МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
Цетиризин-OBL

Внимательно прочитайте эту инструкцию перед тем, как начать применение этого препарата, так как она содержит важную для вас информацию. Сохраняйте инструкцию, она может понадобиться вновь. Если у Вас возникли вопросы, обратитесь к врачу. Лекарственное средство, которым Вы лечитесь, предназначено лично Вам, и его не следует передавать другим лицам, поскольку оно может причинить им вред даже при наличии тех же симптомов, что и у Вас.

Регистрационный номер

Торговое наименование

Цетиризин-OBL

Международное непатентованное наименование

цетиризин

Лекарственная форма

таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав

1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой содержит:

действующее вещество: цетиризина дигидрохлорид 10 мг;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, повидон, лактозы моногидрат, кальция гидрофосфата дигидрат, карбоксиметилкрахмал натрия (натрия крахмала гликолят), магния стеарат;

вспомогательные вещества оболочки: гипромеллоза (гидроксипропилметилцеллюлоза), макрогол 6000 (полиэтиленгликоль 6000), титана диоксид.

Описание

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, двояковыпуклые, продолговатой формы со скругленными концами, с риской. На поперечном разрезе таблетки внутренний слой белого или почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа

противоаллергическое средство – H_1- гистаминовых рецепторов блокатор

Код АТХ: R06AE07

100647

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Цетиризин - активное вещество препарата Цетиризин-OBL - является метаболитом гидроксизина, относится к группе конкурентных антагонистов гистамина и блокирует H_1-гистаминовые рецепторы.

В дополнение к антигистаминному эффекту цетиризин предупреждает развитие и облегчает течение аллергических реакций: в дозе 10 мг один или два раза в день ингибирует позднюю фазу агрегации эозинофилов в коже и конъюнктиве пациентов, имеющих аллергические реакции.

Клиническая эффективность и безопасность

Исследования на здоровых добровольцах показали, что цетиризин в дозах 5 или 10 мг значительно ингибирует реакцию в виде сыпи и покраснения на введение в кожу гистамина в высокой концентрации, однако корреляция с эффективностью не установлена.

В 6-недельном плацебо-контролируемом исследовании с участием 186 пациентов с аллергическим ринитом и сопутствующей бронхиальной астмой легкого и средне-тяжелого течения, показано, что прием цетиризина в дозе 10 мг - один раз в сутки уменьшает симптомы ринита и не влияет на функцию легких.

Результаты данного исследования подтверждают безопасность применения цетиризина у пациентов, страдающих аллергией и бронхиальной астмой легкого и среднетяжелого течения.

В плацебо-контролируемом исследовании показано, что прием цетиризина в дозе 60 мг в сутки в течение 7 дней не вызывал клинически значимого удлинения интервала QT.

Прием цетиризина в рекомендуемой дозе показал улучшение качества жизни пациентов с круглогодичным и сезонным аллергическими ринитами.

Дети

В 35-дневном исследовании с участием пациентов в возрасте 5-12 лет не выявлено признаков невосприимчивости к антигистаминному эффекту цетиризина. Нормальная реакция кожи на гистамин восстанавливалась в течение трех дней после отмены препарата при его неоднократном применении.

Фармакокинетика

Фармакокинетические параметры цетиризина при его применении в дозах от 5 до 60 мг изменяются линейно.

Всасывание

ЛП 100647

Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 1 ± 0,5 часа и составляет 300 мг/мл.

Различные фармакокинетические параметры, такие как максимальная концентрация в плазме крови (C_{max}) и площадь под кривой «концентрация-время» (AUC) имеют однородный характер.

Прием пищи не влияет на полноту абсорбции цетиризина, хотя скорость ее уменьшается.

Распределение

Цетиризин на 93±0,3% связывается с белками плазмы крови. Кажущийся объем распределения (V_d) составляет 0,5 л/кг. Цетиризин не влияет на связывание варфарина с белками.

Метаболизм

Цетиризин не подвергается экстенсивному первичному метаболизму.

Выведение

Период полувыведения ($T_{1/2}$) составляет примерно 10 часов.

При приеме препарата в суточной дозе 10 мг в течение 10 дней кумуляции цетиризина не наблюдалось.

Примерно 2/3 принятой дозы препарата выводится с мочой в неизмененном виде.

Пожилые пациенты:

У 16 пожилых лиц при однократном приеме препарата в дозе 10 мг $T_{1/2}$ был выше на 50%, а клиренс был ниже на 40% по сравнению с лицами не пожилого возраста.

Снижение клиренса цетиризина у пожилых пациентов вероятно связано с уменьшением функции почек у этой категории пациентов.

Пациенты с почечной недостаточностью:

У пациентов с почечной недостаточностью легкой степени тяжести (клиренс креатинина (КК) > 40 мл/мин) фармакокинетические параметры аналогичны таковым у здоровых добровольцев с нормальной функцией почек. У пациентов с почечной недостаточностью средней степени тяжести и у пациентов, находящихся на гемодиализе (КК < 7 мл/мин), при приеме препарата внутрь в дозе 10 мг $T_{1/2}$ удлиняется в 3 раза, а общий клиренс снижается на 70% относительно здоровых добровольцев с нормальной функцией почек.

Для пациентов с почечной недостаточностью среднетяжелого или тяжелого течения требуется соответствующее изменение режима дозирования.

Цетиризин практически не удаляется из организма при гемодиализе.

Пациенты с печеночной недостаточностью:

У пациентов с хроническими заболеваниями печени (гепатоцеллюлярным, холестатическим и билиарным циррозом) при однократном приеме препарата в дозе 10

100647

или 20 мг $T_{1/2}$ увеличивается примерно на 50%, а клиренс снижается на 40% по сравнению со здоровыми субъектами. Коррекция дозы необходима только в случае, если у пациента с печеночной недостаточностью имеется также сопутствующая почечная недостаточность.

Дети:

$T_{1/2}$ у детей от 6 до 12 лет составляет 6 часов, от 2 до 6 лет - 5 часов, от 6 месяцев до 2 лет - снижено до 3,1 часа.

Показания к применению

Цетиризин-OBL показан для применения у взрослых и детей с 6 лет и старше для облегчения:

- назальных и глазных симптомов круглогодичного (персистирующего) и сезонного (интермиттирующего) аллергического ринита и аллергического конъюнктивита: зуда, чиханья, заложенности носа, ринореи, слезотечения, гиперемии конъюнктивы;
- симптомов хронической идиопатической крапивницы.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к цетиризину, гидроксизину или производным пиперазина, а также к другим компонентам препарата, терминальная стадия почечной недостаточности (клиренс креатинина < 10 мл/мин), детский возраст до 6 лет, беременность, дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

С осторожностью

При хронической почечной недостаточности (ХПН) при КК>10 мл/мин (требуется коррекция режима дозирования), в пожилом возрасте (возможно снижение клубочковой фильтрации), эпилепсия и пациенты с повышенной судорожной готовностью, пациенты с предрасполагающими факторами к задержке мочи, период грудного вскармливания.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

При анализе проспективных данных более чем 700 случаев исходов беременности не выявлено случаев формирования пороков развития, эмбриональной и неонатальной токсичности с четкой причинно-следственной связью.

Экспериментальные исследования на животных не выявили каких-либо прямых или косвенных неблагоприятных эффектов цетиризина на развивающийся плод (в том числе в постнатальном периоде), течение беременности и родов.

Адекватных и строго контролируемых клинических исследований по безопасности применения препарата во время беременности не проводилось, поэтому применение препарата при беременности противопоказано.

Грудное вскармливание

100647

Цетиризин выделяется с грудным молоком в концентрации, представляющей от 25% до 90% от концентрации препарата в плазме крови в зависимости от времени после назначения. В период грудного вскармливания применяют после консультации с врачом, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для ребенка.

Фертильность

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

Способ применения и дозы

Внутрь, таблетки рекомендуется запивать стаканом воды.

Взрослым - по 1 таблетке ежедневно, предпочтительно вечером. Иногда начальной дозы 5 мг (1/2 таблетки) может быть достаточно, если это позволяет достичь удовлетворительного контроля симптомов.

Детям в возрасте старше 12 лет - по 1 таблетке ежедневно, предпочтительно вечером. Иногда начальной дозы 5 мг (1/2 таблетки) может быть достаточно, если это позволяет достичь удовлетворительного контроля симптомов.

Детям в возрасте от 6 до 12 лет - по 1/2 таблетки два раза в день утром и вечером. Детям с почечной недостаточностью дозу корректируют с учетом КК и массы тела.

Пожилым пациентам с нормальной функцией почек коррекция дозы не требуется.

Пациенты с почечной недостаточностью

Поскольку цетиризин выводится из организма в основном почками (см. подраздел «Фармакокинетика»), при невозможности альтернативного лечения *пациентам с почечной недостаточностью* режим дозирования препарата следует корректировать в зависимости от функции почек (величины клиренса креатинина КК).

Клиренс креатинина (КК) для мужчин можно рассчитать, исходя из концентрации сывороточного креатинина, по следующей формуле:

$$КК\ (мл/мин) = \frac{[140 - возраст\ (годы)] \times масса\ тела\ (кг)}{72 \times КК_{сыворот}\ (мг/дл)}$$

КК для женщин можно рассчитать, умножив полученное значение на коэффициент 0,85.

Дозирование у взрослых пациентов с почечной недостаточностью

Почечная недостаточность	**КК (мл/мин)**	**Режим дозирования**
Норма	≥80	10 мг/сут

100647

Легкая	50-79	10 мг/сут
Средняя	30-49	5 мг/сут
Тяжелая	10-29	5 мг через день
Терминальная стадия - пациенты, находящиеся на диализе	< 10	прием препарата противопоказан

Пациенты с нарушением функции печени

У пациентов с нарушением только функции печени коррекции режима дозирования не требуется.

У пациентов с нарушением и функции печени и функции почек, рекомендуется коррекция дозирования (см. таблицу выше).

Применяйте препарат только согласно тем показаниям, тому способу применения и в тех дозах, которые указаны в инструкции.

Побочное действие

Если у Вас отмечаются побочные эффекты, указанные в инструкции, или они усугубляются, или Вы заметили любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

Данные, полученные в клинических исследованиям

Обзор

Результаты клинических исследований продемонстрировали, что применение цетиризина в рекомендованных дозах приводит к развитию незначительных нежелательных эффектов на ЦНС, включая сонливость, утомляемость, головокружение и головную боль. В некоторых случаях была зарегистрирована парадоксальная стимуляция ЦНС.

Несмотря на то, что цетиризин является селективным блокатором периферических H_1-рецепторов и практически не оказывает антихолинергического действия, сообщалось о единичных случаях затруднения мочеиспускания, нарушениях аккомодации и сухости во рту. Сообщалось о нарушениях функции печени, сопровождающихся повышением уровня печеночных ферментов и билирубина. В большинстве случаев нежелательные явления разрешались после прекращения приема цетиризина дигидрохлорида.

Перечень нежелательных побочных реакций

Имеются данные, полученные в ходе двойных слепых контролируемых клинических исследований, направленных на сравнение цетиризина и плацебо или других антигистаминных препаратов, применяемых в рекомендованных дозах (10 мг один раз в сутки для цетиризина) более чем у 3200 пациентов, на основании которых можно провести достоверный анализ данных по безопасности.

100647

Согласно результатам объединенного анализа, в плацебо-контролируемых исследованиях при применении цетиризина в дозе 10 мг были выявлены следующие нежелательные реакции с частотой 1,0% или выше.

Нежелательные реакции (терминология ВОЗ)	**Цитиризин 10 мг (n=3260)**	**Плацебо (n=3061)**
Общие нарушения и нарушения в месте введения		
Утомляемость	1,63%	0,95%
Нарушения со стороны нервной системы		
Головокружение	1,1%	0,98%
Головная боль	7,42%	8,07%
Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта		
Боль в животе	0,98%	1,08%
Сухость во рту	2,09%	0,82%
Тошнота	1,070%	1,14%
Нарушения психики		
Сонливость	9,63%	5,00%
Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения		
Фарингит	1,29%	1,34%

Хотя частота случаев сонливости в группе цетиризина была выше, чем таковая в группе плацебо, в большинстве случаев это нежелательное явление было легкой или умеренной степени тяжести. При объективной оценке, проводимой в рамках других исследований, было подтверждено, что применение цетиризина в рекомендованной суточной дозе у здоровых молодых добровольцев не влияет на их повседневную активность.

Дети

В плацебо-контролируемых исследованиях, у детей в возрасте от 6 месяцев до 12 лет были выявлены следующие нежелательные реакции с частотой 1% и выше:

Нежелательные реакции	**Цетиризин (n = 1656)**	**Плацебо (n = 1294)**

100647

(терминология ВОЗ)		
Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта		
Диарея	1,0%	0,6%
Нарушения психики		
Сонливость	1,8%	1,4%
Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения		
Ринит	1,4%	1,1%
Общие нарушения и нарушения в месте введения		
Утомляемость	1,0%	0,3%

Опыт пострегистрационного применения

Помимо нежелательных явлений, выявленных в ходе клинических исследований и описанных выше, в рамках пострегистрационного применения препарата наблюдались следующие нежелательные реакции.

Нежелательные явления представлены по классам системы органов MedDRA и частоте развития, на основании данных пострегистрационного применения препарата.

Частота развития нежелательных явлений определялась следующим образом: очень часто (≥1/10), часто (≥1/100, <1/10), нечасто (≥1/1000, <1/100), редко (≥ 1/10000, <1/1000), очень редко (<1/10000), частота неизвестна (из-за недостаточности данных).

Со стороны крови и лимфатической системы:

Очень редко: тромбоцитопения

Со стороны иммунной системы

Редко: реакции гиперчувствительности

Очень редко: анафилактический шок

Нарушение метаболизма и расстройства питания

Частота неизвестна: повышение аппетита

Расстройства со стороны психики

Нечасто: возбуждение

Редко: агрессия, спутанность сознания, депрессия, галлюцинации, нарушение сна.

100647

Очень редко: тик

Частота неизвестна: суицидальные идеи

Со стороны нервной системы

Нечасто: парестезии

Редко: судороги

Очень редко: извращение вкуса, дискинезия, дистония, обморок, тремор

Частота неизвестна: нарушение памяти, в том числе амнезия

Со стороны органа зрения

Очень редко: нарушение аккомодации, нечеткость зрения, нистагм

Со стороны органов слуха

Частота неизвестна: вертиго

Со стороны сердечно-сосудистой системы

Редко: тахикардия

Со стороны пищеварительной системы

Нечасто: диарея

Гепатобиллиарные расстройства

Редко: изменение функциональных печеночных проб (повышение активности трансаминаз, щелочной фосфатазы, гамма-глутамилтрансферазы и билирубина)

Со стороны кожи

Нечасто: сыпь, зуд

Редко: крапивница

Очень редко: ангионевротический отек, стойкая лекарственная эритема

Со стороны мочевыделительной системы

Очень редко: дизурия, энурез

Частота неизвестна: задержка мочи

Общие расстройства

Нечасто: астения, недомогание

Редко: периферические отеки

Исследования

Редко: повышение массы тела

Оповещение о побочных реакциях:

Большое значение имеет система оповещения о подозреваемых побочных реакциях после регистрации лекарственного препарата.

Это позволяет вести непрерывный мониторинг соотношения польза/риск лекарственного препарата.

100647

Передозировка

Симптомы:

При однократном приеме препарата в дозе 50 мг наблюдались следующие симптомы: спутанность сознания, диарея, головокружение, повышенная утомляемость, головная боль, недомогание, мидриаз, зуд, беспокойство, слабость, седативный эффект, сонливость, ступор, тахикардия, тремор, задержка мочи.

Лечение: сразу после приема препарата - промывание желудка или стимуляция рвоты. Рекомендуется прием активированного угля, проведение симптоматической и поддерживающей терапии. Специфического антидота нет. Гемодиализ неэффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

На основании анализа фармакодинамики, фармакокинетики цетиризина взаимодействие с другими лекарственными препаратами маловероятно. Не было отмечено значимых взаимодействий с псевдоэфедрином и теофиллином (в дозе 400 мг в сутки) в специальных исследованиях лекарственного взаимодействия.

Одновременное применение цетиризина с алкоголем и другими препаратами, угнетающими ЦНС, может способствовать дальнейшему снижению концентрации внимания и быстроты реакций, хотя цетиризин не усиливает эффект алкоголя (при его концентрации в крови 0,5 г/л).

Если Вы применяете вышеперечисленные или другие лекарственные препараты (в том числе безрецептурные) перед применением препарата Цетиризин-OBL проконсультируйтесь с врачом.

Особые указания

Рекомендовано соблюдать осторожность при применении цетиризина одновременно с алкоголем, хотя в терапевтических дозах не отмечено клинически значимого взаимодействия с алкоголем (при концентрации алкоголя в крови 0,5 г/л).

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.

Осторожность следует соблюдать у пациентов с эпилепсией и повышенной судорожной готовностью.

Перед назначением аллергологических проб рекомендован трехдневный «отмывочный» период ввиду того, что H_1-гистаминовых рецепторов блокаторы ингибируют развитие кожных аллергических реакций.

Цетиризин-OBL не должен назначаться пациентам с наследственной непереносимостью лактозы, дефицитом лактазы или с глюкозо-галактозной мальабсорбцией.

100647

Дети

Цетиризин в таблетках покрытых пленочной оболочкой, не рекомендуется назначать детям до 6 лет, поскольку данная лекарственная форма не позволяет использовать подходящую дозировку для этой возрастной группы. Рекомендуется использовать педиатрическую лекарственную форму (капли для приема внутрь).

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

При объективной оценке способности к вождению автотранспорта и управлению механизмами достоверно не выявлено каких-либо нежелательных явлений при приеме препарата в рекомендуемой дозе. Однако пациентам с проявлениями сонливости на фоне приема препарата целесообразно воздерживаться от управления автомобилем, занятиями потенциально опасными видами деятельности или управлением механизмами, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 10 мг

По 10, 14, 15, 20 или 30 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 1, 2, 3, 4, 5, 6 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Без рецепта.

Производитель/организация, принимающая претензии

ЗАО «ФП «Оболенское», Россия.

142279, Московская обл., Серпуховский район, п. Оболенск, корп. 7-8, корп. 39.

Тел./факс: (4967) 36-01-07. www.obolensk.ru

Директор по регистрации **Г.У. Сетдекова**

МЗ РФ
ЭКСПЕРТНЫЙ ОТЧЕТ
ДЕЙСТВИТЕЛЕН ДЛЯ ДАННОЙ ВЕРСИИ ДОКУМЕНТА
0 0 0 0 0 0 0 0 0 4
ФГБУ НЦЭСМП

100647