Состав

действующее вещество: цетиризина дигидрохлорид;

1 таблетка содержит цетиризина дигидрохлорид 10 мг;

вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, 30, магния стеарат, гипромеллоза (2910/5), полиэтиленгликоль (макрогол 6000), тальк, титана диоксид (Е 171), эмульсия симетикона (SE 4).

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые оболочкой.

Основные физико-химические свойства: таблетки, покрытые оболочкой, продолговатой формы, белого или почти белого цвета с насечкой с одной стороны.

Фармакотерапевтическая группа

Антигистаминные средства для системного применения. Производные пиперазина. Код АТХ R06A E07.

Фармакодинамика

Цетиризин, метаболит гидроксизина, что образуется в организме человека, является мощным селективным антагонистом периферических Н1-рецепторов. Исследование связывания с рецептором в условиях in vitro не показали значительного аффинности к другим рецепторов, кроме Н1-рецепторов.

Было показано, что кроме этого анти-Н1 эффекта, цетиризин вызывает противоаллергическое действие: в дозе 10 мг 1 или 2 раза в сутки ингибирует позднюю стадию мобилизации эозинофилов в коже и конъюнктиве пациентов с атопическим дерматитом, которым была проведена провокационная проба на наличие аллергии.

Исследования среди здоровых добровольцев показали, что цетиризин в дозах 5 и 10 мг выражено ингибирует реакции с появлением пузырей и воспалительной гиперемии, вызванных очень высокими концентрациями гистамина в коже, однако корреляции с эффективностью не установлено.

Во время проведения исследования среди детей в возрасте от 5 до 12 лет в течение 35 дней не было обнаружено привыкания к антигистаминного эффекта

цетиризина (подавление появления волдырей и воспалительной гиперемии). Когда после применения повторных доз цетиризина лечения прекращалось, нормальная реакция кожи на гистамин восстанавливалась в течение 3 дней.

Во время 6-недельного плацебо-контролируемого исследования с участием 186 пациентов с аллергическим ринитом на фоне бронхиальной астмы легкой или средней степени тяжести цетиризин в дозе 10 мг 1 раз в сутки уменьшал симптомы ринита, не влияя при этом на функцию легких. Это исследование подтверждает безопасность применения цетиризина пациентам с аллергией, которые имеют бронхиальной астмой легкой или средней степени тяжести.

В плацебо-контролируемом исследовании применение цетиризина, предназначавшийся в высокой дозе 60 мг в течение 7 дней, не вызывало статистически значимого удлинения интервала QT.

Продемонстрировано, что в рекомендованных дозах цетиризин улучшает качество жизни пациентов с круглогодичным и сезонным аллергическим ринитом.

Фармакокинетика

Пиковая концентрация в плазме крови в равновесном состоянии составляет около 300 нг/мл и достигается в течение 1,0 ± 0,5 ч. После приема цетиризина в дозе 10 мг в течение 10 дней кумуляции не наблюдалось. Распределение таких фармакокинетических параметров, как максимальная концентрация в плазме крови (Cmax) и площадь под фармакокинетической кривой (AUC), является однородным среди добровольцев.

Степень абсорбции цетиризина не снижается при приеме пищи, однако снижается скорость абсорбции. Биодоступность цетиризина в форме раствора, капсул или таблеток аналогична.

Предполагаемый объем распределения в организме составляет 0,50 л/кг. Процент связывания цетиризина с белками плазмы крови составляет 93 ± 0,3%. Цетиризин не влияет на связывание варфарина с белками плазмы крови.

Цетиризин не претерпит значительного метаболизма при первом прохождении. Примерно 2/3 вещества выделяется с мочой в неизмененном виде. Конечный период полувыведения составляет примерно 10 часов.

В диапазоне доз от 5 до 60 мг фармакокинетика цетиризина является линейной.

Особые популяции пациентов.

Пациенты пожилого возраста: после однократного приема препарата в дозе 10 мг период полувыведения увеличился примерно на 50%, а клиренс уменьшился на 40% у 16 пациентов пожилого возраста по сравнению с обычными пациентами. Снижение клиренса цетиризина в этих добровольцев пожилого возраста, очевидно, связано со снижением в них функции почек.

Дети, младенцы и дети раннего дошкольного возраста: период полувыведения цетиризина составляет приблизительно 6 часов в возрасте от 6 до 12 лет, а в возрасте от 2 до 6 лет - 5 часов. У новорожденных и детей раннего дошкольного возраста (от 6 до 24 месяцев) этот показатель снижен до 3,1 часа.

Пациенты с нарушением функции почек: фармакокинетические показатели препарата были подобными у пациентов с легкой нарушением функции почек (клиренс креатинина 40 мл/мин) и здоровых добровольцев. У пациентов с умеренным нарушением функции почек отмечалось трехкратное увеличение периода полувыведения и снижение клиренса на 70% по сравнению со здоровыми добровольцами.

У пациентов, находящихся на гемодиализе (клиренс креатинина ниже 7 мл/мин), после однократного приема цетиризина в дозе 10 мг отмечалось трехкратное увеличение периода полувыведения и снижение клиренса на 70% по сравнению с обычными пациентами. Цетиризин плохо удаляется с помощью гемодиализа. Для пациентов с умеренным или тяжелым нарушением функции почек необходима коррекция дозы (см. Раздел «Способ применения и дозы»).

Пациенты с нарушением функции печени: у пациентов с хроническими заболеваниями печени (гепатоцеллюлярной, холестатическом заболеваниями и билиарным циррозом), которые однократно приняли 10 или 20 мг цетиризина, отмечалось увеличение периода полувыведения на 50% и снижение клиренса на 40% по сравнению со здоровыми пациентами. Корректировка дозы для пациентов с нарушением функции печени необходимо лишь в случае наличия сопутствующего нарушения функции почек.

Показания

Лекарственное средство показан для облегчения назальных и глазных симптомов сезонного и постоянного аллергического ринита и хронической идиопатической крапивницы у взрослых и детей старше 6 лет.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к действующему веществу или к любому вспомогательному веществу, входящему в состав лекарственного средства, в

гидроксизином или в любой производной вещества пиперазина.

Тяжелое нарушение функции почек с клиренсом креатинина менее 10 мл/мин.

Редкие наследственные формы непереносимости галактозы, дефицит лактазы Лаппа или мальабсорбция глюкозы-галактозы.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Учитывая фармакокинетические и фармакодинамические свойства цетиризина, а также на его профиль переносимости никаких взаимодействий для этого антигистаминного средства не ожидается. В течение всего периода проведения исследований межлекарственного взаимодействия, в частности с псевдоэфедрина или теофиллином в дозе 400 мг в сутки, никаких фармакодинамических или статистически значимых фармакокинетических взаимодействий не отмечалось.

Исследование фармакокинетического взаимодействия проводили цетиризина и псевдоэфедрина, антипирина, циметидина, кетоконазола, эритромицина, азитромицина - фармакокинетических взаимодействий не наблюдалось. В исследовании многократного применения теофиллина (400 мг 1 раз в сутки) и цетиризина наблюдалось незначительное (16%) снижение клиренса цетиризина, в то время как распределение теофиллина не менялся при одновременном приеме цетиризина.

В исследованиях применения цетиризина с циметидином, глипизидом, диазепамом и псевдоэфедрина не обнаружено доказательств побочных фармакодинамических взаимодействий.

В исследованиях применения цетиризина с азитромицином, эритромицином, кетоконазолом, теофиллином и псевдоэфедрина не обнаружено доказательств побочных клинических взаимодействий. Кроме того, одновременное применение цетиризина с макролидами или кетоконазолом никогда не приводило к клинически значимых изменений на ЭКГ.

В исследовании многократного применения ритонавира (600 мг 2 раза в сутки) и цетиризина (10 мг в сутки) экспозиция цетиризина увеличилась примерно на 40%, в то время как распределение ритонавира несколько менялся (-11%) при одновременном приеме цетиризина.

Объем абсорбции цетиризина не снижается при приеме пищи, хотя показатель абсорбции уменьшается на 1 час.

В чувствительных пациентов одновременное употребление алкоголя или других депрессантов центральной нервной системы может вызвать дополнительное снижение внимания и ухудшение работоспособности, хотя цетиризин не усиливает действие алкоголя (при уровне алкоголя в крови 0,5 г/л).

Особенности применения

При приеме в терапевтических дозах не наблюдалось клинически значимых взаимодействий с алкоголем (при уровнях алкоголя в крови 0,5 г/л). Однако рекомендуется избегать одновременного употребления алкоголя.

С осторожностью применять пациентам, склонным к задержке мочи (повреждение позвоночника, гиперплазия простаты), так как цетиризин повышает риск развития задержки мочи.

Рекомендуется с осторожностью назначать пациентам с эпилепсией и пациентам с риском возникновения судорог.

Антигистаминные препараты подавляют кожную аллергическую пробу, поэтому перед ее проведением прием препарата необходимо прекратить за 3 дня до исследования (период вывода).

С осторожностью применять пациентам с хронической почечной недостаточностью (требуется коррекция режима дозирования) и пациентам пожилого возраста с почечной недостаточностью (возможно снижение клубочковой фильтрации).

Цетиризин в виде таблеток, покрытых оболочкой, нельзя применять пациентам с редкими наследственными формами галактоземии, наследственным дефицитом лактазы или мальабсорбцией глюкозы и галактозы.

Зуд и/или крапивница могут появиться после отмены цетиризина, даже если эти симптомы не присутствовали до начала лечения. В некоторых случаях симптомы могут быть интенсивными и может потребоваться повторное лечение после его прекращения.

Педиатрическая популяция

Применение препарата в форме таблеток, покрытых оболочкой, не рекомендуется детям до 6 лет, поскольку эта лекарственная форма не позволяет осуществлять необходимую корректировку дозы.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Объективное оценивание способности управлять транспортными средствами, наличия скрытой сонливости и способности работать на конвейере не выявило каких клинически значимых эффектов при применении препарата в рекомендуемой дозе 10 мг.

Пациентам, которые собираются садиться за руль, заниматься потенциально опасной деятельностью или работать с механизмами, не следует превышать рекомендуемую дозу и нужно учитывать реакцию собственного организма на данный препарат. В чувствительных пациентов одновременный прием препарата с другими средствами, угнетающими деятельность центральной нервной системы, может вызвать дополнительное ухудшение концентрации внимания и снижение производительности.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность. Недостаточно данных о влиянии препарата в период беременности. Исследования на животных не указывают на прямое или косвенное вредное влияние на беременность, эмбриональное/фетальный развитие, роды или постнатальное развитие. Назначать беременным женщинам следует с осторожностью и только в случаях, когда, по мнению врача, польза от применения превышает потенциальный риск для плода.

Период кормления грудью. Цетиризин проникает в грудное молоко в концентрациях, составляющих 25-90% от концентрации в плазме крови, в зависимости от промежутка времени после применения препарата. Поэтому с осторожностью следует назначать препарат женщинам, которые кормят грудью.

Фертильность. Доступные ограниченные данные о влиянии на человеческую фертильность, однако ни вредного воздействия не было обнаружено. Данные исследований на животных не показали вредного воздействия на человеческую фертильность.

Способ применения и дозы

Дети в возрасте от 6 до 12 лет: 5 мг 2 раза в сутки (½ таблетки 2 раза в сутки).

Взрослые и дети старше 12 лет: 10 мг 1 раз в сутки (1 таблетка 1 раз в сутки).

Таблетки нужно глотать, запивая стаканом воды.

Пациенты пожилого возраста при нормальной функции почек: дозу препарата снижать не требуется.

Пациенты с нарушением функции почек средней и тяжелой степени: данных о соотношении «эффективность / безопасность» для пациентов с нарушением функции почек нет. Поскольку цетиризин выводится преимущественно почками (см. Раздел «Фармакологические свойства»), то в случаях, когда нельзя применить другой метод лечения, интервалы между дозами необходимо устанавливать индивидуально. Корректировать дозу препарата нужно в соответствии с нижеследующей таблице. Для того, чтобы пользоваться этой таблицей дозирования, нужно рассчитать клиренс креатинина пациента (УК) в мл / мин.

Группа	**Клиренс креатинина (мл/мин)**	**Доза и частота приема**
Функция почек в норме	≥ 80	10 мг 1 раз в сутки
Нарушение функции почек легкой степени	50–79	
Нарушение функции почек средней степени тяжести	30–49	5 мг 1 раз в сутки
Нарушение функции почек тяжелой степени	< 30	5 мг 1 раз в 2 дня
Терминальная стадия болезни почек - пациенты, которым проводят гемодиализ	< 10	Противопоказано

Детям с нарушениями функции почек дозу нужно подбирать индивидуально, учитывая значение почечного клиренса каждого пациента, а также его возраст и массу тела.

Пациенты с нарушением функции печени: для пациентов, которые имеют лишь нарушение функции печени, корректировать дозы.

Пациенты с нарушением функции печени и почек: рекомендуется коррекция дозы (см. Выше «Пациенты с нарушением функции почек средней и тяжелой степени»).

Продолжительность лечения определяет врач индивидуально в зависимости от течения заболевания.

Дети

Препарат назначать детям в возрасте от 6 лет. Препарат в форме таблеток, покрытых оболочкой, не рекомендуется применять детям до 6 лет, поскольку эта лекарственная форма не позволяет подобрать нужную дозу.

Передозировка

Симптомы. Симптомы, наблюдающиеся при передозировке цетиризином, преимущественно связанные с его влиянием на центральную нервную систему или проявлениями, могут напоминать антихолинергическим эффектом.

К нежелательным явлениям, которые наблюдались после приема дозы, минимум в 5 раз превышает рекомендуемую суточную дозу, относятся: спутанность сознания, диарея, вертиго, повышенная утомляемость, головная боль, недомогание, мидриаз, зуд, беспокойство, седативный эффект, сонливость, ступор, тахикардия, тремор и задержка мочеиспускания.

Лечение. Специфический антидот цетиризина неизвестен. В случае передозировки рекомендуется проводить симптоматическую или поддерживающую терапию. После приема препарата нужно как можно быстрее провести промывание желудка. Удаление цетиризина с помощью диализа неэффективно.

Побочные реакции

Клинические исследования показали, что применение цетиризина в рекомендованных дозах может приводить к незначительным нежелательных эффектов на центральную нервную систему, включая сонливость, повышенную утомляемость, вертиго и головную боль. В некоторых случаях были сообщения о парадоксальной стимуляции центральной нервной системы.

Хотя цетиризин является селективным антагонистом периферических H1-рецепторов без относительной антихолинергического активности, были сообщения о единичных случаях затруднение мочеиспускания, нарушения аккомодации глаз и сухость во рту.

Известно о случаях нарушения функции печени с повышением уровня печеночных ферментов в сочетании с повышением уровня билирубина. В большинстве случаев эти симптомы исчезали после прекращения лечения

цетиризина дигидрохлорид.

В двойных слепых контролируемых клинических или фармакоклиничних исследованиях сравнения цетиризина и плацебо или антигистаминных препаратов в рекомендованных дозах (10 мг в сутки цетиризина), в которых доступны количественные данные по безопасности, приняли участие более 3200 пациентов, принимавших цетиризин. В плацебо-контролируемых исследованиях при применении цетиризина в дозе 10 мг в менее 1,0% пациентов наблюдались такие побочные эффекты

Нежелательные реакции **(Согласно терминологии ВОЗ)**	**Цетиризин 10 мг** **(n = 3260)**	**Плацебо** **(n = 3061)**
Организм в целом - общие расстройства повышенная утомляемость	1,63 %	0,95 %
Со стороны центральной и периферической нервной системы вертиго головная боль	1,10 % 7,42 %	0,98 % 8,07 %
Со стороны желудочно-кишечного тракта боль в животе сухость во рту тошнота	0,98 % 2,09 % 1,07 %	1,08 % 0,82 % 1,14 %

Со стороны психики сонливость	9,63 %	5,00 %
Со стороны дыхательной системы фарингит	1,29 %	1,34 %

Хотя сонливость возникала статистически чаще, чем в группе плацебо, в большинстве случаев ее степень легкий или умеренный. Другие исследования показали, что при применении препарата в рекомендуемых суточных дозах у здоровых молодых добровольцев повседневная активность не нарушалась.

Среди детей в возрасте от 6 месяцев до 12 лет, которые были включены в плацебо-контролируемые клинические или фармакоклинични исследования, отмечались такие побочные реакции на препарат, частота которых составляла 1% или выше:

Нежелательные реакции **(Согласно терминологии ВОЗ)**	**Цетиризин** **(n = 1656)**	**Плацебо** **(n = 1294)**
Со стороны желудочно-кишечного тракта диарея	1 %	0,6 %
Со стороны психики сонливость	1,8 %	1,4 %
Со стороны дыхательной системы ринит	1,4 %	1,1 %
Организм в целом - общие расстройства повышенная утомляемость	1 %	0,3 %

Опыт послерегистрационного применения

В течение послерегистрационного применения наблюдались следующие побочные реакции на препарат. По частоте возникновения реакции разделены на группы: нечасто (от ≥ 1/1000 до <1/100), редко (от ≥ 1/10000 до <1/1000), очень редко (от <1/10000), частота неизвестна (не может быть оценена по доступным данным).

Со стороны крови и лимфатической системы

Очень редко тромбоцитопения.

Со стороны иммунной системы

Редко гиперчувствительность.

Очень редко анафилактический шок.

Со стороны психики

Нечасто психическое возбуждение с тревожностью (ажитация).

Редко агрессия, спутанность сознания, депрессия, галлюцинации, бессонница.

Очень редко нервный тик.

Частота неизвестна: суицидальные мысли, ночные кошмары.

Со стороны нервной системы

Нечасто парестезии.

Редко судороги, двигательные расстройства.

Очень редко дисгевзия, синкопе, тремор, дистония, дискинезия.

Частота неизвестна: амнезия, нарушение памяти.

Со стороны органов зрения

Очень редко: нарушения аккомодации, нечеткость зрения, расстройства движений глазных яблок.

Со стороны сердца

Редко тахикардия.

Со стороны органов слуха и равновесия

Частота неизвестна: вертиго.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Нечасто диарея.

Со стороны пищеварительной системы

Редко: нарушение функции печени (повышение уровня трансаминаз, щелочной фосфатазы, гамма-глутамилтранспептидазы и билирубина).

Частота неизвестна: гепатит.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки

Нечасто: зуд, сыпь.

Редко: крапивница.

Очень редко ангионевротический отек, фиксированная лекарственная эритема.

Частота неизвестна: острый генерализованный экзантематозный пустулез.

После отмены цетиризина сообщалось о возникновении зуда и (или) крапивницы.

Со стороны костно-мышечной и соединительной ткани

Частота неизвестна: артралгия.

Со стороны почек и мочевыводящих путей

Очень редко дизурия, энурез.

Частота неизвестна: задержка мочи.

Со стороны питания и обмена веществ:

Частота неизвестна: повышенный аппетит.

Общие расстройства

Нечасто астения, недомогание.

Редко отек.

Частота неизвестна: повышение аппетита.

Результаты исследований

Редко: увеличение массы тела.

Сообщение о подозреваемых нежелательные реакции

Сообщение о подозреваемых нежелательные реакции после одобрения лекарственного средства разрешительными органами является важной процедурой. Это позволяет осуществлять мониторинг соотношения «польза / риск» применения лекарственного средства. Медицинские работники должны сообщать о любых подозреваемые нежелательные реакции через национальную систему фармаконадзора.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Не требует специальных условий хранения. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере, по 3 блистера в картонной коробке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

ООО «Зентива».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

В кабеловны 130, 102 37 Прага 10, Долни Мехолупы, Чешская Республика.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — Государственного реестра лекарственных средств Украины.