

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. Име на лекарствения продукт
ALERSAN-TCHAIKAPHARMA
/АЛЕРЗАН - ЧАЙКАФАРМА/

2. Качествен и количествен състав
 Всяка филмирана таблетка съдържа Cetirizine dihydrochloride 10 mg.

3. Лекарствена форма
 Филмирани таблетки
 Описание на продукта: бели, до сиво белезникави продълговати, филмирани таблетки с делителна линия, което позволява разделянето им на две равни части.

4. Клинични данни

4.1 Показания

За облекчаване на назалните симптоми на сезонен и целогодишен алергичен ринит като ринорея, назален пруритус, кихане, както и неназални симптоми изразени с конюктивит. Различни видове пруритус и уртикария от алергичен произход, включително и хронична идиопатична уртикария.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Възрастни пациенти и деца над 12 години: обикновено се приема по 1 филмирана таблетка (10mg Cetirizine) веднъж дневно.

Деца на възраст между 6 и 12 год.: Приемат 5 mg Cetirizine (1/2 филмирана таблетка) дневно на два приема или 10mg Cetirizine (1 филмирана таблетка) веднъж дневно. Може да бъде назначена лечебна доза от 5mg веднъж дневно, ако това води до задоволителен контрол на симптомите.

Деца под 6 год.: таблетките Alersan-Tchaikapharma не са предназначени за тази възрастова група.

Пациенти с бъбречни смущения: дозировката на Cetirizine трябва да бъде намалена според степента на увреждане на бъбречната функция, изразена детайлно в табличен вид:

Група	Бъбречна функция	Креатининов клирънс	Доза и честота на прилагане
Нормална	бъбречна функция	≥ 80 ml/min	10 mg веднъж дневно
Лека недостатъчност	бъбречна	50 - 79 ml/min	10 mg веднъж дневно
Умерена недостатъчност	бъбречна	30 - 49 ml/min	5 mg веднъж дневно
Тежка недостатъчност	бъбречна	< 30 ml/min	5 mg веднъж дневно



Пациенти в краен стадий - на диализа	< 10 ml/min	противопоказано
--------------------------------------	-------------	-----------------

При деца с нарушена бъбречна функция: дозата трябва да се индивидуализира, в зависимост от бъбречния клирънс и теглото на пациента.

При пациенти на хемодиализа: Cetirizine слабо се елиминира при хемодиализа. Необходимо е индивидуално определяне на дозата при пациенти с умерено или тежко бъбречно нарушение.

Пациенти с чернодробна недостатъчност: дозировката на Cetirizine се намалява според тежестта на заболяването; обикновено се приема 5 mg Cetirizine (1/2 филмирана таблетка) дневно.

Пациенти в напреднала възраст: дозата се определя според бъбречната функция.

Приемането на Alersan-Tchaikapharma не зависи от режима на хранене. Препоръчва се изпиване на по-големи количества недразнещи течности при поглъщане на филмираната таблетка.

4.3 Противопоказания

Cetirizine е противопоказан при:

- Данни за свръхчувствителност към cetirizine или някое от помощните вещества на продукта.
- Данни за свръхчувствителност към hydroxyzine.
- Пациенти с тежко бъбречно увреждане и креатининов клирънс под 10 ml/min.
- Не се препоръчва приемането на продукта по време на бременност или кърмене.

4.4 Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба
Повишено внимание се изисква при пациенти с бъбречни заболявания, чернодробна недостатъчност и при възрастни болни.

Не се препоръчва приемането на големи количества алкохол по време на лечението.

4.5 Лекарствени и други взаимодействия

Провеждани са фармакокинетични проучвания за взаимодействие на cetirizine с псевдоефедрин, циметидин, кетоконазол, еритромицин, и азитромицин. Не са установени фармакокинетични взаимодействия.

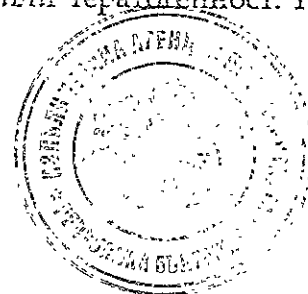
Едновременното приложение на cetirizine и макролиди или кетоконазол не води до клинично значими промени в ЕКГ.

Степента на абсорбция не се променя от храната, въпреки че скоростта е понижена.

Клирънса на Cetirizine може да бъде намален при съпътстващ прием на Theophylline (до 16%) с клинична проява на нежелани реакции на Cetirizine.

4.6 Бременност и кърмене

При опити с животни не са отчетени ембрио-токсичност или тератогенност. Няма достатъчно изследвания за прилагането върху хора.



Не се препоръчва приема на този лекарствен продукт от бременни, както и при кърмачки, тъй като cetirizine се екскретира в млякото.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Генерацията антихистамини, към която принадлежи и cetirizine, дава по-рядко сомнолентност в сравнение с лекарствените средства от генерация I. Обективни изследвания на психомоторната функция и способността за шофиране не са показали клинично значими ефекти при препоръчваната доза от 10mg дневно.

Въпреки това обаче, шофьорите на МПС, лицата, работещи с машини, изискващи повишено внимание или в опасни производства, които се лекуват с cetirizine трябва да бъдат предупреждавани за възможни странични действия. Употребата на алкохол и лекарствени средства, потискащи ЦНС успоредно с cetirizine може да доведе до допълнително понижаване на вниманието, умора и сънливост.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

За разлика от по-старите H1-рецепторни антагонисти, cetirizine прониква по-слабо в централната нервна система и води до значително по-слаба седация. Клиничните проучвания показват, че в препоръчваната доза, cetirizine причинява малко нежелани лекарствени реакции върху ЦНС, включващи сомнолентност, умора, замаяност и главоболие. В някои случаи е наблюдавано парадоксално стимулиране на ЦНС.

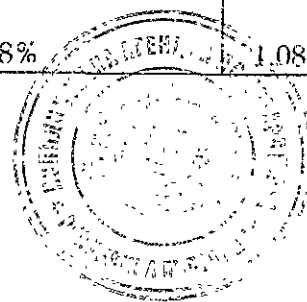
Въпреки, че cetirizine е селективен антагонист на периферните H1-рецептори и антихолинеричната му активност е сведена до минимум, са съобщени отделни случаи на микционни затруднения, нарушения в очната акомодация и сухота в устата (израз на холинолитичен ефект).

Наблюдавани са отделни случаи на нарушена чернодробна функция с увеличен билирубин и повишени стойности на чернодробните ензими. В повечето случаи тези промени се нормализират след прекратяване приема на лекарството.

Клинични проучвания

Данните за безопасност са предоставени след обобщаване на резултатите от редица двойно слепи, плацебо-контролирани клинични и/или фармакологични проучвания, обхващащи 3200 болни, лекувани с cetirizine при доза 10mg/дневно. Докладвани са следните нежелани лекарствени реакции с честота 1 и повече проценти:

Нежелани лекарствени реакции	Cetirizine 10mg (n=3260)	Placebo (n=3061)
Общи - умора	1.63%	0.95%
Нарушения на централната и периферна нервна система - замаяност, Главоболие, световъртеж	1.10% 7.42%	0.98% 8.07%
Нарушения на стомашно-чревния тракт - коремна болка, диспепсия, флатуленция,	0.98%	1.08%



сухота в устата, гадене	2.09% 1.07%	0.82% 1.14%
Психични нарушения – сомнолентност	9.63%	5.00%
Нарушения на дихателна система – фарингит	1.29%	1.34%

Въпреки статистически по-голямата честота в сравнение с плацебо, сомнолентността е била лека до умерена в по-голяма част от случаите. Обективни изследвания при други проучвания са демонстрирали, че ежедневната активност не се повлиява при препоръчаните дневни дози при млади и здрави доброволци.

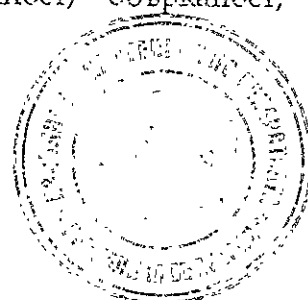
Нежеланите лекарствени реакции с честота от 1% и повече, при деца на възраст от 6 месеца до 12 години, наблюдавани при плацебо-контролирани и/или фармако-клинични проучвания са:

Нежелани лекарствени реакции	Cetirizine 10mg (n=3260)	Placebo (n=3261)
Общи - умора	1.0%	0.3%
Нарушения на стомашно-чревния тракт Диария	1.0%	0.6%
Психични нарушения – Сомнолентност	1.8%	0.6%
Нарушения на дихателната система – Ринит	1.4%	1.1%

Пост-маркетингови проучвания

В допълнение на нежеланите лекарствени реакции, наблюдавани по време на клиничните проучвания и изброени по-горе, в пост-маркетинговия период са съобщени други рядко срещани нежелани лекарствени реакции. Данните за тях обаче, са недостатъчни и не позволяват да се оцени честотата им. Те са разнообразни и се наблюдават от страна на всички органи и системи:

- Кръв: тромбоцитопения
- Сърдечно-съдова система: тахикардия
- Очи: нарушена акомодация, замъглено виждане
- Гастро-интестинален тракт: диария
- Общосоматични нарушения: астения, неразположение,
- Имунна система: анафилактичен шок и други алергични прояви;
- Черен дроб: нарушена чернодробна функция (повишени трансаминази, алкална фосфатаза, γ -GT, билирубин)
- Увеличение на телото
- Нервна система: конвулсии, парастезии, синкоп
- Психични нарушения: агресивност, тревожност, объркваност, депресия, безсъние
- Отделителна система: микционни смущения



- Кожа и кожни придатъци: ангионевротичен оток, дерматит, пруритус, еритематоза, уртикария

4.9 Предозиране

При възрастни, предозирането води до изразена сънливост, докато при деца то може да предизвика безпокойство и раздразнителност; възможни са симптоми на антихолинергичен ефект – задържане на урина, пресъхване на устата, диария, обърканост, замайване, умора, главоболие, неразположение, мидриаза, сърбеж, безпокойство, седация, сомнолентност, ступор, тахикардия и тремор.

Предозирането се третира по стандартна процедура, терапията е симптоматична и спомагателна, насочена към поддържането на жизнените функции.

Не е познат специфичен антидот.

При хемодиализа едва около 9% от предписаната доза може да се отдели.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

Фармакотерапевтична група: Антихистамини

5.1 Фармакодинамични свойства

Cetirizine е антихистаминов лекарствен продукт с продължително действие от второ поколение. Той селективно потиска периферните H₁-рецептори и подчертано не засяга холинергични, адренергични или серотонинови рецептори. Наред с класическия антихистаминов ефект на cetirizine, той има изразено противовъзпалително действие, като потиска сигнификантно експресията на адхезионните молекули върху епителните клетки (ICAM – 1), инхибира миграцията на възпалителните клетки (E₀, Leuc) и формирането на възпалителните инфилтрати. Потиска освобождаването на някои провъзпалителни левкотриени LTB₄ и LTC₄ и намалява общия брой на възпалителните клетки, както при IAR, така и при LAR. Cetirizine потиска сигнификантно “минималното персистиращо възпаление”.

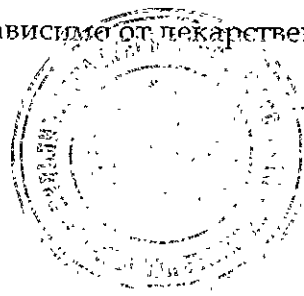
5.2 Фармакокинетични свойства

Cetirizine притежава линеен фармакокинетичен профит при дозировка от 5 до 60 mg. Терминалният полуживот е около 10 h и обема на разпределение е 0.50 l/kg. Не е наблюдаван кумулиране на cetirizine за 10 дни след прием на дневна доза от 10mg. Максималната steady-state плазмена концентрация е приблизително 300ng/ml и е достигната след 1.0 ± 0.5h. Свързването на cetirizine с плазмените протеини е 93 ± 0.3%. Cetirizine не променя свързването на плазмените протеини с warfarin.

Cetirizine не подлежи на продължителен first pass метаболизъм. Около две трети от дозата се екскретира непроменена в урината. Разпределението на фармакокинетичните параметри (като пиково ниво и зона под кривата) е еднакво при изследвани доброволци и не са наблюдавани разлики в кинетиката на cetirizine между бели и черни възрастни мъже.

Степента на абсорбция на cetirizine не се намалява от храна, независимо, че нивото на абсорбция се понижава.

Степента на бионаличност за cetirizine е еднаква, независимо от лекарствената форма – перорален разтвор, капсули или таблетки.



Специални популации:

Пациенти в напреднала възраст: При прием per os на единична доза от 10mg cetirizine полу-животът се повишава с около 50%, а клирънсът намалява с 40% при 16 пациенти в напреднала възраст, в сравнение с по-младите пациенти. Намалението на клирънса в напреднала възраст се дължи на понижената бъбречна функция.

Деца: Полу-животът на cetirizine при деца от 6-12 години е около 6 h, а при деца на възраст от 2 – 6 години е около 5 h. При кърмачета и деца от 6 до 24 месечна възраст, той е понижен до 3.1 часа.

Пациенти с бъбречни нарушения: Фармакокинетичният профил на cetirizine при пациенти с лека бъбречна недостатъчност (креатининов клирънс по-висок от 40 ml/min) е еднакъв с този при здрави доброволци. При пациенти с умерено бъбречно нарушение има трикратно увеличение на плазмения полу-живот и 70% намаление на клирънса, в сравнение със здрави доброволци.

При пациенти на хемодиализа (с креатининов клирънс по-малък от 7ml/min) след прием на еднократна перорална доза от 10mg cetirizine има трикратно увеличение на полу-живота и 70% намаление на клирънса в сравнение със здрави индивиди. Cetirizine слабо се елиминира при хемодиализа. Необходимо е индивидуално определяне на дозата при пациенти с умерено или тежко бъбречно нарушение (виж 4.2)

Пациенти с чернодробни нарушения: При пациенти с хронични чернодробни заболявания (хепатоцелуларна, холестатична и билиарна цироза) след прием на 10 или 20mg cetirizine се наблюдава увеличение на плазмения полу-живот с 50% и 40% намаление на клирънса в сравнение със здрави индивиди.

5.3 Предклинични данни за безопасност

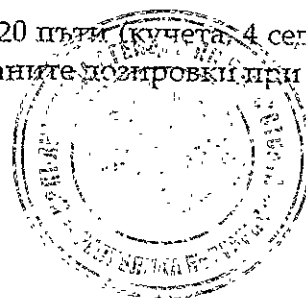
След остро перорално приложение на cetirizine максималната нелетална доза варира при различните животински видове от 500 пъти (при женски мишки) до 1600 пъти (при кучета) над препоръчаната терапевтична доза от 10mg на ден при възрастни (350 пъти via i.v. при кучета).

При лечение с повтарящи се перорални дози таргентният орган при гризачи е черният дроб (увеличение на теглото, хипертрофия на хепатоцитите и мастно натрупване). Нивата на cetirizine, които не предизвикват чернодробни промени са над 100 пъти над препоръчаните дози за клинична употреба.

Грябва да се отбележи, че cetirizine има доказан инхибиращ ефект върху чернодробните ензими само при мишки и плъхове, освен това пълносният фармакокинетичен профил при гризачите се различава от този при хора. Промените в чернодробните ензими са изцяло обратими след спиране на лечението.

При други животински видове (кучета, маймуни), които стоят по-близко по фармакокинетика до човека cetirizine няма чернодробни ефекти.

Нивата без ефект са 40 пъти (кучета, 6 месеца) до 75 – 220 пъти (кучета, 4 седмици) и 85 пъти (маймуни, 4 седмици) над клинично препоръчаните дози при хора.



Ефектите са били неспецифични: лека промяна в поведението, намаление на телесното тегло и др.

Проучванията върху репродуктивността не доказват специфичен токсичен ефект на cetirizine върху репродуктивната способност и развитието на новороденото. Нивата без ефект са 20 до 480 пъти (по отношение на фертилността при мишки) и 120 пъти (по време на перинаталният период при мишки) са над препоръчаната клинична доза при хора.

Cetirizine няма мутагенен и карциногенен ефект при хора.

При хистамин-индуциран бронхоспазъм на морски свинчета с i.v. дози над 200 пъти ED50, cetirizine не удължава QT интервала.

Cetirizine не засяга QT при кучета и маймуни, когато се приема перорално за една година при дневни дози съответно до 275 и 225 пъти над препоръчаната доза при хора.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества и техните количества:

За таблетката

Lactosum monohydricum.....	73.400 mg
Maydis amyllum.....	33.000 mg
Povidonum K 30.....	2.400 mg
Magnesii stearas.....	1.200 mg

За филмовото покритие

Hydroxypropylemethylcellulosum.....	3.450 mg
Macrogolum 6000.....	0.350 mg
Talcum.....	0.350 mg
Titanii dioxidum.....	0.800 mg
Dimeticoni emulsio.....	0.050 mg

6.2 Физико-химични несъвместимости

Не е известна несъвместимост на перорално приеман Cetirizine с друг лекарствен продукт.

6.3 Срок на годност

2 години.

6.4 Специални условия за съхранение

Да се съхранява на сухо място, недостъпно за деца, при температура под 25 °C.

6.5 Данни за опаковката

Всяка опаковка Alersan - Tchaikapharma 10 mg съдържа 10 или 20 филмирани таблетки, поставени в PVC/PVDC/AL блистери x 10 таблетки.

6.6 Препоръки при употреба



Продуктът е предназначен за перорален прием.

7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба:

“Чайка фарма – Висококачествените лекарства” АД
“Н.Й.Вапцаров” №1, гр. Варна 9000, България

8. Име и адрес на производителя:

“Чайка фарма – Висококачествените лекарства” АД
“Н.Й.Вапцаров” №1, гр. Варна 9000, България

или

“Чайка фарма – висококачествените лекарства” АД
бул. Санкт Петербург № 53 гр. Пловдив 4000, България

9. Регистрационен номер

20040562

10. Дата на първото разрешение за употреба на лекарствения продукт

07.12.2004

11. Дата на последна актуализация на текста

Ноември 2004г.

