห้ามใช้

- 1) ห้ามใช้ในผู้ป่วยที่แพ้ยาเลโวซิทรินีน หรือส่วนประกอบตัวอื่นๆ ในตำรับ หรือยาซิทรินีน
- 2) ห้ามใช้ในผู้ป่วยไตทำงานผิดปกติขั้นรุนแรงที่มี creatinine clearance น้อยกว่า 10 มล./นาที หรือผู้ป่วยที่ทำการฟอกเลือด
- 3) ห้ามใช้ในเด็กอายุ 6 เดือน ถึง 11 ปี ที่ไตทำงานผิดปกติ

9. คำเตือนและข้อควรระวัง

- 1) ผู้ป่วยที่ได้รับยาเลโวซิทรินีนอาจมีอาการง่วงนอน ควรหลีกเลี่ยงกิจกรรมที่อาจทำให้เกิดอันตราย เช่น การใช้เครื่องจักรกล การขับขี่ยานยนต์ หรือการทำงานในที่สูง
- 2) ควรหลีกเลี่ยงการใช้ยาเลโวซิทรินีน ร่วมกับเครื่องดื่มที่มีแอลกอฮอล์ผสมอยู่ หรือยาในกลุ่ม CNS depressants
- 3) ระวังการใช้ยาในผู้ป่วยที่มีปัจจัยเสี่ยงต่อการปัสสาวะไม่ออก (เช่น บาดเจ็บไขสันหลัง ต่อมลูกหมากโต) หากได้รับยาเลโวซิทรินีนแล้วปัสสาวะไม่ออกให้หยุดยา

คำเตือนตามประกาศกระทรวงสาธารณสุข

1. ยานี้อาจทำให้ง่วงซึม จึงไม่ควรขับขี่ยานยนต์ หรือทำงานเกี่ยวกับเครื่องจักรกล หรือทำงานที่เสี่ยงต่อการพลัดตกจากที่สูง
2. ไม่ควรรับประทานร่วมกับสุรา หรือสิ่งที่มีแอลกอฮอล์เป็นส่วนประกอบ
3. ไม่ควรใช้ในสตรีมีครรภ์ระยะ 3 เดือนแรก สตรีที่ให้นมบุตร และเด็กอายุต่ำกว่า 2 ปี

4. ระวังการใช้ยานี้ร่วมกับยาที่มีฤทธิ์กดระบบประสาทส่วนกลาง เช่น ยากลุ่ม Benzodiazepines หรือยาด้านอาการซึมเศร้าชนิดต่างๆ

5. ระวังการใช้ยานี้ในผู้ป่วยโรคตับ หรือโรคไต

6. ยานี้อาจทำให้ตาพร่า สับสน และปัสสาวะขัดได้

10. อันตรกิริยากับยาอื่นๆ

10.1 ไม่มีการศึกษาปฏิกิริยาระหว่างยาของเลโวซิทีรีซีน (รวมทั้งไม่มีการศึกษากับยาที่มีฤทธิ์เหนี่ยวนำ CYP3A4)

10.2 การศึกษาวิจัยทางคลินิกไม่พบผลเสียจากการให้ยาเลโวซิทีรีซีน ร่วมกับยาซูโดเอพิเดรין ยาซีเมทีดีน ยาดีโตโคนาโซล ยาอีริโทรมัยซิน ยาอะซิโทรมัยซิน ยาอะซิโทรมัยซิน ยาไกลปิซัยด์ และยาไดอะซีแพม

10.3 การให้ยา cetirizine ร่วมกับ ritonavir ส่งผลให้ปริมาณยาในเลือด (AUC) และ half-life ของยา cetirizine เพิ่มขึ้น การขับถ่ายยาซิทีรีซีนลดลง แต่การขับถ่ายยา ritonavir ไม่เปลี่ยนแปลง

10.4 การให้ยา cetirizine ร่วมกับ theophylline จะทำให้การขับถ่ายยา cetirizine ลดลง (16%) แต่การขับถ่ายยา theophylline ไม่เปลี่ยนแปลง

11. สตรีมีครรภ์และสตรีระหว่างให้นมบุตร

เลโวซิทีรีซีน จัดเป็น Pregnancy Category B ความปลอดภัยในการใช้ยาในสตรีมีครรภ์ยังไม่เป็นที่ยอมรับ เลโวซิทีรีซีนคาดว่าถูกขับออกทางน้ำนม (เนื่องจากยาซิทีรีซีนถูกขับออกทางน้ำนม) ไม่แนะนำการใช้ยาเลโวซิทีรีซีนในสตรีระหว่างให้นมบุตร

12. อาการไม่พึงประสงค์

ทั่วไปที่พบ

ระบบทางเดินอาหาร: ท้องผูก (ทารก 6.7%, เด็ก 0.9%), ท้องเสีย (ทารก 13.3%, เด็ก 3.5%), ปวดเนื่องจากฟันขึ้น (ทารก 6.7%, เด็ก 1.8%)

ระบบประสาท: อ่อนเพลียขาดกำลัง (2.3%), ง่วงนอนมากในตอนกลางวัน (ทารก 4.4%, เด็ก 3%, ผู้ใหญ่ 5% – 6%)

ระบบทางเดินหายใจ: จมูกและคออักเสบ (4% – 6%), ลำคออักเสบ (1% – 2%), ปากแห้ง (2% – 3%)

อื่น ๆ : อ่อนเพลีย (1% – 4%), ไข้ (เด็ก 4% – 4.4%)

13. การได้รับยาเกินขนาดและวิธีการรักษา

อาการ: อาจมีอาการง่วงนอนในผู้ใหญ่ ในเด็กจะเริ่มด้วยอาการสับสน กระสับกระส่าย และตามด้วยอาการง่วงนอน

การรักษา: ไม่มียาแก้พิษเฉพาะสำหรับยาเลโวซิทีรีซีน หากมีการรับประทานยาเกินขนาดเกิดขึ้น ให้รักษาตามอาการ ควรพิจารณาใช้วิธีล้างท้องในผู้ที่รับประทานยาเข้าไปไม่เกิน 2 ชั่วโมง ยาเลโวซิทีรีซีนไม่สามารถกำจัดออกไปอย่างมีประสิทธิภาพด้วยวิธี haemodialysis

14. สถานะการเก็บรักษา

เก็บที่อุณหภูมิต่ำกว่า 30 องศาเซลเซียส

15. รูปแบบยาและขนาดบรรจุที่มีจำหน่าย

รูปแบบยา: ยาเม็ดเคลือบฟิล์ม

ขนาดบรรจุ: บรรจุในแผงบลิสเตอร์อลูมิเนียม แผงละ 10 เม็ด ซึ่งบรรจุในกล่องกระดาษ กล่องละ 1, 10, และ 50 แผง

16. ชื่อและที่อยู่ของผู้ผลิต



บริษัท ชุมชนเภสัชกรรม จำกัด (มหาชน)

1 ซอยคูบอน 11 แขวงรามอินทรา เขตคันนายาว กรุงเทพฯ 10230 ประเทศไทย

โทรศัพท์: 0-2943-0935-7 แฟกซ์: 0-2510-7874

17. วันที่มีการแก้ไขปรับปรุงเอกสาร

7 กรกฎาคม 2565

เอกสารกำกับยาภาษาอังกฤษ

LEVOCET

1. Product Name

LEVOCET

2. Name and strength of active ingredient

Each film-coated tablet contains Levocetirizine dihydrochloride 5 mg

3. Product description

Biconvex, oval, white film coated tablet. One side has score and letter “L” and “C” on each side. Another side has figure “5”.

4. Pharmacodynamic/Pharmacokinetics

4.1 Pharmacodynamic

Mechanism of action

Levocetirizine is the active *R*-enantiomer of cetirizine, a second generation antihistamine. The drug is selective antagonism of histamine H₁-receptors and as a group, is less sedating.

4.2 Pharmacokinetics

Levocetirizine is rapidly and extensively absorbed following oral administration, with peak plasma concentration usually attained in 0.9 hour. A high-fat meal reduces peak plasma concentration by about 36% and delays time to peak plasma concentration by about 1.25 hours, but does not affect AUC. A high-fat meal delays drug absorption but completely absorbed. The average apparent volume of distribution is 0.4 L/kg. Levocetirizine is approximately 91 - 92% bound to plasma proteins (mainly albumin). The extent of metabolism of levocetirizine is less than 14% of dose by aromatic oxidation, *N*-dealkylation, *O*-dealkylation and taurine conjugation. Levocetirizine is excreted in urine; 85.4% (via glomerular filtration and active tubular secretion) and excreted in the feces 12.9%. The elimination half-life is 8 – 9 hours in adults.

5. Indication

Levocetirizine is indicated for relief of symptoms associated with *allergic conditions such as allergic rhinitis (seasonal allergic rhinitis; perennial allergic rhinitis; persistent allergic rhinitis); nasal symptoms include runny nose, itching, sneezing, and congestion; ocular symptoms include itching, redness, and watery eyes; chronic urticaria; skin symptoms include wheal, flare, itching, and other allergic dermatologic disorders.* [1, p.1-3, 2 p.1-2, 3 p.1310, 4 p.289-290, 5 p.233, 235, 7 p.357]

6. Recommended Dose

Adults and children 12 years of age and older: 1 tablet once daily.

Children 6 - 12 years of age: 1 tablet once daily. [1 p.2, 2 p.1-2, 6 p.268-269, 272-274, 7, p.360]

Patients with renal function impairment: The following applies to adults and children 12 years of age and older.

Dosing adjustments for patients with impaired renal function:

Group	Creatinine clearance (mL/min)	Dosage and frequency
Mild	50 – 80	½ tablet once daily
Moderate	30 – 50	½ tablet once every other day
Severe	10 – 30	½ tablet twice weekly (administer once every 3 – 4 days)
End-stage renal disease and patients undergoing hemodialysis	< 10	Use contraindicated

Patients with hepatic impairment: no dosage adjustment is necessary in patients with hepatic impairment.

7. Mode of Administration

Levocetirizine dihydrochloride is administered orally once daily in the evening without regard to meals.

8. Contraindication

1) Levocetirizine is contraindicated in patients who are hypersensitive to levocetirizine or any ingredient in the formulation or to cetirizine.

2) Levocetirizine is contraindicated in patients with in end-stage renal disease (creatinine clearance less than 10 mL/min) or undergoing hemodialysis.

3) Levocetirizine is contraindicated in children 6 months to 11 years of age with renal impairment.

9. Warning and Precaution

1) Patients receiving of levocetirizine may have somnolence. Avoid performing hazardous activities (e.g., operating machinery, driving a motor vehicle or work in high places)

2) Concomitant use of levoceitizine with alcohol or other CNS depressants should be avoided.

3) Use with caution in patients with predisposing factors of urinary retention (eg, spinal cord lesion, prostatic hyperplasia) as levocetirizine may increase the risk of urinary retention. Discontinue if urinary retention occurs.

10. Interactions with Other Medication

10.1) No interaction studies have been performed with levocetirizine (including no studies with CYP3A4 inducers).

10.2) Studies with the racemate compound cetirizine demonstrated that there were no clinically relevant adverse interactions (with pseudoephedrine, cimetidine, ketoconazole, erythromycin, azithromycin, glipizide and diazepam).

10.3) Concomitant administration of cetirizine and ritonavir may increase the AUC and half-life and decreased the clearance of cetirizine; the disposition of ritonavir was not altered.

10.4) Concomitant use of cetirizine and theophylline resulted in decrease clearance (16%) of cetirizine; the disposition of theophylline was not altered.

11. Pregnancy and Lactation

Pregnancy Category B. Safety for use drug pregnancy has not been established.

Levocetirizine is expected to be distributed into milk (since cetirizine is distributed into milk). The use of levocetirizine in breast-feeding mother is not recommended.

12. Undesirable Effects

Common;

Gastrointestinal: Constipation (infants 6.7%, children 0.9%), Diarrhea (infants 13.3%, children 3.5%), Painful teething (infants 6.7%, children 1.8%)

Neurologic: Asthenia (2.3%), Somnolence (infants 4.4%, children 3%, adults 5% – 6%)

Respiratory: Nasopharyngitis (4% – 6%), Pharyngitis (1% to 2%), Xerostomia (2% – 3%)

Other: Fatigue (1% – 4%), Fever (Children 4% – 4.4%)

13. Overdose and Treatment

Symptoms: Symptoms of overdose may include drowsiness in adults and initially agitation and restlessness, followed by drowsiness in children.

Treatment: There is no known specific antidote to levocetirizine. Should overdose occur, symptomatic or supportive treatment is recommended. Gastric lavage should be considered following ingestion within 2 hours. Levocetirizine is not effectively removed by haemodialysis.

14. Storage Condition

Store at a temperature below 30 °C

15. Dosage Forms and Packaging Available

Dosage forms: Film-coated tablets

Packaging Available: 10 tablets in Aluminium-Aluminium blister, which packed in carton box of 1, 10, and 50 blisters.

16. Name and Address of Manufacturing



COMMUNITY PHARMACY PUBLIC COMPANY LIMITED

1 Soi Khubon 11, Ramintra, Kannayao, Bangkok 10230, Thailand

Tel. 0-2943-0935-7 Fax. 0-2510-7874

17. Date of revision of package insert

July 7th, 2022