

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ЦЕТРИН®

(CETRINE)

Склад:

діюча речовина: цетиризину гідрохлорид;

1 таблетка містить цетиризину гідрохлориду 10 мг;

допоміжні речовини: лактоза, моногідрат; крохмаль кукурудзяний; повідон; магнію стеарат; гіпромелоза; поліетиленгліколі; титану діоксид (Е 171); тальк; кислота сорбінова; полісорбати; диметикон.

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: круглі двоопуклі таблетки, вкриті плівковою оболонкою, білого кольору, з розподільчою рискою з одного боку та гладенькі з іншого боку.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні засоби для системного застосування. Похідні піперазину. Код АТХ R06A E07.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Цетиризин – конкурентний антагоніст гістаміну, метаболіт гідроксизину, блокує H_1 -гістамінові рецептори. Попереджає розвиток та полегшує перебіг алергічних реакцій, має протисвербіжні та протиексудативні властивості, гальмує розвиток опосередкованої гістаміном ранньої фази алергічної реакції, обмежує вивільнення медіаторів запалення на пізній стадії алергічної реакції, зменшує міграцію еозинофілів, нейтрофілів та базофілів, зменшує проникнення капілярів, попереджає розвиток набряку тканини, знімає спазм гладкої мускулатури. Усуває шкірну реакцію на введення гістаміну, специфічних алергенів, а також на охолодження (при холодovій кропив'янці), зменшує гістаміноіндуковану бронхоконстрикцію при бронхіальній астмі легкого перебігу. Майже не чинить антихолінергічної та антисеротонінової дії. У терапевтичних дозах майже не виявляє седативного ефекту. Початок дії після разового прийому дози 10 мг цетиризину настає у межах 20 хвилин у 50 % осіб та у межах 1 години – у 95 % осіб. Дія триває як мінімум 24 години після разового прийому. При курсовій терапії толерантність до антигістамінної дії цетиризину не розвивається. Після припинення лікування дія зберігається до 3 діб.

Фармакокінетика.

Швидко всмоктується з травного тракту, період досягнення максимальної концентрації після прийому внутрішньо становить приблизно 1 годину. Біодоступність цетиризину при прийомі у вигляді таблеток та сиропу однакова. Їжа не впливає на повноту всмоктування, але подовжує на 1 годину період досягнення максимальної концентрації та знижує величину максимальної концентрації на 23 %. Зв'язування з білками плазми – 93 %. У незначних кількостях метаболізується в печінці шляхом О-дезалкілювання з утворенням фармакологічно неактивного метаболіту (на відміну від інших блокаторів H_1 -гістамінових рецепторів, які метаболізуються в печінці за участю системи цитохрому P450). Не акумулює, 2/3 препарату виводиться у незміненому вигляді нирками та приблизно 10 % – із фекаліями. Системний кліренс – 53 мл/хв.

Період напіввиведення у дорослих становить 7-10 годин, у дітей 6-12 років – 6 годин, 2-6 років – 5 годин.

Пацієнти з порушеннями функції нирок

Фармакокінетика лікарського засобу при легких порушеннях функції нирок (кліренс креатиніну нижче 40 мл/хв) була схожа з такою у здорових добровольців. У пацієнтів із помірними розладами функції нирок період напіввиведення був утричі довшим, а кліренс – на 70 % нижчим, ніж у здорових добровольців.

У пацієнтів, які перебувають на гемодіалізі (кліренс креатиніну нижче 7 мл/хв), при застосуванні цетиризину в разовій дозі 10 мг період напіввиведення був утричі довшим, а кліренс – на 70 % нижчим, ніж у здорових добровольців. При гемодіалізі цетиризин видаляється з плазми незначною мірою. Пацієнтам із помірними або тяжкими розладами функції нирок необхідна корекція дозування.

Клінічні характеристики.

Показання.

Назальні симптоми сезонного та хронічного алергічного риніту (ринорея, свербіж у носі, чхання), неназальні симптоми, пов'язані з кон'юнктивітом. Свербіж, кропив'янка різних типів, включаючи хронічну ідіопатичну кропив'янку.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до цетиризину, до будь-яких допоміжних речовин препарату, до гідроксизину або будь-яких похідних піперазину в анамнезі. Тяжке порушення функції нирок при кліренсі креатиніну менше 10 мл/хв.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Було проведено вивчення взаємодії цетиризину з псевдоефедриним, циметидином, антипірином, кетоконазолом, еритроміцином, азитроміцином. Вивчення не підтвердило фармакокінетичної взаємодії цих засобів з цетиризином. При сумісному прийомі з теофіліном

зменшується кліренс цетиризину, що може призвести до накопичення та передозування цетиризину. Немає даних щодо посилення ефекту седативних засобів при застосуванні цетиризину у терапевтичних дозах. Але слід уникати застосування седативних засобів під час прийому цетиризину. Об'єм абсорбції цетиризину не знижується при прийомі їжі, хоча показник абсорбції зменшується на 1 годину. Алкоголь та/або депресанти центральної нервової системи (ЦНС) при сумісному застосуванні з цетиризином можуть викликати додаткове погіршення уваги та порушення працездатності, хоча цетиризин не потенціює ефект алкоголю (при рівнях алкоголю у крові 0,5 г/л).

Особливості застосування.

Цетрин® екскретується нирками, тому при нирковій недостатності слід зменшити дозу до 5 мг на добу. Пацієнтам літнього віку за умови нормальної функції нирок коригувати дозу не потрібно. При прийомі у терапевтичних дозах не спостерігалось клінічно значущих взаємодій з алкоголем (при рівнях алкоголю у крові 0,5 г/л). Проте рекомендується уникати одночасного застосування препарату із вживанням алкоголю. Рекомендується з обережністю призначати препарат пацієнтам з епілепсією та пацієнтам із ризиком виникнення судом, не застосовувати пацієнтам зі спадковою непереносимістю галактози, при дефіциті лактази Лаппа або порушенні мальабсорбції глюкози-галактози.

Препарат містить лактозу, моногідрат. Якщо у Вас встановлено непереносимість деяких цукрів, проконсультуйтеся з лікарем, перш ніж приймати цей лікарський засіб.

З обережністю застосовувати пацієнтам, схильним до затримки сечі (пошкодження хребта, гіперплазія простати), тому що цетиризин може підвищити ризик розвитку затримки сечі.

Антигістамінні препарати пригнічують шкірну алергічну пробу, тому перед її проведенням прийом препарату необхідно припинити за 3 дні до дослідження (період виведення).

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність. Недостатньо даних щодо застосування препарату у період вагітності. Дослідження на тваринах не вказують на прямий або непрямий шкідливий вплив на вагітність, ембріональний/фетальний розвиток, пологи або постнатальний розвиток. Тому препарат вагітним жінкам призначають лише тоді, коли, на думку лікаря, користь від застосування переважає потенційний ризик для плода.

Період годування груддю. Цетиризин проникає у грудне молоко у концентраціях, що становлять 25 – 90 % від концентрацій у плазмі крові залежно від часу, який пройшов після застосування препарату. Тому з обережністю слід призначати препарат жінкам, які годують груддю.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами. Особам, які керують транспортними засобами або працюють зі складними механізмами, слід з обережністю застосовувати препарат, враховуючи реакцію власного організму (див. розділ «Побічні реакції»). Не слід перевищувати терапевтичну дозу.

Одночасний прийом препарату з іншими засобами, що пригнічують ЦНС, може спричинити додаткове погіршення уваги та порушення працездатності.

Спосіб застосування та дози. Застосовувати внутрішньо, незалежно від прийому їжі, запиваючи достатньою кількістю рідини (1 склянка).

Діти віком від 6 до 12 років: по 5 мг (половина таблетки) двічі на добу.

Дорослі та діти від 12 років: 10 мг (1 таблетка) 1 раз на добу.

Пацієнтам літнього віку за умови нормальної функції нирок корекція дози не потрібна.

Пацієнтам, які страждають на порушення функції нирок, дозу потрібно коригувати на індивідуальній основі з урахуванням кліренсу нирок, віку та маси тіла.

Пацієнти з помірними або тяжкими розладами функції нирок

Немає даних про співвідношення користь/ризик для пацієнтів із розладами функції нирок. Оскільки цетиризин виводиться головним чином нирками, якщо неможливе застосування альтернативного лікування, проміжки між прийомами препарату слід визначати індивідуально, залежно від функції нирок.

Дозування дорослим пацієнтам залежно від функції нирок представлено у таблиці 1.

Щоб скористатися таблицею, потрібно визначити кліренс креатиніну ($Cl_{кр}$), мл/хв. $Cl_{кр}$ (мл/хв) можна розрахувати на основі концентрації креатиніну в сироватці крові (мг/дл) за формулою:

[
]
жінок
для
дл
мг
крові
сироватки
креатинін
кг
тіла
маса

у роках
вік
 Cl
 $кр$
85
,
0
)
(
72

)
(
)
(
140
,
,
,
-
=

таблиця 1

Корекція дозування для дорослих пацієнтів залежно від функції нирок:

Функція нирок	Кліренс креатиніну (мл/хв)	Дозування та частота
Нормальна	≥ 80	10 мг 1 раз на добу
Легкий ступінь порушення	50-79	10 мг 1 раз на добу
Помірний ступінь порушення	30-49	5 мг 1 раз на добу
Тяжкий ступінь порушення	< 30	5 мг 1 раз на 2 доби
Термінальна стадія хвороби нирок – пацієнти, яким проводять діаліз	< 10	протипоказано

Дітям із порушеннями функції нирок дозування коригують індивідуально, залежно від значення кліренсу креатиніну та маси тіла.

Пацієнтам із порушеннями функції печінки (за умови нормальної функції нирок) корекція дози не потрібна.

Пацієнтам із порушеннями функції печінки та нирок дозу коригують (див. таблицю 1).

Тривалість лікування визначає лікар залежно від перебігу захворювання.

Діти. Цетиризин у вигляді таблеток не призначають при лікуванні дітей віком до 6 років, оскільки дана лікарська форма унеможливило необхідне коригування дози.

Передозування.

Передозування цетиризину головним чином пов'язано з впливом на ЦНС або з ефектами, що можуть вказувати на антихолінергічну дію. Побічні ефекти, про які повідомлялося після прийому дози, яка перевищувала щонайменше у 5 разів рекомендовану добову дозу, включають: сплутаність свідомості, діарею, запаморочення, втомлюваність, головний біль,

нездужання, мідріаз, свербіж, неспокій, седативний ефект, сонливість, ступор, тахікардію, тремор та затримку сечовипускання.

На початковій стадії слід викликати блювання у пацієнта. Антидоту не виявлено. Рекомендовано промивання шлунка, призначення активованого вугілля та проносних засобів. Діаліз не ефективний. У тяжких випадках слід ретельно контролювати функції серцево-судинної та дихальної систем.

Побічні реакції.

Цетрин® у рекомендованих дозах в основному добре переноситься пацієнтами.

Відомо, що цетиризин у звичайних дозах (10 мг на добу) може спричинити небажані реакції з боку ЦНС, сонливість, підвищену втомлюваність, головний біль і запаморочення. Вони є слабо виражені та мають тимчасовий характер.

У деяких випадках спостерігається парадоксальне збудження ЦНС.

Хоча цетиризин є селективним антагоністом H_1 -рецепторів і майже позбавлений холінолітичної активності, відмічалися окремі випадки уповільненого сечовипускання, порушення акомодатії ока і сухість слизової оболонки порожнини рота. Також спостерігається порушення функції печінки: підвищення активності печінкових ферментів і збільшення концентрації білірубину. У більшості випадків ці симптоми зникали після припинення прийому цетиризину.

Клінічні дослідження

У результаті клінічних досліджень порівняння цетиризину в дозі 10 мг та інших антигістамінних препаратів у рекомендованих дозах, спостерігалися незначні небажані реакції з боку центральної та периферичної нервової системи (запаморочення, головний біль); з боку шлунково-кишкового тракту (біль у животі, сухість у роті, нудота); з боку дихальної системи (фарингіт); загальні розлади (підвищена втомлюваність) та розлади з боку психіки (сонливість). Відомо, що при дослідженні сонливість (розлади з боку психіки) спостерігалася частіше, але у більшості випадків відрізнялася легким або помірним ступенем прояву.

Об'єктивні тести, як продемонстровано в інших дослідженнях, довели, що при застосуванні препарату в рекомендованих добових дозах у здорових молодих добровольців повсякденна активність не порушувалася.

Існують дані, що серед дітей віком від 6 місяців до 12 років, які були включені в контрольовані клінічні чи фармакоклінічні дослідження, небажані реакції, що відзначалися з боку шлунково-кишкового тракту (діарея), з боку дихальної системи (риніт) були незначними.

Досвід післяреєстраційного застосування

Крім побічних реакцій, які було зафіксовано під час клінічних досліджень та які наведено вище, впродовж післяреєстраційного застосування зафіксовано поодинокі випадки нижчезазначених небажаних реакцій на цетиризин. Дані побічні реакції, про які повідомлялося рідше, оцінювалися за частотою виникнення: нечасто ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$); рідко ($\geq 1/10000$ до $< 1/1000$); дуже рідко ($< 1/10000$) або невідомо (неможливо встановити з наявних даних).

З боку крові та лімфатичної системи

Дуже рідко: тромбоцитопенія.

З боку імунної системи

Рідко: гіперчутливість.

Дуже рідко: анафілактичний шок.

З боку харчування та обміну речовин

Частота невідома – підвищений апетит.

З боку психіки

Нечасто: психічне збудження з тривожністю (ажитація).

Рідко: агресія, сплутаність свідомості, депресія, галюцинації, безсоння.

Дуже рідко: нервовий тик.

Частота невідома: суїцидальні думки.

З боку нервової системи

Нечасто: парестезії.

Рідко: судоми, рухові розлади.

Дуже рідко: дисгевзія, синкопе, тремор, дистонія, дискінезія.

Частота невідома: амнезія, порушення пам'яті.

З боку органів зору та рівноваги

Частота невідома: вертиго.

З боку серця

Рідко: тахікардія.

З боку шлунково-кишкового тракту

Нечасто: діарея.

З боку гепатобіліарної системи

Рідко: порушення функції печінки (підвищення рівня трансаміназ, лужної фосфатази, γ-глутамілтрансферази та білірубіну).

З боку шкіри та підшкірної клітковини

Нечасто: свербіж, висипання.

Рідко: кропив'янка.

Дуже рідко: ангіоневротичний набряк, фіксована медикаментозна еритема.

З боку нирок та сечовивідних шляхів

Дуже рідко: дизурія, енурез.

Частота невідома: затримка сечі.

Загальні розлади

Нечасто: астенія, нездужання.

Рідко: набряки.

Зміни результатів лабораторних та інструментальних досліджень

Рідко: збільшення маси тіла.

Термін придатності. 3 роки.

Не застосовувати після закінчення терміну придатності, зазначеного на упаковці.

Умови зберігання. Зберігати у сухому, темному, недоступному для дітей місці при температурі до 25 °C

Упаковка. По 10 таблеток у блістері, по 2 або 3 блістери у картонній коробці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Виробник.

Д-р Редді'с Лабораторіс Лтд, ФТО – II

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Дільниця № 42р, 43, 44р, 45р, 46р, 53, 54, 83, с. Бачупалі, Бачупалі Мандал, округ Медчал
Малкайгірі – 500090, штат Телангана, Індія

Повідомити про побічну реакцію або відсутність ефективності при застосуванні лікарського засобу Ви можете за телефонами:

380 44 207 51 97 або 380 50 414 39 39; а також за електронною адресою:

DrugSafetyUa@drreddys.com (цілодобово).