Состав

действующее вещество: cetirizine;

1 мл раствора (20 капель) содержит цетиризина дигидрохлорид 10 мг;

вспомогательные вещества: глицерин (85%); пропиленгликоль; натрия сахарин; метилпарабен
(Е 218) пропилпарабен (Е 216) натрия ацетат, тригидрат; кислота уксусная ледяная; вода очищенная.

Лекарственная форма

Капли оральные.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа

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

Фармакодинамика

Механизм действия.

Цетиризин, метаболит гидроксизина, является мощным селективным антагонистом периферических Н1-рецепторов. В исследованиях связывания с рецепторами in vitro не наблюдалось значительной родства с другими рецепторами, кроме Н1-рецепторов.

Фармакодинамические эффекты.

Кроме антагонистического воздействия на Н1-рецепторы, цетиризин оказывает противоаллергическое действие: в дозе 10 мг 1 или 2 раза в сутки препарат ингибировал позднюю фазу миграции клеток, участвующих в воспалительной реакции (преимущественно эозинофилов), в коже и конъюнктиве лиц с атопией , которым вводили антиген; в дозе 30 мг/сут ингибировал приток эозинофилов в бронхоальвеолярной жидкости в течение поздней фазы сужения бронхов, вызванного вдыханием аллергенов, у пациентов, больных бронхиальной астмой. Кроме того, цетиризин ингибировал позднюю фазу реакции воспаления, индуцированную внутрикожного введения калликреина, у пациентов с хронической крапивницей. Цетиризин также уменьшает выраженность адгезии

молекул, таких как ICAM-1 и VCAM-1, являются маркерами аллергического воспаления.

Клиническая эффективность и безопасность.

В дозах 5 мг и 10 мг цетиризин интенсивно ингибирует возникновение пузырьков и покраснение, вызванных очень высокими концентрациями гистамина в коже, хотя соотношение с эффективностью не установлено. Начало действия после разового приема дозы 10 мг наступает в пределах 20 минут в 50% лиц и в пределах 1 часа - у 95% человек. Действие продолжается как минимум 24 часа после разового приема.

Применение цетиризина пациентам с аллергическим ринитом и таким сопутствующим заболеванием, как бронхиальная астма (от легкой до умеренной по тяжести) в дозе 10 мг 1 раз в сутки улучшало состояние при симптомах ринита и не влияло на функцию легких, подтверждает безопасность применения цетиризина больным бронхиальной астмой легкой и средней степени тяжести.

Применение цетиризина в высокой дозе 60 мг в сутки в течение недели не вызывало статистически значимой пролонгации интервала QT.

При приеме в рекомендованных дозах цетиризин улучшал состояние пациентов с круглогодичным и сезонным аллергическим ринитом.

В возрасте от 5 до 12 лет толерантности к антигистаминного действия цетиризина (подавление возникновения пузырьков и покраснение) не наблюдалось. Если лечение цетиризином прекратить после повторного приема, реактивность кожи к гистамина восстанавливается в течение 3 суток.

Фармакокинетика

Цетиризин проявляет линейную кинетику при дозировке от 5 мг до 60 мг.

Абсорбция.

Равновесная максимальная концентрация цетиризина в плазме крови составляет почти 300 нг / мл и достигается в течение 1 ± 0,5 часа. Распределение фармакокинетических параметров, таких как максимальная концентрация в плазме крови (Cmax) и площадь под кривой (AUC), является однородным. Объем абсорбции цетиризина не уменьшался при одновременном приеме с пищей, хотя скорость абсорбции уменьшалась. Биодоступность подобная при применении цетиризина в форме раствора, капсул или таблеток.

Распределение.

Видимый объем распределения цетиризина составляет 0,5 л / кг. Связывание с белками плазмы крови - 93 ± 0,3%. Цетиризин не влияет на связывание варфарина с белками крови.

Метаболизм.

Цетиризин не претерпит экстенсивного метаболизма при первом прохождении.

Вывод.

Примерно 2/3 дозы цетиризина выводится в неизмененном виде с мочой. Конечный период полувыведения составляет примерно 10 часов. При применении в дозе 10 мг в течение 10 дней кумуляции цетиризина не наблюдалось.

Отдельные группы пациентов.

Пациенты с нарушением функции печени.

У пациентов с хроническими заболеваниями печени (гепатоцеллюлярный, холестатический и билиарный цирроз) после приема 10 мг или 20 мг цетиризина в виде разовой дозы наблюдалось увеличение периода полувыведения на 50% и снижение клиренса на 40% по сравнению со здоровыми добровольцами. Коррекция дозы пациентам с нарушением функции печени необходима лишь тогда, когда у таких пациентов является одновременно и нарушение функции почек.

Пациенты с нарушением функции почек.

Фармакокинетика цетиризина была подобной у пациентов с легкой степенью нарушения функции почек (клиренс креатинина 40 мл / мин) и у здоровых добровольцев. У пациентов с умеренной степенью нарушения функции почек наблюдалось увеличение периода полувыведения в 3 раза и снижение клиренса - на 70% по сравнению со здоровыми добровольцами. У пациентов, которым проводился гемодиализ (клиренс креатинина 7 мл / мин), после применения 10 мг цетиризина перорально наблюдалось увеличение периода полувыведения в 3 раза и снижение клиренса на 70% по сравнению со здоровыми добровольцами. Цетиризин плохо выводится при гемодиализе. Пациентам с нарушением функции почек средней степени необходимо корректировать дозы цетиризина. Применение препарата пациентам с тяжелой степенью нарушения функции почек противопоказано.

Пациенты пожилого возраста.

После разового приема цетиризина в дозе 10 мг период полувыведения у таких пациентов увеличивался почти на 50%, а клиренс снижался примерно на 40% по сравнению с младшими лицами. Снижение клиренса цетиризина было связано с ослабленной функцией почек.

Дети.

Период полувыведения цетиризина составил почти 6 часов в возрасте 6-12 лет и 5 часов у детей 2-6 лет. В возрасте от 6 до 24 месяцев этот показатель сокращен до 3,1 часа.

Показания

Симптоматическая терапия назальных и глазных симптомов сезонного и круглогодичного аллергического ринита, хронической идиопатической крапивницы.

Противопоказания

Гиперчувствительность к действующему веществу, другим компонентам препарата, к гидроксизином или к любым производным пиперазина в анамнезе тяжелые нарушения функции почек при КК менее 10 мл/мин.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

В исследованиях применения цетиризина с антипирином, псевдоэфедрина, циметидином, кетоконазолом, эритромицином, азитромицином фармакокинетических взаимодействий не наблюдалось.

При многократном применении теофиллина (400 мг 1 раз в сутки) и цетиризина наблюдалось незначительное (16%) снижение клиренса цетиризина, тогда как диспозиция теофиллина не повышалась при одновременном приеме цетиризина.

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

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

При многократном применении ритонавира (600 мг 2 раза в сутки) и цетиризина (10 мг в сутки) продолжительность экспозиции цетиризина увеличилась примерно на 40%, тогда как диспозиция ритонавира несколько снижалась (11%) при одновременном приеме цетиризина.

Нет данных по усилению эффекта седативных средств при применении цетиризина в терапевтических дозах. Но следует избегать применения седативных средств во время приема цетиризина.

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

Одновременный прием цетиризина с алкоголем или другими средствами, угнетающими центральную нервную систему, может вызвать дополнительное ухудшение внимания и нарушения работоспособности, хотя цетиризин не потенцирует эффект алкоголя (при уровнях алкоголя в крови 0,5 г/л).

Особенности применения

Антигистаминные средства, в том числе цетиризин, подавляют ответ на кожную аллергическую пробу, поэтому перед ее проведением прием препарата следует прекратить за 3 дня до исследования (период вывода).

Сообщалось о развитии зуда и/или крапивницы после отмены цетиризина, даже если ранее эти симптомы не наблюдались. В некоторых случаях они могут быть интенсивными, что требует восстановления приема цетиризина. Необходимость в восстановлении лечения зависит от возникших проявлений.

При применении цетиризина в терапевтических дозах не наблюдалось клинически значимых взаимодействий с алкоголем (при уровнях алкоголя в крови 0,5 г/л). Однако в случае одновременного применения следует соблюдать осторожность.

Препарат применять с осторожностью пациентам, склонным к задержке мочи (повреждение позвоночника, гиперплазия простаты), с эпилепсией, с риском возникновения судорог, с хронической почечной недостаточностью (требуется коррекция режима дозирования) и пациентам пожилого возраста с почечной недостаточностью (возможно снижение клубочковой фильтрации).

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

Объективное определение способности управлять автотранспортом, латентности сна и способности работать на сборочном конвейере не показало клинически значимого влияния цетиризина при применении в рекомендуемой дозе 10 мг.

Пациентам, которые управляют транспортными средствами или другими механизмами, не следует превышать рекомендованные дозы и следует учитывать реакцию собственного организма на препарат.

Пациентам, испытывающим сонливость, следует воздержаться от управления автотранспортом или другими механизмами.

В чувствительных пациентов одновременный прием препарата с другими средствами, угнетающими центральную нервную систему, может вызвать дополнительное ухудшение внимания.

Применение в период беременности или кормления грудью

Период беременности.

Клинические данные по применению цетиризина беременным очень ограниченными. Исследования на животных не указывают на прямое или косвенное вредное влияние на беременность, эмбриональное/фетальный развитие, роды или постнатальное развитие. В период беременности препарат следует применять с осторожностью, когда, по мнению врача, польза от применения для женщины 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 его применения. В период кормления грудью препарат следует применять с осторожностью.

Фертильность.

Доступные данные о влиянии на фертильность человека ограничены, однако негативного влияния на фертильность не выявлено.

Исследования на животных не выявили негативного влияния на фертильность.

Способ применения и дозы

Препарат предназначен для перорального применения.

Взрослые и дети старше 12 лет.

Препарат следует применять в дозе 10 мг (20 капель) 1 раз в сутки.

Дети в возрасте от 6 до 12 лет.

Препарат применять в дозе 5 мг (10 капель) 2 раза в сутки.

Дети в возрасте от 2 до 6 лет.

Препарат применять в дозе 2,5 мг (5 капель) 2 раза в сутки.

Детям с нарушением функции почек дозы корректировать индивидуально, в зависимости от значения клиренса креатинина пациента, возраста и массы тела.

Пациенты пожилого возраста.

При нормальной функции почек таким пациентам нет необходимости корректировать дозу.

Пациенты с нарушением функции печени.

Таким пациентам нет необходимости корректировать дозу.

Пациенты с нарушением функции почек.

Не существует подтвержденных документально данных о соотношении эффективность/безопасность для пациентов с нарушением функции почек. Поскольку цетиризин главным образом выводится почками, в случае если не может быть применено альтернативное лечение, дозировка должна быть индивидуальным, в зависимости от состояния функции почек. Следует обратиться к таблице, приведенной ниже, и откорректировать дозу согласно приведенной информации.

Состояние функции почек	**Клиренс креатинина (мл/мин)**	**Дозировка и частота**
Нормальная функция	≥ 80	10 мг 1 раз в сутки
Легкая степень нарушения	50–79	10 мг 1 раз в сутки
Умеренная степень нарушения	30–49	5 мг 1 раз в сутки
Тяжелая степень нарушения	< 30	5 мг 1 раз в 2 суток

Терминальная стадия почечной недостаточности - пациенты, которым проводят диализ	< 10	противопоказано

Препарат следует накрапывать в ложку или растворить в воде и принимать внутрь. Если применять разведения, следует учитывать, особенно при применении детям, объем воды, к которому прилагаются капли, должно соответствовать количеству жидкости, которое может проглотить пациент. Разбавленный раствор следует принять сразу.

Дети

Препарат применять детям в возрасте от 2 лет.

Передозировка

Симптомы.

Симптомы, наблюдавшиеся после существенного передозировки цетиризина, главным образом связанные с влиянием на центральную нервную систему или с эффектами, которые могут указывать на антихолинергическим действием. Побочные реакции, о которых сообщалось после приема дозы, превышающей минимум в 5 раз рекомендуемую суточную дозу, включают: спутанность сознания, диарея, головокружение, повышенную утомляемость, головная боль, недомогание, мидриаз, зуд, беспокойство, седацию, сонливость, ступор, тахикардия , тремор, задержку мочеиспускания.

Лечение.

При передозировке следует проводить симптоматическую и поддерживающую терапию. Можно провести промывание желудка. Диализ не является эффективным методом для вывода цетиризина. Специфический антидот цетиризина неизвестен.

Побочные реакции

Известно, что цетиризин при применении в рекомендованных дозах оказывает незначительное побочное влияние на центральную нервную систему, включающую сонливость, повышенную утомляемость, головокружение и головную боль. В некоторых случаях сообщалось о парадоксальной стимуляции центральной нервной системы.

Метилпарабен и пропилпарабен, входящие в состав препарата, могут вызывать развитие аллергических реакций, которые могут проявиться не сразу.

Хотя цетиризин является селективным антагонистом периферических H1-рецепторов и почти не оказывает антихолинергического действия, сообщалось о единичных случаях возникновения затруднение мочеиспускания, нарушение аккомодации глаза, сухости во рту.

Сообщалось о таких побочных реакциях, которые возникали во время исследований цетиризина, не менее чем у 1% пациентов:

со стороны психики - сонливость

со стороны нервной системы - головокружение, головная боль

со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения - фарингит;

со стороны пищеварительного тракта - боль в животе, сухость во рту, тошнота

общие нарушения - повышенная утомляемость.

Сообщалось о таких побочных реакциях, которые возникали во время исследований цетиризина, не менее чем у 1% детей в возрасте от 6 месяцев до 12 лет

со стороны психики - сонливость

со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения - ринит

со стороны пищеварительного тракта - диарея

общие нарушения - повышенная утомляемость.

При применении цетиризина также сообщалось о развитии нижеперечисленных побочных реакций. Побочные реакции указаны по классам систем органов, согласно MedDRA (Медицинский словарь терминов для регулятивной деятельности), и по частоте: очень часто (≥ 1/10); часто (≥ 1/100, <1/10); нечасто (≥ 1/1000, <1/100) редко (≥ 1/10000, <1/1000); очень редко (<1/10000); неизвестно (частоту нельзя определить по имеющимся данным).

Со стороны системы крови и лимфатической системы:

очень редко - тромбоцитопения.

Со стороны иммунной системы:

редко - реакции гиперчувствительности, очень редко - анафилактический шок.

Со стороны метаболизма и питания:

неизвестно - повышенный аппетит.

Со стороны психики:

нечасто - ажитация; редко - агрессивность, спутанность сознания, депрессия, галлюцинации, бессонница очень редко - тик; неизвестно - суицидальные мысли.

Со стороны нервной системы:

нечасто - парестезии; редко - судороги очень редко - дисгевзия, дискинезия, дистония, обмороки, тремор неизвестно - амнезия, нарушение памяти.

Со стороны органов зрения:

очень редко - нарушение аккомодации, нечеткость зрения, непроизвольные движения глазного яблока.

Со стороны органов слуха и равновесия:

неизвестно - вертиго.

Со стороны сердца:

редко - тахикардия.

Со стороны пищеварительного тракта:

нечасто - диарея.

Со стороны гепатобилиарного тракта

редко - нарушение функции печени (повышение уровня трансаминаз, щелочной фосфатазы, γ-глутамилтрансферазы и билирубина).

Со стороны кожи и подкожной клетчатки:

нечасто - зуд, сыпь, редко - крапивница очень редко - ангионевротический отек, местные медикаментозные высыпания.

Со стороны почек и мочевыводящей системы:

очень редко - дизурия, энурез; неизвестно - задержка мочи.

Общие нарушения:

нечасто - астения, недомогание; редко - отек.

Обследование

редко - увеличение массы тела.

После отмены цетиризина сообщалось о случаях интенсивного зуда и крапивницы.

Срок годности

3 года.

После вскрытия флакона использовать капли в течение 21 месяца.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 ° С в сухом и недоступном для детей месте.

Упаковка

По 20 мл в стеклянном флаконе с крышкой-капельницей, по 1 флакону в картонной коробке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

Уорлд Медицин Илач Сан.Ве Тидж А.Ш., Турция.

Источник инструкции

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