

*Version 7.2, 10/2006*  
*Rev.1 07/2008*

**ПРИЛОЖЕНИЕ I**  
**КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА**

## 1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

TALERT 10 mg/10 ml syrup  
ТАЛЕРТ 10 mg/10 ml сироп

|                                                  |                    |
|--------------------------------------------------|--------------------|
| <b>ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА</b>       |                    |
| Кратка характеристика на продукта - Приложение 1 |                    |
| Към РУ                                           | 11-3849 / 19.12.08 |
| Одобрено:                                        | 21 / 29.07.08      |

## 2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

В 10 ml сироп се съдържа активно вещество цетиризинов дихидрохлорид (cetirizine dihydrochloride) 10 mg.

Помощни вещества: метил парахидроксибензоат, пропил парахидроксибензоат.

За пълния списък на помощните вещества, виж точка 6.1.

## 3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Сироп

Бистра сироповидна течност с жълтокафяв цвят и специфичен екзотик мирис.

## 4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

### 4.1 Терапевтични показания

- За облекчаване симптомите на сезонен и целогодишен алергичен ринит, протичащ с ринорея, сърбеж в носа и кихане, назална конгестия и постназален дрип, както и неназални симптоми, изразени с конюнктивит;
- Уртикария от различен произход, вкл. хронична идиопатична уртикария, различни видове пруритус.

### 4.2 Дозировка и начин на приложение

Сиропът се приема перорално.

Възрастни и деца над 12-годишна възраст: 10 ml (10 mg) дневно.

Деца на възраст от 6 до 12 години: по 5 ml 2 пъти дневно или 10 ml еднократно дневно.

Деца от 2 до 6 години: 5 ml (5 mg) дневно (5 ml еднократно или по 2,5 ml двукратно дневно).

Не се препоръчва използването му при деца до 2-годишна възраст.

**Максимална дневна доза - 10 mg (10 ml).**

Пациенти над 65-годишна възраст

Засега няма данни, които да налагат намаляване на дозата при пациенти в напреднала възраст при нормална бъбречна функция.

Пациенти с нарушена бъбречна функция

В случай на нарушена бъбречна функция дозата на цетиризин трябва да се намали, като при креатининов клирънс от 11 до 31 ml/min се препоръчва 5 mg (5 ml) дневно.

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

Пациенти с бъбречни и чернодробни нарушения

При възрастни и деца над 12-годишна възраст с намалена бъбречна функция и влошена чернодробна функция дозата се намалява на 5 mg (5 ml) еднократно дневно.

Деца от 6 до 11-годишна възраст с нарушения на бъбречната и чернодробна функция: не се препоръчва назначаването на цетиризин.

Продължителността на лечението зависи от характера на лекуваното заболяване.

### **4.3 Противопоказания**

- Свръхчувствителност към цетиризин, някое от помощните вещества или хидроксизин;
- Деца под 2-годишна възраст.

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

Препоръчаната доза не трябва да се превишава.

- При пациенти с бъбречни и/или чернодробни нарушения и при пациенти на хемодиализа дозата се редуцира наполовина - 5 mg (5 ml) дневно.
- Сиропът не се препоръчва при деца с нарушения на бъбречната и чернодробна функция на възраст от 6 до 11 години.
- При персистиране на симптоматиката е необходима консултация с лекуващия лекар.
- Сиропът съдържа като помощни вещества метил- и пропил парахидроксилбензоат, които макар и рядко, могат да причинят алергични реакции (възможно е да са от забавен тип).
- Сиропът съдържа аспартам, източник на фенилаланин. Може да е вреден за хора с фенилкетонурия.

### **4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие**

Досега не са известни взаимодействия с други лекарства.

Проведените проучвания за взаимодействие на цетиризин с псевдоефедрин, циметидин, кетоназол, еритромицин и азитромицин не показват наличие на фармакокинетични взаимодействия.

В проучвания с многократно приложение на теофилин (дозировка 400 mg дневно) и цетиризин е установено слабо намаление (16%) клирънса на цетиризин.

Проучвания на цетиризин и циметидин, диазепам и псевдоефедрин не са показали нежелани фармакодинамични взаимодействия.

В терапевтични дози не са наблюдавани клинично значими взаимодействия с алкохол (при концентрация на алкохол в кръвта 0,5 g/l). Въпреки това се препоръчва повишено внимание при едновременно приемане на алкохол.

### **4.6 Бременност и кърмене**

#### **Бременност**

При проучвания върху експериментални животни не са установени неблагоприятни въздействия върху плода и фертилитета. Поради липса на добре контролирани проучвания при бременни жени не се препоръчва употребата му по време на бременност.

#### **Кърмене**

Цетиризин се екскретира в кърмата, поради което не трябва да се прилага в периода на кърмене. В случаите на наложителна употреба кърменето трябва да се преустанови.

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

По време на лечение с Талерт може да се наблюдава нарушение на акомодацията, замъглено виждане, умора, сънливост, главоболие, замаяност, поради което се препоръчва да не се превишава предписваната дневна доза при необходимост от шофиране и извършване на работа, изискваща повишено внимание.

### **4.8 Нежелани лекарствени реакции**

В терапевтични дози цетиризин се понася добре от пациентите и нежелани лекарствени реакции се наблюдават рядко.

Умерено изразени и преходни нежелани лекарствени реакции:

Нарушения на нервната система – умора, сънливост, главоболие, замаяност.

Стомашно-чревни нарушения – сухота в устата, гастроинтестинален дискомфорт.

В тези случаи за облекчаване на симптоматиката дозата може да се раздели на 2 приема – по 5 ml сутрин и вечер.

В постмаркетингови проучвания са наблюдавани следните нежелани лекарствени реакции:

Кръвни и лимфни нарушения: много рядко ( $\leq 0,01\%$ ) - тромбоцитопения.

Сърдечно-съдовата система: рядко ( $\leq 0,1\%$  и  $> 0,01\%$ ) - тахикардия.

Очни нарушения: много рядко ( $\leq 0,01\%$ ) - нарушена акомодация и замъглено виждане.

Гастроинтестинални: нечести ( $\leq 1\%$  и  $> 0,1\%$ ) - диария.

Общосоматични нарушения: нечести ( $\leq 1\%$  и  $> 0,1\%$ ) – астения, неразположение, рядко ( $\leq 0,1\%$  и  $> 0,01\%$ ) – отоци.

Хепатобилиарни нарушения: рядко ( $\leq 0,1\%$  и  $> 0,01\%$ ) повишени стойности на трансаминазите, алкална фосфатаза,  $\gamma$ -GPT, билирубин.

Нарушения на нервната система: нечести ( $\leq 1\%$  и  $> 0,1\%$ ) – парестезии, рядко ( $\leq 0,1\%$  и  $> 0,01\%$ ) – конвулсии, много рядко синкоп.

Психични нарушения: нечести ( $\leq 1\%$  и  $> 0,1\%$ ) тревожност, рядко агресивност, обърканост, депресия, безсъние.

Урогенитални нарушения: много рядко микционни смущения.

Кожа и подкожнотъканни нарушения: нечести - сърбеж, обрив; редки - уртикария; много рядко - ангионевротичен оток, еритема мултиформе.

Новооткрити: увеличение на теглото.

## 4.9 Предозиране

### Симптоми

Симптомите на предозиране с цетиризин са основно от страна на ЦНС и холинолитични.

При дози, превишаващи най-малко 5 пъти обичайните, се появяват: обърканост, замаяване, умора, главоболие, общо неразположение, мидриаза, безпокойство, сънливост, диария; при по-тежките случаи – сомнолентност, ступор, тахикардия, тремор и ретенция на урината.

При децата най-често се наблюдава възбуда при предозиране.

### Лечение

Предизвиква се повръщане, може да се направи стомашна промивка, препоръчва се симптоматично и/или поддържащо лечение. Няма специфичен антидот. Елиминирането чрез хемодиализа не е ефективно.

## 5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

### 5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Антихистамини за системно приложение. Пиперазинови деривати. АТС код – R06A E07

Цетиризин е селективен  $H_1$ -рецепторен антагонист, който блокира хистаминовите  $H_1$ -рецептори в периферията. В незначителна степен антагонизира  $H_1$ -рецептори в централната нервна система. Антихолинергичното действие и антисеротониновия ефект на цетиризин не са значими. В терапевтични дози не оказва седативно действие и не предизвиква сънливост.

Оказва влияние на “ранния” хистаминозависим стадий на алергичната реакция и на “късния” клетъчен стадий, намалявайки миграцията на еозинофилите. Ограничава освобождаването на медиаторите, свързани с “късния” стадий на алергичната реакция.

В дози 10 mg 1 или 2 пъти дневно цетиризин инхибира късната миграция на клетките на възпалението (по-специално на еозинофилите) в кожата и конюнктивата на мястото на алергичната реакция при atopични пациенти.

Прилаган в доза 30 mg дневно той инхибира притока на еозинофилни клетки в бронхо-алвеоларната течност по време на късната фаза на бронхиална констрикция - резултат от инхалиране на алергени при астматични пациенти.

Цетиризин потиска късната фаза на възпалителната реакция, индуцирана при интрадермално приложение на каликреин при пациенти с хронична уртикария и ограничава експресията на адхезионните молекули – ICAM – 1 VCAM – 1, които са маркери на алергичното възпаление.

В дози от 5 до 10 mg инхибира обрива и зачервяването, резултат на високите концентрации на хистамин в кожата. Активността му персистира най-малко 24 часа след еднократен прием. При прекъсване на терапията с цетиризин и повторно приложение кожата възстановява своята нормална реактивност към хистамин след 3 дни.

Ефектите на останалите медиатори на алергичното възпаление или хистаминолибератори – PAF или субстанция Р също се потискат от цетиризин. При пациенти с прояви на студова алергия и дермографизъм цетиризин е високо ефективен.

## **5.2 Фармакокинетични свойства**

В дози от 5 до 60 mg цетиризин се характеризира с линейна фармакокинетика.

**Резорбция** – цетиризин се резорбира бързо в гастро-интестиналния тракт. Максимална плазмена концентрация се наблюдава между 30 и 60 минути след перорален прием на еднократна дневна доза 10 mg, което го определя като бързо действащ антихистаминов продукт. Максимална равновесна плазмена концентрация от порядъка на 300 ng/ml се достига на  $1,0 \pm 0,5$  h след перорален прием. Не кумулира. Степента на бионаличност на цетиризин не се повлиява от лекарствената форма и е еднаква при приложението на перорален разтвор, капсули и таблетки.

**Разпределение** - свързва се с плазмените протеини до 93%. Обемът на разпределение е 0,5 l/kg.

**Метаболизира** се чрез О-деалкилиране до метаболити с незначителна антихистаминна активност.

**Екскреция** - приблизително 70% от приетата доза се екскретира с урината (50% в непроменен вид) и само 10% чрез фецеса. Времето на полуживот ( $t_{1/2}$ ) е средно около 8,3 часа с общ клирънс на цетиризин приблизително 53 ml/min. При деца на възраст от 6 до 12 години  $t_{1/2}$  е 6 часа. При деца плазменият клирънс е значително по-висок, сравнен с този при възрастни.

Цетиризин не може да бъде елиминиран ефективно чрез хемодиализа.

## **5.3 Предклинични данни за безопасност**

В опити, проведени върху мишки, не се откриват доказателства за потискане на фертилитета или фетотоксичност при приложение на цетиризин в дози от 64 mg/kg, превишаващи 25 пъти терапевтичните дневни перорални дози при хора.

При изпитвания за канцерогенност, проведени на мишки и плъхове, не се установяват съществени различия в предизвикването на тумори в сравнение с контролната група. Данните от изследвания за канцерогенност не показват риск за човека.

## **6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ**

### **6.1 Списък на помощните вещества**

Натриев ацетат трихидрат, ледена оцетна киселина, глицерол, пропиленгликол, метил парахидроксибензоат, пропил парахидроксибензоат, аспартам, течна есенция „екзотик”.

### **6.2 Несъвместимости**

Не са установени

### **6.3 Срок на годност**

2 години

Срок на годност след отварянето на бутилката – до 1 месец.

#### **6.4 Специални условия на съхранение**

В оригиналната опаковка, на защитено от светлина място, при температура под 30°C.  
Да не се замразява.

#### **6.5 Данни за опаковката**

Сироп 120 ml в тъмна стъклена бутилка с алуминиева или полиетиленова капачка или в тъмна бутилка от полиетилен терефталат с полиетиленова капачка, заедно с мерителна чашка/лъжичка и листовка в картонена кутия.

#### **6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне**

Няма специални изисквания.

### **7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

СОФАРМА АД  
ул. Илиенско шосе 16, 1220 София, България

### **8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

### **9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

### **10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА**

Август 2008