

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Цетиризин Гексал

МИНЗДРАВ РОССИИ
№-000065-251213
СОГЛАСОВАНО

Регистрационный номер:

Торговое наименование препарата: Цетиризин Гексал.

Международное непатентованное название: цетиризин.

Лекарственная форма: таблетки, покрытые оболочкой.

Состав:

1 таблетка, покрытая оболочкой, содержит:

Ядро: действующее вещество: цетиризина дигидрохлорид – 10,0 мг;

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат – 80,0 мг;

микрокристаллическая целлюлоза – 23,8 мг; кремния диоксид коллоидный –

0,6 мг; магния стеарат – 0,6 мг; *состав оболочки*: белый краситель опадрий –

5,0 мг, состоящий из: лактозы моногидрата – 1,8 мг; титана диоксида – 1,3

мг; гипромеллозы – 1,4 мг; макрогола 4000 (полиэтиленоксида 4000) – 0,5 мг.

Описание: белые или почти белые продолговатые таблетки с насечкой на одной стороне.

Фармакотерапевтическая группа:

Противоаллергическое средство - H₁-гистаминовых рецепторов блокатор.

Код АТХ: R06AE07.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Цетиризин Гексал - конкурентный антагонист гистамина и метаболит гидроксизина. Блокирует H₁-гистаминовые рецепторы и практически не оказывает антихолинэргического и антисеротонинового действия. Обладает выраженным противоаллергическим действием, предупреждает развитие и

облегчает течение аллергических реакций. Обладает противозудным и противозксудативным эффектами. Влияет на раннюю стадию аллергических реакций, а также уменьшает миграцию клеток воспаления; угнетает выделение медиаторов, участвующих в поздней аллергической реакции. Уменьшает проницаемость капилляров, предупреждает развитие отека тканей, снимает спазм гладкой мускулатуры. Устраняет кожную реакцию на введение гистамина, специфических аллергенов, а также на охлаждение (при холодовой крапивнице). Цетиризин значительно понижает гиперреактивность бронхиального дерева, возникающего в ответ на высвобождение гистамина у пациентов с бронхиальной астмой.

В терапевтических дозах практически не оказывает седативного эффекта. Терапевтический эффект препарата проявляется в среднем через 60 мин после приема. На фоне курсового приема толерантность не развивается.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь цетиризин быстро и полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ). Максимальная концентрация ($C_{\max}$) определяется примерно через 40 – 60 мин.

Прием пищи не оказывает существенного влияния на величину абсорбции, однако в этом случае скорость всасывания незначительно снижается.

Распределение

Цетиризин связывается с белками плазмы крови примерно на 93 %. Величина объема распределения (V_d) низкая (0,5 л/кг), препарат внутрь клетки не проникает. Препарат не проникает через гематоэнцефалический барьер.

Метаболизм

Цетиризин в небольшом количестве метаболизируется в печени с образованием неактивного метаболита.

При 10-дневном применении в дозе 10 мг накопления препарата не наблюдается.

Выведение

Примерно 70 % выводится почками в основном в неизмененном виде.

Величина системного клиренса составляет около 54 мл/мин.

После однократного приема разовой дозы величина периода полувыведения ($T_{1/2}$) составляет около 10 ч.

У детей в возрасте от 2 до 12 лет величина $T_{1/2}$ снижается до 5 – 6 ч.

При нарушении функции почек (клиренс креатинина ниже 11 – 31 мл/мин) и у пациентов, находящихся на гемодиализе (клиренс креатинина менее 7 мл/мин) величина $T_{1/2}$ увеличивается в 3 раза, клиренс уменьшается на 70 %.

У пациентов с циррозом печени, получавших 10 или 20 мг цетиризина в качестве однократной дозы, отмечалось увеличение $T_{1/2}$ на 50 % и снижение клиренса на 40 % по сравнению со здоровыми людьми. Изменение дозы необходимо только тем пациентам с заболеваниями печени, у которых имеются сопутствующие нарушения функции почек.

На фоне хронических заболеваний и у пожилых пациентов отмечается увеличение величины $T_{1/2}$ на 50 % и уменьшение клиренса на 40 %.

Гемодиализ неэффективен.

Показания к применению

- круглогодичный и сезонный аллергический ринит (лечение симптомов: зуд, чиханье, ринорея, слезотечение);
- крапивница, в т.ч. хроническая идиопатическая;
- другие аллергические дерматозы, сопровождающиеся зудом, в том числе атопический дерматит;
- аллергический конъюнктивит (лечение симптомов: слезотечение, гиперемия конъюнктивы).

Противопоказания

- повышенная чувствительность по отношению к цетиризину, другим производным пипразина или другим компонентам препарата;

- терминальная стадия почечной недостаточности (клиренс креатинина менее 10 мл/мин);
- дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- детский возраст до 6 лет;
- беременность, период лактации.

С осторожностью

Хроническая почечная недостаточность средней и тяжелой степени тяжести (при клиренсе креатинина (КК) более 10 мл/мин требуется коррекция режима дозирования), пожилой возраст (возможно снижение клубочковой фильтрации), эпилепсия и пациенты с повышенной судорожной готовностью, пациенты с предрасполагающими факторами к задержке мочи.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Данные о клиническом применении цетиризина у беременных женщин отсутствуют, поэтому не следует применять цетиризин при беременности.

Цетиризин секретируется в грудное молоко, поэтому в период применения препарата грудное вскармливание необходимо прекратить.

Способ применения и дозы

Внутрь, независимо от приема пищи, не разжевывая и запивая достаточным количеством жидкости, предпочтительно вечером.

Дети от 6 до 12 лет:

- при массе тела менее 30 кг: по ½ таблетки, покрытой оболочкой, вечером;
- при массе тела более 30 кг: по 1 таблетке, покрытой оболочкой, вечером.

Возможен прием 2 раза в день (утром и вечером) по ½ таблетки.

Взрослым и подросткам старше 12 лет рекомендуется принимать по 1 таблетке цетиризина, предпочтительно вечером.

Пациентам с почечной недостаточностью дозу следует корректировать в зависимости от величины клиренса креатинина (КК). Клиренс креатинина можно рассчитать из концентрации сывороточного креатинина по следующим формулам:

для мужчин: КК (мл/мин) = $[140 - \text{возраст (полных лет)}] \times \text{масса тела (кг)} / 72 \times \text{концентрация креатинина в плазме крови (мг/дл)}$;

для женщин: КК мужчин $\times 0,85$.

Взрослые пациенты с нарушением функции почек:

Почечная недостаточность	Клиренс креатинина (мл/мин)	Доза и кратность приема
Нормальная функция почек	≥ 80	10 мг 1 раз в сутки
Легкая	50-79	10 мг 1 раз в сутки
Средняя	30-49	5 мг 1 раз в сутки
Тяжелая	< 30	5 мг 1 раз в 2 дня
Терминальная, потребность в гемодиализе	< 10	Противопоказано

У детей с нарушением функции почек дозу следует корректировать индивидуально, учитывая КК, возраст пациента и массу его тела.

При нарушении функции печени необходимо подбирать дозу индивидуально, особенно осторожно при одновременной почечной недостаточности.

Пожилым пациентам с нормальной функцией почек коррекции дозы не требуется.

При сезонном аллергическом рините длительность терапии составляет обычно от 3 до 6 недель, а при кратковременном воздействии пыльцы бывает достаточно и одной недели.

Длительность терапии для детей старше 6 лет составляет от 2 до 4 недель, а при кратковременном воздействии аллергена достаточен прием в течение 1 недели.

Побочное действие

По данным Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ) нежелательные эффекты классифицированы в соответствии с их частотой развития

следующим образом: очень часто ($\geq 1/10$), часто (от $\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечасто (от $\geq 1/1,000$ до $< 1/100$), редко (от $\geq 1/10,000$ до $< 1/1,000$), очень редко ($< 1/10,000$); частота неизвестна - по имеющимся данным установить частоту возникновения не представлялось возможным.

Со стороны желудочно-кишечного тракта:

часто: сухость во рту, тошнота;

нечасто: диарея;

редко: боль в животе.

Со стороны иммунной системы:

редко: реакции гиперчувствительности;

очень редко: анафилактический шок.

Со стороны нервной системы:

часто: головная боль, головокружение, повышенная утомляемость;

нечасто: парестезии, жажда;

редко: сонливость, судороги, агрессия, депрессия, галлюцинации, бессонница;

очень редко: нарушение вкуса, дискинезия, дистония, обморок, тремор, тик, спутанность сознания, возбуждение;

частота неизвестна: нарушение памяти, в том числе амнезия, суицидальные мысли.

Со стороны органов чувств:

очень редко: нечеткость зрения, нарушение аккомодации, нистагм;

частота неизвестна: вертиго.

Со стороны сердечно-сосудистой системы:

редко: тахикардия.

Со стороны крови и лимфатической системы:

очень редко: тромбоцитопения.

Со стороны печени и желчевыводящих путей:

редко: изменение функциональных проб печени (повышение активности «печеночных» трансаминаз, щелочной фосфатазы, гамма-глутаминтрансферазы и концентрации билирубина).

Со стороны кожи и подкожной ткани:

нечасто: зуд кожи, сыпь;

редко: крапивница;

очень редко: ангионевротический отек;

частота неизвестна: стойкая эритема.

Со стороны мочевыделительной системы:

очень редко: дизурия, энурез;

частота неизвестна: задержка мочи.

Со стороны дыхательной системы:

часто: ринит, фарингит.

Со стороны обмена веществ:

очень редко: повышение массы тела.

Прочее:

нечасто: астения;

редко: периферические отеки, недомогание;

частота неизвестна: повышение аппетита.

Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются, или Вы заметили любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

Передозировка

Симптомы: возможны сонливость, заторможенность, слабость, головная боль, тахикардия, повышенная раздражительность, задержка мочеиспускания, утомляемость (чаще всего при приеме в день 50 мг цетиризина), диарея, головокружение, мидриаз, ступор, тремор, спутанность сознания.

Лечение: проводят симптоматическую терапию: промывание желудка или стимуляцию рвоты, прием активированного угля. Специфический антидот не выявлен. Гемодиализ неэффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Не установлено клинически значимых взаимодействий цетиризина с *азитромицином, псевдоэфедрином, кетоконазолом, эритромицином, циметидином, глипизидом, диазепамом.*

При одновременном применении *теофиллина* в низкой дозе (400 мг/сут) и цетиризина отмечено небольшое снижение общего клиренса последнего. Данное взаимодействие не является клинически значимым, однако оно может быть более выраженным при применении более высоких доз теофиллина.

При применении цетиризина в терапевтических дозах клинически значимого взаимодействия с *этанолом* (при концентрации этанола в крови 0,5 г/л) не наблюдалось. Тем не менее, следует воздерживаться от его употребления во время терапии цетиризином во избежание угнетения центральной нервной системы (ЦНС).

Миелостатические лекарственные средства усиливают проявления гематотоксичности препарата.

В исследовании при одновременном приеме *ритонавира* (600 мг 2 раза в день) и цетиризина (10 мг в день) показано, что экспозиция цетиризина увеличивалась на 40 %, а экспозиция ритонавира незначительно изменялась (уменьшалась на 11 %).

Перед назначением аллергических проб рекомендован трехдневный «отмывочный» период ввиду того, что блокаторы H₁-гистаминовых рецепторов ингибируют развитие аллергических реакций.

Особые указания

Не рекомендуется совместное применение с лекарственными препаратами, угнетающими ЦНС, и алкоголем.

У пациентов с повреждением спинного мозга, гиперплазией предстательной железы, а также при наличии других предрасполагающих факторов к

задержке мочи, требуется соблюдение осторожности, так как цетиризин может увеличивать риск задержки мочи.

Указание для пациентов с сахарным диабетом: 1 таблетка соответствует менее 0,01 ХЕ.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Цетиризин у некоторых пациентов может вызывать сонливость, поэтому необходимо воздержаться от управления транспортными средствами и работы со сложными техническими устройствами, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые оболочкой 10 мг, по 7 или по 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из ПВХ/алюминиевой фольги. По 1, 2, 3 или 5 блистеров в картонную пачку вместе с инструкцией по применению.

Срок годности

3 года.

Не использовать по истечении срока, указанного на упаковке.

Условия хранения

При температуре не выше 25°C, в недоступном для детей месте.

Условия отпуска

Без рецепта.

Производитель

Гексал АГ, 83607 Хольцкирхен Индустриштрассе 25, Германия;

Произведено: Салютас Фарма ГмбХ, Германия.

Претензии потребителей направлять в ЗАО «Сандоз»:

123317, Москва, Пресненская наб., д 8, стр. 1;

телефон: (495) 660-75-09; факс: (495) 660-75-10.

Руководитель отдела регистрации



Б. Мравинец