

## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

### 1. ТЪРГОВСКО НАИМЕНОВАНИЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

**Egirizin 10 mg/ml oral drops solution**  
**Егиризин 10 mg/ml перорални капки, разтвор**

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1
Към РУ <u>11-2954</u> / <u>16.09.08</u>
Одобрено: .....

### 2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Активно вещество: 10 mg цетиризинов дихидрохлорид (съответства на 8.42 mg цетиризин) във всеки ml разтвор.

Списъкът на помощните вещества е представен в т. 6.1.

### 3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Перорални капки, разтвор.

Описание на лекарствения продукт: Прозрачен, безцветен, без мирис, сладък воден разтвор.

### 4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

#### 4.1 Терапевтични показания

- Целогодишен алергичен ринит;
- Сезонен алергичен ринит и конюнктивит;
- Сърбеж;
- Хронична идиопатична уртикария.

#### 4.2 Дозировка и начин на приложение

*Възрастни и деца над 12 години:*

Обичайната доза е 1 x 10mg/дневно (1 x 20 капки), за предпочитане е да се приема вечер.

*Деца на възраст 6 – 12 години:*

Обичайната доза е или 2 x 5 mg/дневно (2 x 10 капки) сутрин и вечер, или 1 x 10 mg/дневно (1 x 20 капки)- вечер.



**Деца на възраст 2 – 6 години:**

Обичайната доза е или 2 x 2.5 mg/дневно (2 x 5 капки) сутрин и вечер, или 1 x 5 mg/дневно (1 x 10 капки) - вечер.

**Особени групи пациенти:**

Може да се наложи редуциране на дозата при пациенти в *старческа възраст* (виж т. 4.4).

При *пациенти с бъбречна недостатъчност* дозата се определя индивидуално в зависимост от степента на увреждане на бъбречната функция (виж таблицата по-долу).

Необходимо е да се определи креатининовия клирънс ( $Cl_{cr}$  в ml/min) за да може таблицата да бъде използвана.

*Мъже:* Клирунс на креатинина ( $Cl_{cr}$  в ml/min) = [тел. маса в kg x (140 – възрастта)/72 x серумния креатинин в mg/dl].

*Жени:* Резултатът от горната формула се умножава по 0.85.

Група	Креатининов клирънс (ml/min)	Доза и честота на приемане
Нормална бъбречна функция	$\geq 80$	10 mg веднъж дневно
Лека степен бъбречна недостатъчност	50-79	10 mg веднъж дневно
Умерена степен	30-49	5 mg веднъж дневно
Тежка степен	$<30$	5 mg веднъж на 2 дни
Пациенти на хемодиализа	$<10$	противопоказано

#### 4.3 Противопоказания

- известна свръхчувствителност към лекарственото вещество или към някое от помощните вещества;
- деца под 2 годишна възраст (безопасността и ефективността на cetirizine не са проучвани при тази възрастова група);
- тежка бъбречна недостатъчност и креатининов клирънс под 10 ml/min.
- Бременност и кърмене (виж т. 4.6).

#### 4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

**Реакция на свръхчувствителност**

Лечението с Egidizin трябва да бъде незабавно прекратено, в случай, че се развие реакция на свръхчувствителност.

**Бъбречни увреждания**

При пациенти с увредена бъбречна функция може да настъпи акумулиране на cetirizine, като резултат от пониженото му елиминиране и рискът от развитие на антихолинергични и други нежелани реакции от страна на ЦНС, както и тяхната тежест са увеличени при прилагане на обичайната доза за възрастни. Затова при тях се препоръчва редукция на дозата.



#### Пациенти в старческа възраст

Пациентите в старческа възраст показват повишена чувствителност към антихолинергичните нежелани реакции (напр. сухота в устата, задръжка на урина) на антихистамините. Ако тези реакции не отзвучат или станат по-интензивни, лечението с Egirizin трябва да бъде прекратено. Появата на сериозни антихолинергични или други нежелани реакции от страна на ЦНС е малко вероятна при лечение с cetirizine. Независимо от това, рискът от акумулиране на cetirizine е увеличен (вероятно поради намалената вследствие възрастта бъбречна функция), което може да доведе до провокиране на антихолинергични или други нежелани реакции от страна на ЦНС дори и при прилагане на обичайните дневни дози.

#### Кожни проби

Както и при другите антихистаминови лекарства, преди извършването на Prick-тест, лечението трябва да бъде спряно поне 3 дни преди теста, за да се избегнат фалшиво отрицателни резултати.

### **4.5 Взаимодействие с други лекарства и други видове взаимодействия**

Досегашната клинична практика не показва лекарствени взаимодействия на cetirizine с други лекарства: не е наблюдавано взаимодействие при едновременно приложение с diazepam, cimetidine, azithromycine, erythromycin, pseudoephedrine, ketoconazole и ниски дози theophylline.

Едновременното приложение на cetirizine и макролидни антибиотици или cetirizine и ketoconazole не са причинили клинично значими промени в ЕКГ.

#### Алкохол

Както и при лечение с други антихистамини не трябва да се консумира алкохол по време на лечението с Egirizin.

### **4.6 Бременност и кърмене**

#### Предклинични данни

##### *Бременност*

В проучванията с животни cetirizine не притежава тератогенен ефект.

#### Клинични данни

##### *Бременност*

Няма достатъчно данни от контролирани проучвания при хора, затова е противопоказано прилагането му по време на бременност.

##### *Кърмене*

Cetirizine се екскретира с майчиното мляко, следователно е противопоказан при кърмещи жени.



#### 4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

По време на лечение с cetirizine могат да се появят главоболие, замаяност, сънливост и намалена възможност за концентрация. Затова възможността за шофиране и работа с опасни машини трябва да се разглеждат индивидуално.

#### 4.8 Нежелани лекарствени реакции

По време на лечението с Egirizin са наблюдавани леки до умерени нежелани реакции. Най-честите (при  $\geq 2\%$  от случаите) са:

- сънливост (дозо-зависима)
- уморяемост
- главоболие
- замаяност
- сухота в устата
- гадене и други гастроинтестинални симптоми
- безпокойство (увеличена моторна активност).

Интензитетът на описаните нежелани реакции може да бъде намален, ако дневната доза се раздели на два приема.

По-рядко (в по-малко от  $2\%$  от случаите) се развиват реакции на свръхчувствителност (ангионевротичен едем, кожни реакции).

#### 4.9 Предозиране

##### Симптоми:

Най-честите симптоми на предозиране са уморяемост и сомнолентност, задръжка на урина, тремор, тахикардия, вертиго, обърканост, главоболие, неразположение. Безпокойство и раздразнителност, последвани от сънливост са били наблюдавани при случаи на предозиране при деца.

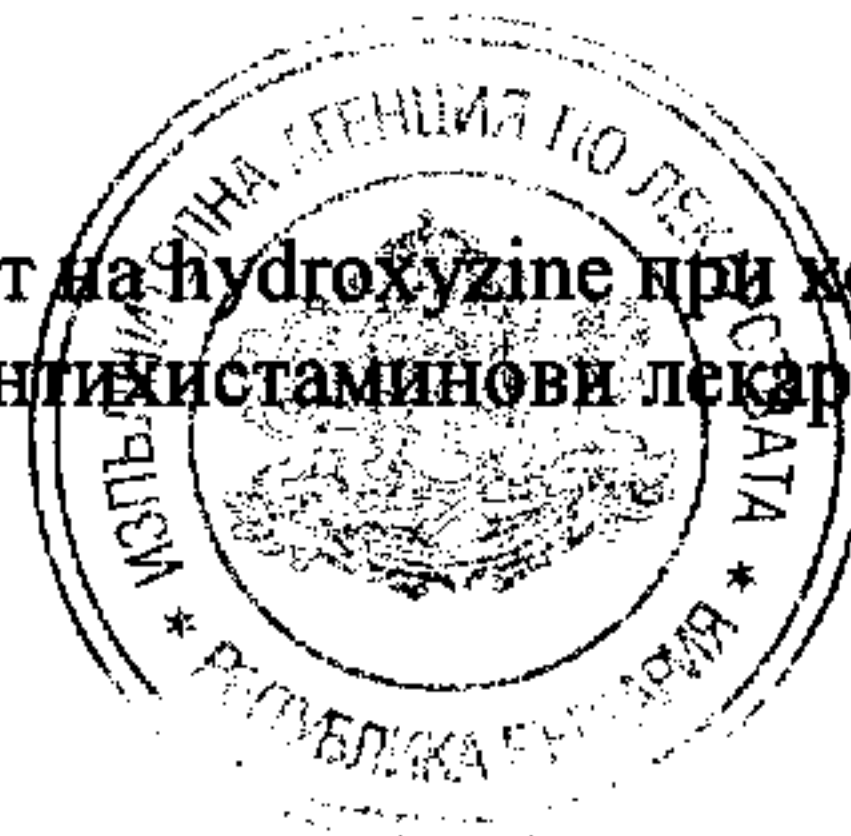
Лечение: Предозиране с големи дози cetirizine се третира със стомашна промивка, а също и симптоматично и общоукрепващо лечение. Не е известен специфичен антидот. Диализата не е ефективна за премахване на лекарствения продукт от циркулацията.

### 5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

**Фармакотерапевтична група:** антихистамини за системно приложение, пиперазинови производни  
**АТС код:** R06A E07

#### 5.1 Фармакодинамика

Cetirizine, основният карбоксилиран метаболит на hydroxyzine при хора принадлежи към групата на пиперазиновите антихистаминови лекарства.



Cetirizine упражнява главните си антиалергични ефекти чрез селективно инхибиране на периферните хистаминови  $H_1$  рецептори. По този механизъм cetirizine потиска медираните от хистамина ранни алергични реакции, потиска миграцията на клетките на възпалението и отделянето на медиатори, свързани с късните алергични реакции.

Cetirizine притежава в незначителна степен антихолинергичен и антисеротонинергичен ефекти.

## 5.2 Фармакокинетика

След перорално приложение cetirizine се резорбира бързо като максималната плазмена концентрация се постига за 30-60 минути. Не е било наблюдавано акумулиране след перорално приложение. При приложение на дози от 5 до 60 mg cetirizine показва линейна фармакокинетика. Приемът на храна не променя резорбцията му (AUC), но причинява 1.7 часа закъснение в постигането на максимална плазмена концентрация и намалява максималното плазмено ниво с 23 %.

Свързването с плазмените протеини е 93 %, което не зависи от концентрацията в диапазона 25 до 1000 ng/ml, в който диапазон са терапевтичните плазмени нива. Като основен карбоксилиран метаболит на hydroxyzine, cetirizine е по-хидрофилен от началната субстанция, следователно способността му да прониква в ЦНС е много малка. Само малка част от cetirizine се метаболизира, като се превръща в черния дроб до практически неактивния o-dealkyl метаболит.

60 % от перорално приложената доза се екскретира непроменена в урината за 24 часа, а още 10 % се екскретират в следващите 4 дни. Около 10 % се екскретират с фецеса, частично под формата на метаболити. Cetirizine се екскретира в кърмата.

Плазменият елиминационен полуживот е 8 – 12 часа при възрастни, около 6 часа при деца на възраст 6 – 12 години и около 5 часа при деца от 2 до 6 години.

Поради по-високата честота на намалена бъбречна функция при пациенти в старческа възраст, клирънсът на cetirizine може да намалее в тази възрастова група.

Фармакокинетичните проучвания с повтарящи се дози при здрави доброволци и пациенти с лека степен на бъбречна недостатъчност показаха почти еднаква фармакокинетика на cetirizine. При пациенти с умерена степен на бъбречна недостатъчност обаче, беше наблюдавано трикратно увеличение на елиминационния полуживот на cetirizine и 70 % намаление на клирънса му, в сравнение със здравите доброволци.

При пациенти на хемодиализа трикратното увеличение на елиминационния полуживот на cetirizine и 70 % намаление на клирънса му можеше да се наблюдава дори при приложение на единична доза от 10 mg cetirizine. В сравнение със съответните стойности при здрави доброволци 50 % увеличение на елиминационния полуживот и около 40 % по-нисък клирънс беше наблюдаван при пациенти с хронична чернодробна недостатъчност.



### 5.3 Предклинични данни за безопасност

При 2-годишни проучвания за карциногенност, проведени при плъхове с дози 15 пъти по-високи от максималните терапевтични беше установено, че cetirizine не притежава карциногенен ефект. При 2-годишни проучвания за карциногенност, проведени при мишки честотата на възникване на доброкачествени тумори на черния дроб беше увеличена при мъжките животни, получаващи 6 пъти по-висока от максималната терапевтична доза; такива данни не бяха намерени обаче за мишките, третирани с 2 пъти по-висока от максималната терапевтична доза. Значимостта на тези резултати не е ясна по отношение на дългосрочното приложение на cetirizine в клиничната практика.

Cetirizine не притежава мутагенни ефекти *in vivo* и *in vitro*.

При проучвания върху фертилитета и репродуктивната функция при мишки с дози 25 пъти по-високи от максималните терапевтични, cetirizine не показва нежелан ефект върху тези функции.

При проучвания на животни, cetirizine не показва тератогенни ефекти.

## 6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

### 6.1 Помощни вещества

пропил парахидроксибензоат  
ледена оцетна киселина  
метил парахидроксибензоат  
натриев ацетат  
захарин натрий  
глицерол  
пропиленгликол  
пречистена вода.

### 6.2 Несъвместимости

Не са известни.

### 6.3 Срок годност

Неотворен: 4 години

Отворен: 4 седмици след първоначалното отваряне на опаковката.

### 6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 25°C. Да се пази от светлина.



**6.5 Вид и състав на опаковката**

20 ml разтвор в кафява бутилка, затворена с бяла полипропиленова осигурена капачка на винт, с безцветен полиетиленов капкомер. Бутилката е поставена в картонена кутия заедно с листовката за пациента.

**6.6 Указания за употреба**

Съгласно точка 4.2

Режим на отпускане: По лекарско предписание

**7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

**EGIS Pharmaceuticals PLC**  
**1106 Budapest, Keresztúri út 30-38.**  
**УНГАРИЯ**

**8. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР**

**20030285**

**9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТРЕБА**

07.05.2003 г.

**10. ДАТА НА ПОСЛЕДНА РЕДАКЦИЯ НА ТЕКСТА**

Август 2007

