

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Формация към Републиканска служба за употреба №	
642/15-07-03	<i>manf.</i>

## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

### ZYRTEC-D®

#### 1. Търговско име на лекарствения продукт

ZYRTEC-D®  
ЗИРТЕК-Д®

#### 2. Количествен и качествен състав

Всяка таблетка съдържа 5 mg cetirizine dihydrochloride с незабавно освобождаване и 120 mg pseudoephedrine hydrochloride с удължено освобождаване.  
За помощните вещества виж т. 6.1.

#### 3. Лекарствена форма

Таблетки с удължено освобождаване.

Бели до кремави, кръгли, двойно-изпъкнали таблетки.

#### 4. Клинични данни

##### 4.1 Показания

ZYRTEC-D® е показан за лечение на симптомите на сезонен и целогодишен алергичен ринит: назална конгестия, кихане, ринорея, назален и очен пруритус. Той трябва да се прилага когато са необходими както противоалергичните свойства на цетиризин хидрохлорид, така и активността на назалния деконгестант псевдоефедрин хидрохлорид.

##### 4.2. Дозировка и начин на употреба

Възрастни и деца над 12 години: 1 таблетка два пъти дневно (сутрин и вечер), с или без храна. Таблетките трябва да се приемат с течност, без да се дъвчат.

Нормално лечението не трябва да продължава повече от 2-3 седмици. При облекчаване на назалните симптоми, лечението с цетиризин трябва да продължи, ако е необходимо.

При пациенти с бъбречна недостатъчност, дозата трябва да бъде намалена на 1 таблетка дневно.

##### 4.3. Противопоказания

ZYRTEC-D® е противопоказан при пациенти с известна свръхчувствителност към някоя от съставките: псевдоефедрин или някой от пиперазините. ZYRTEC-D®, съдържайки симпатомиметик, е противопоказан също при пациенти с тежка хипертония или тежка коронарна болест, пациенти, приемащи MAO-инхибитори (включително предишните 2 седмици), пациенти с повишено вътреочно налягане или такива с ретенция на урината.

Употребата на ZYRTEC-D® при деца под 12 годишна възраст трябва да се избягва.



#### 4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

ZYRTEC-D® трябва да се прилага с повишено внимание при пациенти с диабет, хипертиреозидизъм, хипертония, тахикардия, аритмия, бъбречна или чернодробна недостатъчност, както и при пациенти в напреднала възраст. Необходимо е внимание и при пациенти, приемащи симпатомиметици (деконгестанти, апетитоподтискащи средства, психостимуланти, като амфетамини), трициклични антидепресанти и дигиталис. Както и при други централно действащи стимуланти, е била наблюдавана злоупотреба (привикване) с псевдофедрин.

#### 4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Не са наблюдавани клинично значими взаимодействия с цетиризин.

Едновременната употреба на симпатомиметични амини и MAO-инхибитори води до хипертонични кризи. Поради продължителното действие на MAO-инхибиторите, тези взаимодействия са възможни и 15 дни след спиране на лечението.

Симпатомиметичните амини могат да намалят антихипертензивните ефекти на бета-блокери и лекарствата с антимииметична активност, като метилдопа, гуанетидин и резерпин; *Виж т. 4.3 и т. 4.4.*

При едновременната употреба на псевдофедрин и дигиталис, може да се наблюдава нарастване активността на ектопичен пейсмейкър, ето защо прилагането на ZYRTEC-D® при дигитализирани пациенти трябва да се избягва.

Антиацидите увеличават степента на абсорбция на псевдофедрин, а каолина я намалява. Антихистамините подтискат кожно-алергичните тестове, ето защо преди тяхното провеждане е необходим достатъчен период от време за преминаване ефекта на антихистамините.

Богатата на мазнини храна не променя бионаличността на двете активни съставки, но води до редукция и забавяне на пиковата плазмена концентрация на цетиризин. Няма данни за значими фармакокинетични взаимодействия между цетиризин и псевдофедрин.

#### 4.6. Бременност и кърмене

В проучвания за репродуктивна токсичност при плъхове, нива от 40 mg/kg/ден (които са далеч от терапевтичните дози при човек) не са имали ефект. Поради ниските нива при системно приложение, при този вид, тези резултати не могат да послужат за демонстриране на безопасно приложение при бременни жени. Тъй като безопасността от приложението при бременни жени не е установена, това лекарство трябва да се избягва по време на бременност. Не се очаква вреден ефект, ако лекарството е прието по невнимание по време на бременност, но лечението трябва да се спре възможно най-бързо. Цетиризин и псевдофедрин се отделят в млякото и не трябва да се приемат от кърмещи жени.

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

Новите антихистамини, като цетиризин, се свързват с по-ниска честота на сомнолентност в сравнение с по-старите генерации. Обективните изследвания върху способността за шофиране, латентността на съня и психомоторната активност, не са показали клинично значими ефекти при препоръчаната доза.

Въпреки това, трябва да се отбележи, че съществуват вариации в тези ефекти при различните лекарства у отделните индивиди: по време на клиничните проучвания са докладвани субективни усещания за



сомнолентност. При дози по-високи от нормално препоръчаните, могат да се появят ефекти от страна на централната нервна система.

Не се очакват и не са докладвани отрицателни ефекти от псевдоефедрина.

Въпреки това, пациентите, възнамеряващи да шофират или работят с потенциално опасни машини, трябва да бъдат предупреждавани да не превишават препоръчаната доза.

#### 4.8. Нежелани лекарствени реакции

При контролирани клинични проучвания, нежеланите лекарствени реакции, докладвани при над 1% от пациентите, приемащи комбинацията цетиризин/псевдоефедрин, не са били различни от тези, наблюдавани при самостоятелното приложение на цетиризин или псевдоефедрин. Те включват: сухота в устата, главоболие, безсъние, сомнолентност, астения, тахикардия, нервност, замаяност, вертиго и гадене. Симптомиметичните средства са свързани и с някои нежелани реакции, включващи страх, тревожност, напрегнатост, безпокойство, тремор, слабост, бледност, затруднено дишане, дизурия, халюцинации, конвулсии, подтискане на ЦНС, аритмии, кардиоваскуларен колапс с хипотония.

Могат да възникнат и реакции на свръхчувствителност, включващи кожни реакции и ангиоедема.

#### 4.9. Предозиране

Острото предозиране със ZYRTEC-D® може да доведе до тахикардия, аритмия, хипертензия, признаци на подтискане (седация, апнея, безсъзнание, цианоза и кардиоваскуларен колапс) или стимулиране на ЦНС (безсъние, халюцинации, тремор, гърчове), които могат да бъдат фатални. Лечението, за предпочитане болнично, трябва да бъде симптоматично и поддържащо, като се имат предвид всички едновременно прилагани лекарства. Ако не настъпи спонтанно повръщане, то трябва да се предизвика. Препоръчва се правене на стомашна промивка.

Няма специфичен антидот. Не трябва да се използват симптомиметични амини. Хипертонията трябва да се контролира с алфа-блокери, а тахикардията с бета-блокери. Припадъкът може да се лекува с интравенозно прилагане на диазепам (или диазепам, приложен ректално при деца).

Цетиризин и псевдоефедрин не се елиминират ефективно чрез хемодиализа.

### 5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

#### 5.1. Фармакодинамични свойства

Фармакодинамичната активност на ZYRTEC-D® (ATC code R06AE00) представлява сумарния ефект от активността на всяка от съставките. Цетиризин е мощен и селективен антагонист на H1-рецепторите, с допълнителни анти-алергични свойства: той инхибира хистамин-свързаната ранна фаза на алергичната реакция, като редуцира и миграцията на някои клетки на възпалението и освобождаването на някои от медиаторите, свързани с късния алергичен отговор; той инхибира хистамин или полен-индуцираните реакции при провокираните назални тестове.

Псевдоефедрин е активен орален симптомиметичен амин с преобладаване на алфа-миметичната активност над бета-миметичната такава; поради вазоконстрикторната си активност, той има деконгестивен ефект върху назалната лигавица.



## 5.2. Фармакокинетични свойства

След орално приложение, цетиризин се абсорбира бързо и почти напълно.

Максимални плазмени концентрации обикновено се достигат в рамките на 1 час, при нормални условия.

Цетиризин не се подлага на значителен *first pass метаболизъм*.

След многократно орално приложение, дневната екскреция на непроменен цетиризин е приблизително 65% от дозата. Абсорбцията и елиминирането на цетиризин не зависят от дозата. Интер- и интра-индивидуалните вариации са малки. Плазменото време на полу-елиминиране е приблизително 9 часа и нараства при пациенти с понижена бъбречна функция.

Цетиризин се свързва в голяма степен с плазмените протеини (93%). Има малък обем на разпределение: приблизително 0.5 l/kg.

Псевдофедринът в състава на ZYRTEC-D® се освобождава постепенно, като достига максимални плазмени нива 3 до 5 часа след приема. Той се отделя главно непроменен с урината. Степента на отделяне с урината нараства при понижаване рН на урината и намалява при алкализиране на урината.

След многократно орално приложение (всеки 12 часа) времето на полу-елиминиране е приблизително 9 часа.

Богатата на мазнини храна не променя бионаличността на двете активни съставки, но води до редукция и забавяне на пиковата плазмена концентрация на цетиризин. Няма данни за значими фармакокинетични взаимодействия между цетиризин и псевдофедрин.

При пациенти с бъбречна недостатъчност, дозата трябва да се намали наполовина от обикновено препоръчаната.

## 5.3. Предклинични данни за безопасност

Проучванията при животни не са показали токсичност при нива  $\geq 30$  mg/kg/day при плъхове и 40 mg/kg/day при маймуни (*Супомолгус monkey*) ( $\geq 8$  и 11 пъти над препоръчаните дози при хора). Системната наличност при тези дози е била по висока при маймуните, но по-ниска при плъховете, в сравнение с тази при човека. В проучвания за репродуктивна токсичност при плъхове, нива от 40 mg/kg/day не са оказали ефект. Поради ниските нива при системно приложение, при този вид, тези резултати не могат да послужат за демонстриране на безопасно приложение при бременни и кърмещи жени.

Комбинацията цетиризин/псевдофедрин няма мутагенен и кластогенен потенциал, ето защо не се очаква канцерогенен риск при хора.

## 6. Фармацевтични данни

### 6.1 Списък на помощните вещества:

Помощни вещества:	<i>core first layer</i>	
Hypromellose		120.00 mg
Microcrystalline cellulose		57.00 mg
Colloidal anhydrous silica		1.50 mg
Magnesium stearate		1.50 mg
	<i>core second layer</i>	
Lactose monohydrate		43.23 mg
Microcrystalline cellulose		19.15 mg
Croscarmellose sodium		1.40 mg



Colloidal anhydrous silica	0.52 mg
Magnesium stearate	0.70 mg
Филмово покритие	
Opadry Y-1-7000	11.10 mg
<i>Hypromellose (E 464)</i>	
<i>Titanium dioxide (E 171)</i>	
Macrogol 400	

## 6.2. Физико-химични несъвместимости

Не са известни.

## 6.3. Срок на годност

3 години.

## 6.4. Специални условия за съхранение

Няма специални условия за съхранение.

## 6.5 Данни за опаковката

14 броя таблетките са поставени в поливинилхлорид PVC-алуминиево фолио  
Да се съхранява под 25°C

## 6.6. Препоръки при употреба

Няма специални препоръки при употреба.

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

UCB Farchim S.A.

Z.I. de Planchy 10, Chemin de Croix Blanche, CH-1630 Bulle, Switzerland

### 7.1. Име и адрес на производителя

UCB Farchim S.A. Z.I. de Planchy 10, Chemin de Croix Blanche, CH-1630 BULLE, Switzerland

UCB S.A. Pharma Sector Chemin du Foriest B-1420 Braine-L'Alleud, Belgium

UCB Pharma SpA Via Praglia 15 I – 10044 Pianezza (TO), Italy

## 8. Регистрационен № в регистъра по чл.28 от ЗЛАХМ

## 9. Дата на първо разрешаване за употреба на лекарствения продукт

4 септември 1995

## 10. Дата на (частична) актуализация на текста

Ноември 1999г.

