

Состав

действующее вещество: цетиризин;

1 таблетка содержит цетиризина дигидрохлорид 10 мг;

вспомогательные вещества: лактоза, целлюлоза микрокристаллическая, натрия кроскармеллоза, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат

оболочка (Opadry Y-1-7000) титана диоксид (E 171),
гидроксипропилметилцеллюлоза, полиэтиленгликоль 400.

Лекарственная форма

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой.

Основные физико-химические свойства: круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, от белого до почти белого цвета, с линией для деления с одной стороны.

Фармакотерапевтическая группа

Антигистаминные средства для системного применения. Код АТХ R06A E07.

Фармакодинамика

Цетиризин, метаболит гидроксизина у человека, является мощным селективным антагонистом периферических H₁-рецепторов. В исследованиях связывания с рецепторами *in vitro* не наблюдалось родства с другими рецепторами, отличными от H₁-рецепторов. Кроме антагонистического воздействия на H₁-рецепторы, цетиризин оказывает противоаллергическое действие: при дозировке 10 мг 1 или 2 раза в сутки препарат ингибирует позднюю фазу вовлечения в процесс клеток воспаления, особенно эозинофилов, в коже и конъюнктиве лиц, которым вводили антиген, а в дозе 30 мг/сут ингибирует приток эозинофилов в бронхоальвеолярной жидкости в течение поздней фазы сужения бронхов, вызванного вдыханием аллергенов у пациентов с астмой. Кроме того, цетиризин ингибирует позднюю фазу реакции воспаления, индуцированную у пациентов с хронической крапивницей внутрикожного введения калликрейна. Также уменьшает выраженность адгезии молекул, таких как ICAM-1 и VCAM-1, являются маркерами аллергического воспаления.

Фармакокинетика

Цетиризин не претерпит экстенсивного метаболизма при первом прохождении. Примерно 2/3 дозы выводится в неизмененном виде с мочой. Объем абсорбции цетиризина не уменьшался при одновременном приеме с пищей, хотя скорость абсорбции уменьшалась. Объем биодоступности подобный при назначении цетиризина в форме раствора, капсул или таблеток.

Показания

Симптоматическая терапия сезонного и постоянного аллергического ринита (таких симптомов как ринорея, зуд в носу, чихание), а также неназальные симптомов, связанных с конъюнктивитом. Зуд и крапивница различных типов, включая хроническую идиопатическую крапивницу.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к цетиризину или другим компонентам препарата, а также к гидроксизинам и к любым производных пиперазина в анамнезе.

Пациенты с тяжелым нарушением функции почек при КК менее 10 мл/мин.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Исходя из фармакокинетики, фармакодинамики и показателей толерантности цетиризина, возникновения любых видов взаимодействий при приеме этого антигистаминного средства маловероятно. В частности исследования взаимодействия лекарственных средств не показали ни фармакодинамического, ни какой-либо существенной фармакокинетического взаимодействия при одновременном приеме с псевдоэфедрина или теofilлином (400 мг/сут).

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

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

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

седативных средств во время приема цетиризина.

Уровень абсорбции цетиризина не снижается при употреблении пищи, хотя скорость абсорбции уменьшается.

Особенности применения

При приеме в терапевтических дозах не было отмечено клинически значимых взаимодействий с алкоголем (с уровнем алкоголя в крови 0,5 г/л). Однако следует с осторожностью применять этот препарат при одновременном употреблении алкоголя.

Рекомендуется с осторожностью назначать пациентам, страдающим эпилепсией и в которых могут возникать судороги.

Прием антигистаминных препаратов может влиять на результаты кожных тестов на определение аллергии, поэтому перед их проведением нужно выдержать период вывода таких препаратов из организма (3 суток).

Не следует применять этот препарат пациентам с такими редкими наследственными заболеваниями как непереносимость галактозы, дефицит лактазы Лаппа или нарушением всасывания глюкозы-галактозы.

Следует соблюдать осторожность при применении препарата пациентам со склонностью к задержке мочи (например, при поражениях спинного мозга, гиперплазии предстательной железы), цетиризин может увеличивать риск задержки мочи.

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 возобновления лечения после его прекращения. Эти симптомы обычно исчезают после возобновления лечения.

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

Объективное определение способности управлять автотранспортом, работать с механизмами и степени сонливости не показали ни одного клинически значимого влияния при применении препарата в рекомендуемой дозе 10 мг.

Пациенты, которые управляют автотранспортом, задействованные на потенциально опасных работах или обслуживают механизированное оборудование, не должны превышать рекомендованные дозы и должны

учитывать реакцию собственного организма на препарат.

В чувствительных пациентов одновременный прием препарата с алкоголем или другими средствами, угнетающими ЦНС, может вызвать дополнительное ухудшение внимания при выполнении потенциально опасных работ.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность. Недостаточно данных о применении препарата в период беременности. Исследования на животных не указывают на прямое или косвенное вредное влияние на беременность, эмбриональное/фетальный развитие, роды или постнатальное развитие. Следует назначать беременным женщинам в случаях, когда 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 женщинам, которые кормят грудью, цетиризин следует применять с осторожностью.

Способ применения и дозы

Применять внутрь, запивая 1 стаканом жидкости. Прием пищи не влияет на объем всасывания цетиризина, хотя несколько замедляет этот процесс.

Взрослые и дети старше 6 лет: 10 мг (1 таблетка) 1 раз в сутки. Можно применять препарат в начальной дозе 5 мг, если ее достаточно для контроля симптомов.

Курс лечения определяется врачом, зависит от течения и продолжительности заболевания и индивидуальной чувствительности пациента.

Пациенты пожилого возраста.

Нет необходимости снижать дозу для пациентов пожилого возраста при отсутствии у них нарушений функции почек.

Пациенты с нарушением функции почек (умеренной и тяжелой степени).

Дозировка должна быть индивидуальным, в зависимости от состояния функции почек. Следует обратиться к таблице 1 и откорректировать дозу согласно приведенной информации. Чтобы воспользоваться таблицей 1, необходимо определить клиренс креатинина (КК) пациента в мл/мин. Значение УК (мл/мин)

можно определить по креатинина сыворотки крови (мг/дл) с помощью формулы:

$$[140 - \text{возраст (в годах)}] \times \text{масса тела (кг)}$$

$$\text{КК} = \frac{\text{результат формулы}}{72 \times \text{креатинин в сыворотке крови (мг/дл)}} \quad (\times 0,85 \text{ для женщин})$$

$$72 \times \text{креатинин в сыворотке крови (мг/дл)}$$

$$(\times 0,85 \text{ для женщин})$$

Таблица 1. Коррекция дозы для взрослых пациентов с нарушением функции почек

Група	Кліренс креатиніну (мл/хв)	Дозування та частота
Нормальна функція	≥ 80	10 мг 1 раз на добу
Легка стадія порушення	50-79	10 мг 1 раз на добу
Помірна стадія	30-49	5 мг 1 раз на добу
Тяжка стадія	< 30	5 мг 1 раз на 2 дні
Термінальна стадія хвороби нирок – пацієнти, яким проводять діаліз	< 10	Протипоказано

Детям с нарушением функции почек дозы корректируется индивидуально, в зависимости от значения УК пациента и массы тела.

Пациенты с нарушением функции печени.

Нет необходимости в коррекции дозы при нарушении только функции печени.

Пациенты с нарушениями функции печени и почек.

Рекомендуется корректировать дозу (см. выше раздел «Пациенты с нарушением функции почек»).

Дети

Препарат применять детям в возрасте от 6 лет.

Передозировка

Симптомы. Симптомы, наблюдавшиеся после передозировки цетиризина, главным образом связанные с влиянием на ЦНС или с эффектами, которые могут указывать на антихолинергическим действием. Побочные эффекты, о которых

сообщалось после приема дозы, превышала 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. Специфический антидот цетиризина неизвестен. При передозировке рекомендуется симптоматическая и поддерживающая терапия. Промывание желудка следует проводить как можно быстрее после приема препарата. Цетиризин неэффективно выводится при проведении диализа.

Побочные реакции

Клинические исследования показали, что цетиризин при применении в рекомендованных дозах оказывает незначительное побочное влияние на ЦНС, включая сонливость, повышенную утомляемость, головокружение и головную боль. В некоторых случаях сообщалось о парадоксальной стимуляции ЦНС.

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 случаях нарушения функции печени, которые характеризовались повышенными уровнями ферментов печени, сопровождающиеся повышенным уровнем билирубина. Обычно состояние нормализовалось после прекращения приема препарата.

Клинические исследования

Существуют данные о безопасности применения цетиризина в более чем 3200 испытуемых, участвовавших в двойных слепых контролируемых исследованиях с целью сравнения цетиризина с плацебо или другими антигистаминными препаратами в рекомендуемой дозе (10 мг цетиризина ежедневно).

Подытожив эти данные, по результатам плацебо-контролируемых исследований сообщали о появлении побочных действий при применении цетиризина 10 мг с частотой возникновения 1,0% или более (таблица 2).

Таблица 2

Побочное действие (Терминология побочных действий ВОЗ)	Цетиризин (n = 3260)	Плацебо (n = 3061)
<i>Организм в целом - общие нарушения</i> утомляемость	1,63 %	0,95 %
<i>Со стороны центральной и периферической нервной системы</i> головокружение Головная боль	1,10 % 7,42 %	0,98 % 8,07 %
<i>Со стороны желудочно-кишечного тракта</i> Боль в желудке Сухость во рту тошнота	0,98 % 2,09 % 1,07 %	1,08 % 0,82 % 1,14 %
<i>Со стороны психики</i> сонливость	9,63 %	5,00 %
<i>Со стороны дыхательных путей</i> фарингит	1,29 %	1,34

Хотя с точки зрения статистики сонливость возникала чаще, чем в группе плацебо, в большинстве случаев она была легкой или умеренной степени. Как и во время проведения других исследований, результаты объективных исследований подтвердили, что прием рекомендованной суточной дозы не вызывает негативного влияния на повседневную деятельность у здоровых испытуемых.

Таблица 3. Нежелательные реакции с частотой возникновения 1% и более в возрасте от 6 месяцев до 12 лет при проведении плацебо-контролируемых клинических исследований

Побочное действие (Терминология побочных действий ВОЗ)	Цетиризин (n = 1656)	Плацебо (n = 1294)
<i>Со стороны желудочно-кишечного тракта</i> диарея	1,0 %	0,6 %
<i>Со стороны психики</i> сонливость	1,8 %	1,4 %
<i>Со стороны дыхательных путей</i> ринит	1,4 %	1,1 %
<i>Организм в целом - общие нарушения</i> утомляемость	1,0 %	0,3 %

Наблюдение после вывода препарата на рынок

Кроме побочных действий, о которых сообщали в рамках проведения клинических исследований и приведенные выше, после вывода препарата на рынок сообщали о побочных действиях, приведены ниже.

Побочные действия, о которых сообщали после вывода препарата на рынок, приведенные в соответствии с классификацией по классам систем органов (система MedDRA) и частоты.

Данные о частоте возникновения определены следующим образом: нечасто ($\geq 1/1000$ и $<1/100$), редко ($\geq 1/10000$ и $<1/1000$), очень редко ($<1/10000$), частота неизвестна (частоту нельзя определить на основе существующих данных).

Со стороны системы крови и лимфатической системы

Очень редко тромбоцитопения.

Со стороны иммунной системы

Редко гиперчувствительность.

Очень редко анафилактический шок.

Со стороны метаболизма и питания

Частота неизвестна: повышенный аппетит.

Со стороны психики

Нечасто ажитация.

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

Очень редко нервный тик.

Частота неизвестна: суицидальные мысли.

Со стороны нервной системы

Нечасто парестезии.

Редко судороги.

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

Частота неизвестна: амнезия, нарушение памяти.

Со стороны органов зрения

Очень редко: нарушение аккомодации глаза, нечеткость зрения, непроизвольные движения глазного яблока.

Со стороны органов слуха

Частота неизвестна: вертиго.

Со стороны сердца

Редко тахикардия.

Со стороны желудочно-кишечного тракта

Нечасто диарея.

Со стороны пищеварительной системы

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

Со стороны кожи и подкожной клетчатки

Нечасто: зуд, сыпь.

Редко: крапивница.

Очень редко ангионевротический отек, стойка медикаментозная эритема.

Частота неизвестна: острый генерализованный экзантематозный пустулез.

Со стороны мочевыделительной системы

Очень редко дизурия, энурез.

Частота неизвестна: задержка мочеиспускания.

Общие нарушения и нарушения, связанные со способом применения препарата

Нечасто астения, недомогание.

Редко отек.

Лабораторные исследования

Редко: увеличение массы тела.

Описание отдельных побочных реакций

Сообщалось о зуд (сильный зуд) и/или крапивницу после отмены цетиризина.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Специальные условия хранения не предусмотрены. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 7 таблеток в блистере, по 1 блистеру в коробке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

Меркле ГмбХ.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Людвиг-Меркле-Штрассе 3, 89143 Блаубойрен, Германия.

Источник инструкции

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