

Состав

действующее вещество: cetirizine;

1 таблетка содержит цетиризина дигидрохлорид 10 мг;

вспомогательные вещества: лактоза, целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный, натрия крахмала (тип А).

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства: круглые таблетки белого цвета с гладкой поверхностью и с насечкой с одной стороны.

Фармакотерапевтическая группа

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

Фармакодинамика

Цетиризин, метаболит гидроксизина, является мощным селективным антагонистом периферических H₁-рецепторов. В исследованиях связывания с рецепторами *in vitro* не наблюдалось значительной родства с другими рецепторами, кроме H₁-рецепторов.

Кроме антагонистического воздействия на H₁-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 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.

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 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 гистамину 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 $1 \pm 0,5$ часа. Распределение фармакокинетических параметров, таких как максимальная концентрация в плазме крови (C_{max}) 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 - $93 \pm 0,3\%$. 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 неизменном 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 проводили 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 гидроксизину 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, псевдоэфедрином, 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 псевдоэфедрином побочных фармакодинамических взаимодействий не наблюдалось.

В исследованиях применения цетиризина с антипирином, азитромицином, эритромицином, кетоконазолом, теофиллином и псевдоэфедрином побочных клинических взаимодействий не наблюдалось. Кроме того, одновременное применение цетиризина с макролидами или кетоконазолом не приводило к клинически значимым изменениям 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 препарата 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 необходимо прекратить за 3 суток 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).

Препарат содержит лактозу, поэтому пациентам с редкой наследственной непереносимостью галактозы, лактазной недостаточностью или нарушением всасывания глюкозы-галактозы не следует его применять.

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. Таблетки следует глотать, запивая 1 стаканом воды.

Взрослые и дети старше 12 лет.

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

Дети в возрасте от 6 до 12 лет.

Препарат следует применять в дозе 5 мг (½ таблетки) 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.

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

Дети

Применение препарата в форме таблеток не рекомендуется детям до 6 лет, поскольку эта лекарственная форма не позволяет проводить необходимую коррекцию режима дозирования.

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.

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 нижеприведенных побочных реакций. Побочные реакции указаны по классам систем органов согласно MedDRA (Медицинский словарь терминов для регулятивной деятельности), и по частоте: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$, $<1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, $<1/100$) редко ($\geq 1/10000$, $<1/1000$); 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 - агитация; 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, произвольные 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.

Условия хранения

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

Упаковка

По 10 таблеток в блистере, 2 блистера в картонной коробке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

ABC Farmaceutici S.p.A., Италия/ABC Farmaceutici S.p.A., Italy.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Виа Кантон Моретти, 29 (Локалита Сан Бернардо) - 10015 Ивреа (ТО), Италия /

Via Cantone Moretti, 29 (Localita San Bernardo) - 10015 Ivrea (TO), Italy.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).