

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ТЪРГОВСКО НАИМЕНОВАНИЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Egirizin® 10 mg film-coated tablets
Егиризин 10 mg филмирани таблетки

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВОТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към РУ	И-3158 / 17.10.08
Одобрено:	21 / 29.07.08

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Лекарствено вещество: Всяка филмирана таблетка съдържа 10 mg цетиризинов дихидрохлорид.

Списъкът на помощните вещества е представен в т. 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филмирани таблетки за перорална употреба.

Описание на лекарствения продукт: бледо оранжеви, продълговати, леко биконвексни, със скосени ръбове, без мирис филмирани таблетки, маркирани с Е и 511 от едната страна и с делителна ивица от другата страна. При разчупване повърхността, която се открива е бяла.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

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

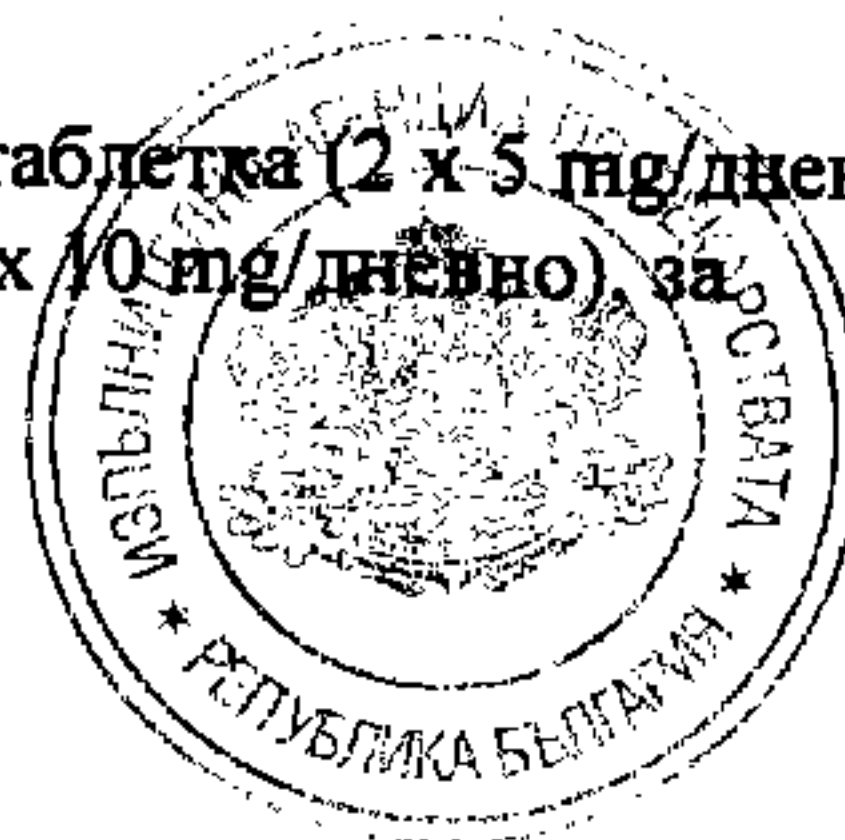
4.2 Дозировка и начин на приложение

Възрастни и деца над 12 години:

Обичайната дневна доза е една филмирана таблетка (1 x 10 mg/дневно), за предпочитане е да се приема вечер.

Деца на възраст 6 – 12 години:

Обичайната дневна доза е или 2 x ½ филмирана таблетка (2 x 5 mg/дневно), сутрин и вечер, или една филмирана таблетка (1 x 10 mg/дневно), за предпочитане - вечер.



Особени групи пациенти:

Може да се наложи редуцерање 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: Клирънс 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	≥ 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 6 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

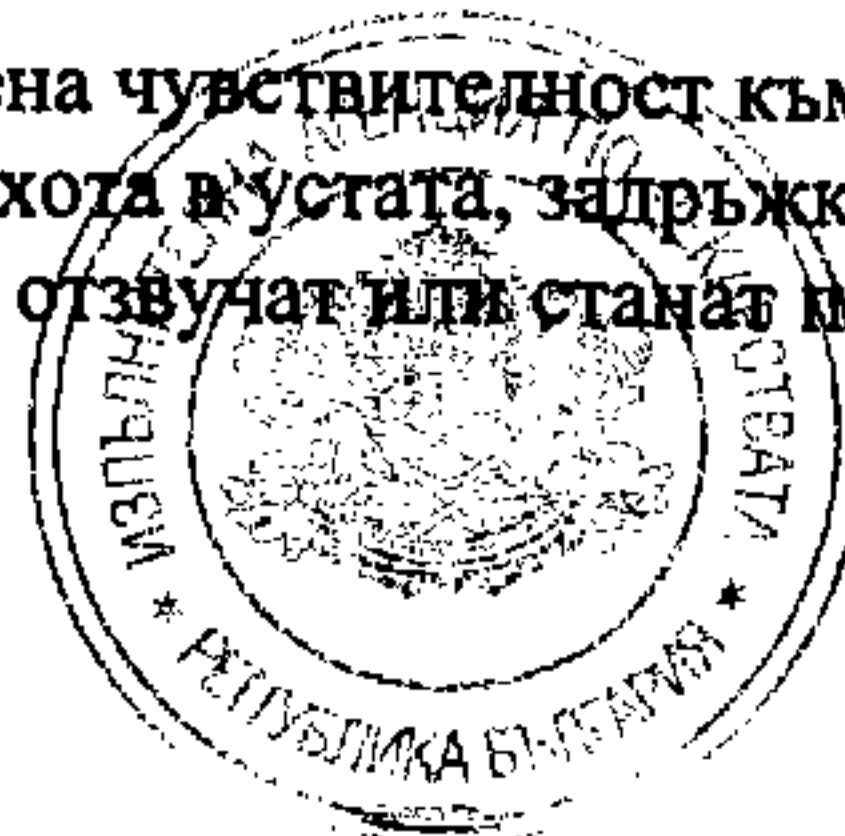
Лечението с Egizipin трябва да бъде незабавно прекратено, в случай, че се развие реакция на свръхчувствителност.

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.

Всяка филмирана таблетка съдържа 11,5 mg лактоза, затова пациентите с наследствена галактозна непоносимост, Lapp лактазна недостатъчност или глюкозо-галактозен малабсорбционен синдром не трябва да приемат тези таблетки.

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 theophyline.

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 Egitizin 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

Сърцевина на таблетката:
силициев диоксид колоиден безводен
магнезиев стеарат
целулоза микрокристална
лактоза монохидрат (11,5 mg)

Обвивка на таблетката:
Опадрай Y-1-7000 Бял (хипромелоза, титанов диоксид Е 171, макрогол 400)
ариавит сънсет жълто Е 110.

6.2 Несъвместимости

Не са известни.

6.3 Срок годност

2 години

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 25°C.



6.5 Вид и състав на опаковката

Прозрачни PVC/PVdC алуминиеви блистери от 10 филмирани таблетки. Блистерите (1 x 10 или 3 x 10) са поставени 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

20030286

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТРЕБА

07.05.2003 г.

10. ДАТА НА ПОСЛЕДНА РЕДАКЦИЯ НА ТЕКСТА

Август 2007

