

CÁPSULAS BLANDAS
 VIA ORAL

Cetirizet®

Cetirizina 10 mg Perlas

Composición

Cada cápsula blanda contiene:
 Cetirizina Diclhidrato.....10 mg.
 Excipientes.....c.s

Mecanismo de Acción

La cetirizina es un antihistamínico de segunda generación, que se caracteriza por su selectividad de acción y la consecuente disminución de efectos neurodepresores como sedación y somnolencia. Este efecto es debido probablemente al incremento en la polaridad de la molécula, que disminuye la distribución hacia el SNC y los efectos adversos potenciales a este nivel, comparado con los medicamentos de primera generación como la difenhidramina. La cetirizina es un metabolito de la hidroxizina, que actúa como un potente y selectivo inhibidor de los receptores periféricos H1 de la histamina (fase inmediata de la reacción alérgica); de esta forma impide la degranulación del mastocito, la migración de eosinófilos y otras células inflamatorias como neutrófilos y monocitos. Además, inhibe otros mediadores de la inflamación como PGD (prostaglandinas), PAF (factor activador de plaquetas), LTC4 (leucotrienos), y disminuye la adhesión molecular de eosinófilos a nivel endotelial. A la dosis recomendada, la cetirizina ha demostrado que mejora la calidad de vida de los pacientes con cuadros alérgicos.

Farmacocinética

-Absorción: La concentración plasmática en el estado de equilibrio es aproximadamente de 300 ng/ml y se alcanza en $1,0 \pm 0,5$ h. La distribución de los parámetros farmacocinéticos como la concentración máxima (Cmax) y el área debajo de la curva (AUC) es monocompartimental. El grado de absorción de la cetirizina no se reduce con la comida, aunque la velocidad de absorción disminuye.

-Distribución: El volumen aparente de distribución es 0,50 l/kg. La unión a proteínas plasmáticas de cetirizina es del $93 \pm 0,3$ %. La cetirizina no modifica la unión de la warfarina a proteínas.

-Biotransformación: La cetirizina no sufre mayoritariamente efecto de primer paso.

-Eliminación: La semivida terminal es aproximadamente 10 hs y no se observa acumulación de cetirizina después de dosis diarias de 10 mg durante 10 días. Dos terceras partes de la dosis se excreta sin modificación por la orina. -Linealidad / no linealidad: La cetirizina muestra una cinética lineal en el rango de 5 a 60 mg.

Poblaciones especiales

-Pacientes con insuficiencia renal: La farmacocinética del fármaco fue similar en pacientes con insuficiencia leve (aclaramiento de creatinina mayor de 40 ml/min) y voluntarios sanos. Los pacientes con insuficiencia renal moderada tuvieron un incremento de 3 veces en la semivida y una disminución del 70 % del aclaramiento comparado con voluntarios sanos. Los pacientes con hemodiálisis (aclaramiento de creatinina de menos de 7 ml/min) a los que se daba una única dosis oral de 10 mg de cetirizina, tuvieron un aumento de 3 veces en la semivida y una disminución del 70 % en el aclaramiento, comparados con los voluntarios sanos. La cetirizina se eliminaba poco por hemodiálisis. Es necesario el ajuste de dosis en pacientes con insuficiencia renal moderada o grave.

-Pacientes con insuficiencia hepática: Los pacientes con enfermedad hepática crónica (cirrosis hepatocelular, colestática y biliar) a los que se dio 10 ó 20 mg de cetirizina en una única dosis, tuvieron un incremento del 50 % en la semivida con una disminución de un 40 % en el aclaramiento comparado como los voluntarios sanos. Solo es necesario el ajuste de la dosis en pacientes con la función hepática dañada, si presentan daño renal concomitante.

-Pacientes de edad avanzada: Tras una única administración de una dosis oral de 10 mg a 16 pacientes de edad avanzada, la semivida aumentó un 50 % y el aclaramiento disminuyó en un 40 % en comparación con los pacientes más jóvenes. La disminución en el aclaramiento de la cetirizina es estos voluntarios parece relacionarse con la disminución de su función renal.

Indicaciones

La Cetirizina está indicada en niños a partir de 6 años, adolescentes y adultos para:

- El alivio de los síntomas nasales y oculares de rinitis alérgica estacional y perenne.
- El alivio de los síntomas de la urticaria crónica idiopática.

Posología

Una sola toma diaria produce alivio de los síntomas alérgicos las 24 horas. El momento de administración puede variar según las necesidades del paciente.

-Dosis habitual en adultos y niños mayores de 12 años: 1 cápsula blanda (10 mg), una vez por día.

Poblaciones especiales

-Pacientes de edad avanzada: Los datos no sugieren que se necesite reducir la dosis en pacientes de edad avanzada en los que la función renal es normal.

-Pacientes con insuficiencia renal de moderada a grave: No hay datos para documentar la relación eficacia/seguridad en pacientes con insuficiencia renal. Ya que la cetirizina se elimina mayoritariamente por vía renal, en casos en los que no se puede utilizar un tratamiento alternativo, se deberán individualizar los intervalos de dosificación de acuerdo con la función renal:

***Ajuste de dosis en pacientes con insuficiencia renal:**

Grupo	Aclaramiento de creatinina (ml/min)	Dosis y frecuencia
Normal	≥ 80	10 mg una vez al día
Leve	50 – 79	10 mg una vez al día
Moderada	30 – 49	5 mg una vez al día
Grave	< 30	5 mg una vez, cada 2
Enfermedad renal terminal/pacientes que precisan diálisis	< 10	Contraindicado

-Pacientes con insuficiencia hepática: El ajuste de la dosis sólo es necesario en pacientes con insuficiencia hepática, si se presenta una insuficiencia renal concomitante.

-Población pediátrica: La formulación en cápsulas blandas no debe utilizarse en niños, ya que la misma no permite realizar ajustes apropiados de la dosis. Se recomienda utilizar una formulación pediátrica de cetirizina.

Modo de Uso

Este producto se debe administrar por vía oral con suficiente agua, jugo o cualquier otra bebida sin alcohol. No se debe romper, masticar ni disolver la cápsula.

Contraindicaciones

Hipersensibilidad al principio activo, o a alguno de los excipientes, a la hidroxizina o a cualquier derivado piperazínico. Pacientes con insuficiencia renal grave con un aclaramiento renal inferior a 10 ml/min.

Efectos Colaterales

Los estudios clínicos han demostrado que cetirizina a la dosis recomendada tiene reacciones adversas menores sobre el SNC, incluyendo somnolencia, fatiga, mareo y dolor de cabeza. En algunos casos se ha notificado estimulación paradójica del SNC.

Aunque la cetirizina es un antagonista selectivo de los receptores periféricos H1 y está relativamente libre de actividad anticolinérgica, se han notificado casos aislados de dificultad para la micción, trastornos de la acomodación ocular y sequedad de boca.

Se han notificado casos de función hepática anormal con aumento de las enzimas hepáticas, acompañadas por aumento de la bilirrubina. Muchos de estos casos se resuelven tras la interrupción del

tratamiento.

Los siguientes efectos colaterales, se notificaron en una proporción igual o superior al 1,0 %, en los ensayos controlados con placebo:

- Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración: Fatiga. -Trastornos del sistema nervioso. Mareos, dolor de cabeza.
 - Trastornos gastrointestinales: Dolor abdominal, sequedad de boca, náuseas. -Trastornos psiquiátricos: Somnolencia.
 - Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos: Faringitis.
- Aunque estadísticamente más frecuente que en el grupo placebo, la somnolencia fue de leve a moderada en la mayoría de los casos. Las pruebas objetivas han demostrado que las actividades usuales diarias no se ven afectadas por la dosis diaria recomendada en voluntarios jóvenes sanos, como se demostró por otros estudios. Experiencia post-comercialización

Además de las reacciones adversas notificadas durante los ensayos clínicos y mencionadas anteriormente, en la experiencia post-comercialización se han descrito casos aislados de las siguientes reacciones adversas al fármaco.

- Trastornos de la sangre y del sistema linfático: Muy raros: trombocitopenia.
- Trastornos del sistema inmune: Raros: hipersensibilidad. Muy raros: shock anafiláctico.
- Trastornos del metabolismo y de la nutrición: No conocida: aumento del apetito.
- Trastornos psiquiátricos: Poco frecuentes: agitación. Raros: agresividad, confusión, depresión, alucinación, insomnio. Muy raros: tics. No conocida: ideas suicidas, pesadillas. -Trastornos del sistema nervioso: Poco frecuentes: parestesia. Raros: convulsiones. Muy raros: disgesia, síncope, temblor, distonía, discinesia. No conocida: amnesia, pérdida de memoria.
- Trastornos oculares: Muy raros: trastornos de la acomodación, visión borrosa, giro ocular. -Trastornos del oído y del laberinto: No conocida: vértigo. -Trastornos cardíacos: Raros: taquicardia. -Trastornos gastrointestinales: Poco frecuentes: diarrea. -Trastornos hepatobiliares: Raros: función hepática anormal (aumento de las transaminasas, fosfatasa alcalina, GT y bilirrubina)
- Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo: Poco frecuentes: prurito, sarpullido. Raros: urticaria. Muy raros: edema angioneurótico, eritema debido al fármaco. No conocida: pustulosis exantemática generalizada aguda.
- Trastornos musculoesqueléticos y del tejido conjuntivo: No conocida: artralgia. -Trastornos renales y urinarios: Muy raros: disuria, enuresis. No conocida: retención urinaria. -Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración: Poco frecuentes: astenia, malestar. Raros: edema.
- Exploraciones complementarias: Raros: aumento de peso.
- Descripción de las reacciones adversas seleccionadas: Tras la discontinuación de cetirizina, se han reportado casos de prurito (picoir) y/o urticaria.

Notificación de sospechas de reacciones adversas: Es importante notificar las sospechas de reacciones adversas al medicamento tras su autorización.

Ello permite una supervisión continuada de la relación beneficio/riesgo del medicamento. Se invita a los profesionales sanitarios a notificar las sospechas de reacciones adversas.

Precauciones y Advertencias

A dosis terapéuticas, no se ha demostrado interacción clínicamente significativa con alcohol (para un nivel de alcohol en sangre de 0,5 g/l).

Si embargo, se recomienda precaución si se toma concomitantemente. Debe tenerse precaución en los pacientes con factores que predispongan a la retención urinaria (por ejemplo lesión de la médula espinal, hiperplasia prostática), ya que la cetirizina puede aumentar el riesgo de retención urinaria. Se recomienda precaución en pacientes epilépticos y pacientes con riesgo de convulsiones. Las pruebas de la alergia son inhibidas por los antihistamínicos y necesitan un período de lavado (de 3 días) antes de realizarse. Prurito y/o urticaria puede aparecer al cesar el tratamiento con cetirizina incluso si los síntomas no aparecieron durante el mismo. En algunos casos, los síntomas pueden ser intensos y pueden requerir un reinicio del tratamiento. Los síntomas deberían remitir al reiniciar el mismo.

Uso durante el embarazo y la lactancia

-Embarazo: Para la cetirizina, los datos recolectados prospectivamente sobre los resultados del embarazo no sugieren un potencial de toxicidad materna o fetal / embrionaria, a por encima de las

tasas de referencia. Los estudios en animales no muestran efectos dañinos directos o indirectos sobre el embarazo, desarrollo embrional/fetal, parto o desarrollo postnatal. Debería prestarse atención en la prescripción a mujeres embarazadas.

-Lactancia: La cetirizina se excreta en la leche materna a concentraciones que representan al 25 % o 90% de las cantidades medidas en plasma, según el tiempo de muestreo tras la administración. Por lo tanto, se debe tener precaución cuando se prescribe cetirizina a mujeres lactantes.

Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas: Las medidas objetivas no han mostrado efectos clínicos relevantes de la cetirizina, a las dosis recomendadas de 10 mg, sobre la capacidad para conducir, la latencia al sueño y la respuesta motora. Por lo tanto, los pacientes que experimenten somnolencia deberían abstenerse de conducir, realizar actividades potencialmente peligrosas o utilizar maquinaria. No deberán exceder la dosis recomendada y deberán tener en cuenta su respuesta al medicamento.

Restricciones de Uso

Este producto se debe administrar con restricción a pacientes con antecedentes de insuficiencia renal y hepática, retención urinaria, y convulsiones.

Interacciones

Debido a la farmacocinética, farmacodinamia y al perfil de tolerancia de la cetirizina, no se esperan interacciones con este antihistamínico. De hecho, no se han notificado interacciones farmacodinámicas ni farmacocinéticas significativas en los estudios de interacción fármaco-fármaco desarrollados, especialmente con pseudoefedrina o teofilina (400 mg/día). La absorción de cetirizina no se reduce con la comida, aunque la velocidad de absorción disminuye. En pacientes sensibles, el uso concurrente de alcohol con otros depresores del SNC, pueden causar reducciones adicionales del estado de alerta y disminución del rendimiento, aunque la cetirizina no potencia el efecto del alcohol (niveles en sangre de 0,5 g/L).

Sobredosis

-Síntomas: Los síntomas observados después de una sobredosis de cetirizina están principalmente asociados con efectos sobre el SNC o con efectos que podrían sugerir un efecto anticolinérgico. Los efectos adversos notificados después de la ingesta de al menos 5 veces la dosis diaria recomendada son: confusión, diarrea, mareo, fatiga, dolor de cabeza, malestar, midriasis, prurito, nerviosismo, sedación, somnolencia, estupor, taquicardia, temblor y retención urinaria.

-Tratamiento: No hay un antídoto conocido específico para cetirizina. De producirse una sobredosis con este fármaco, se recomienda un tratamiento sintomático o de apoyo. El lavado gástrico se podrá realizar tras una ingesta reciente del medicamento. La cetirizina no se elimina de forma efectiva por hemodiálisis.

Ante la eventualidad de una sobredosis, concurrir al hospital más cercano, o al Centro Nacional de Toxicología, en Emergencias Médicas, sito en Avda. Gral. Santos y T. Mongelos. Tel.: (595-21) 220 418Asunción - Paraguay.

Presentación

Caja conteniendo 10 cápsulas blandas.
Caja conteniendo 30 cápsulas blandas.

**Almacenar a temperatura ambiente (inferior a 30° C).
Mantener fuera del alcance de los niños.**

 **DIVISIÓN
ETICOS | PHARMALER**

Elaborado por **Swiss Pharma Group S.A.**

Zapadoresdel Chaco e/ Abraham Lincoln y Lope de Vega
San Lorenzo - Paraguay.

Para **Laboratorio de Productos ETICOS C.E.I.S.A.**

Atilio Galfre N° 151 y Calle 1 - San Lorenzo, Paraguay

Tel.: (595-21) 521 390 (R.A.) Fax: (595-21) 521 389

laboratorio@eticos.com.py - www.eticos.com.py

D.T.: Q.F. Myriam Cabriza de Paredes - Reg. N° 2837

Autorizado en Paraguay por el M.S.P. y B.S.

315475-001

