

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

РОЛІНОЗ
(ROLINOZ)

Склад:

діюча речовина: цетиризин;

1 таблетка, вкрита плівковою оболонкою, містить цетиризину дигідрохлориду 10 мг;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна; лактоза, моногідрат; кремнію діоксид колоїдний безводний; натрію крохмальгліколят (тип А); магнію стеарат;

плівкове покриття: Opadry® II White 85F18422 (спирт полівініловий, титану діоксид (E 171), макрогол, тальк).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Основні фізико-хімічні властивості: довгасті таблетки, вкриті плівковою оболонкою від білого до майже білого кольору, з розподільчою рискою з обох боків.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні засоби для системного застосування. Похідні піперазину. Код АТХ R06A E07.

Фармакологічні властивості

Фармакодинаміка

Цетиризин, метаболіт гідроксизину, є потужним селективним антагоністом периферичних H₁-рецепторів. У дослідженнях зв'язування з рецепторами *in vitro* не спостерігалось значної спорідненості з іншими рецепторами, окрім H₁-рецепторів.

Окрім антагоністичного впливу на H₁-рецептори, цетиризин чинить антиалергічну дію: у дозі 10 мг 1 або 2 рази на добу цетиризин інгібував пізню фазу міграції клітин, які беруть участь у запальній реакції (переважно еозинофілів), у шкірі та кон'юнктиві осіб з atopією, яким вводили антиген.

У дозах 5 мг та 10 мг цетиризин інтенсивно інгібує виникнення пухирців та почервоніння, спричинених дуже високими концентраціями гістаміну у шкірі, хоча співвідношення з ефективністю не встановлено.

Застосування цетиризину пацієнтам з алергічним ринітом та таким супутнім захворюванням як бронхіальна астма (від легкої до помірної за тяжкістю), у дозі 10 мг 1 раз на добу покращувало стан при симптомах риніту та не впливало на функцію легень, підтверджує безпеку застосування цетиризину хворим на бронхіальну астму легкого та помірного ступеня тяжкості.

Застосування цетиризину у високій добовій дозі 60 мг протягом тижня не спричиняло статистично значущої пролонгації інтервалу QT.

При прийомі у рекомендованих дозах цетиризин покращував стан пацієнтів із цілорічним та сезонним алергічним ринітом.

У дітей віком від 5 до 12 років толерантності до антигістамінної дії цетиризину (пригнічення виникнення пухирців та почервоніння) не спостерігалось. Якщо лікування цетиризином припинити після повторного прийому, реактивність шкіри до гістаміну відновлюється протягом 3 діб.

Фармакокінетика

Цетиризин проявляє лінійну кінетику при дозуванні від 5 мг до 60 мг.

Абсорбція

Рівноважна максимальна концентрація цетиризину у плазмі крові становить майже 300 нг/мл і досягається протягом 1 ± 0,5 години. Розподіл фармакокінетичних параметрів, таких як пікові концентрації у плазмі крові (C_{max}) та площа під кривою (AUC), є однорідним. Об'єм абсорбції цетиризину не зменшувався при одночасному прийомі з їжею, хоча швидкість абсорбції зменшувалася. Біодоступність подібна при застосуванні цетиризину у формі розчину, капсул або таблеток.

Розподіл

Видимий об'єм розподілу цетиризину становить 0,5 л/кг. Зв'язування з білками плазми крові – 93 ± 0,3 %. Цетиризин не впливає на зв'язування варфарину з білками крові.

Метаболізм

Цетиризин не зазнає екстенсивного метаболізму при першому проходженні.

Виведення

Приблизно $\frac{2}{3}$ дози цетиризину виводиться у незміненому вигляді із сечею. Кінцевий період напіввиведення становить приблизно 10 годин. При застосуванні у добовій дозі 10 мг протягом 10 днів кумуляції цетиризину не спостерігалось.

Окремі групи пацієнтів

Пацієнти з порушенням функцій печінки

У пацієнтів з хронічними захворюваннями печінки (гепатоцелюлярний, холестатичний та біліарний цироз) після прийому 10 мг або 20 мг цетиризину у вигляді разової дози спостерігалось збільшення періоду напіввиведення на 50 % та зниження кліренсу на

40 % порівняно зі здоровими добровольцями. Корекція дозування пацієнтам із порушенням функцій печінки необхідна лише тоді, коли у таких пацієнтів є одночасно і порушення функції нирок.

Пацієнти з порушенням функцій нирок

Фармакокінетика цетиризину була подібною у пацієнтів із легким ступенем порушення функцій нирок (кліренс креатиніну вище 40 мл/хв) та у здорових добровольців. У пацієнтів із помірним ступенем порушення функцій нирок спостерігалось збільшення періоду напіввиведення у 3 рази та зниження кліренсу – на 70 % порівняно зі здоровими добровольцями. У пацієнтів, яким проводили гемодіаліз (кліренс креатиніну 7 мл/хв), після застосування 10 мг цетиризину перорально спостерігалось збільшення періоду напіввиведення у 3 рази та зниження кліренсу на 70 % порівняно зі здоровими добровольцями. Цетиризин погано виводиться при гемодіалізі. Пацієнтам із порушенням функцій нирок помірного ступеня необхідно коригувати дозування цетиризину. Застосування цетиризину пацієнтам із тяжким ступенем порушення функцій нирок протипоказане.

Пацієнти літнього віку

Після разового перорального прийому цетиризину у дозі 10 мг період напіввиведення у таких пацієнтів збільшувався майже на 50 %, а кліренс знижувався приблизно на 40 % порівняно з молодшими особами. Зниження кліренсу цетиризину було пов'язане з послабленою функцією нирок.

Діти

Період напіввиведення цетиризину становив майже 6 годин у дітей віком 6–12 років та 5 годин у дітей віком 2–6 років. У дітей віком від 6 до 24 місяців цей показник скорочений до 3,1 години.

Клінічні характеристики

Показання

Лікарський засіб Роліноз показаний дорослим та дітям віком від 6 років:

- для полегшення назальних та очних симптомів сезонного та цілорічного алергічного риніту;
- для полегшення симптомів хронічної ідіопатичної кропив'янки.

Протипоказання

- Гіперчутливість до діючої речовини, інших допоміжних речовин лікарського засобу, до гідроксизину або до будь-яких похідних піперазину в анамнезі.
- Термінальна стадія ниркової недостатності (швидкість клубочкової фільтрації (ШКФ) < 15 мл/хв).

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій

Виходячи з фармакокінетики, фармакодинаміки та показників толерантності цетиризину, виникнення будь-яких видів взаємодій при прийомі цього антигістамінного засобу малоімовірно.

Зокрема дослідження взаємодії лікарських засобів не показали ні фармакодинамічної, ні будь-якої суттєвої фармакокінетичної взаємодії при одночасному прийомі із псевдоефедрином або теофіліном (400 мг/добу).

Рівень абсорбції цетиризину не знижується при вживанні їжі, хоча швидкість абсорбції зменшується. Одночасне застосування цетиризину з алкоголем або іншими депресантами центральної нервової системи (ЦНС) у чутливих пацієнтів може спричинити додаткове зниження уваги та здатності до виконання роботи, хоча цетиризин не потенціює ефект алкоголю (при рівнях алкоголю у крові 0,5 г/л).

Особливості застосування

Антигістамінні засоби, у тому числі цетиризин, пригнічують відповідь на шкірну алергічну пробу, тому перед її проведенням прийом лікарського засобу слід припинити за 3 доби до дослідження (період виведення).

Повідомляли про розвиток свербіжів та/або кропив'янки після припинення застосування цетиризину, навіть якщо раніше ці симптоми не спостерігалися. У деяких випадках вони можуть бути інтенсивними, що потребує відновлення прийому цетиризину. Симптоми повинні зникнути після початку повторного лікування.

При застосуванні цетиризину у терапевтичних дозах не спостерігалось клінічно значущих взаємодій з алкоголем (при рівнях алкоголю у крові 0,5 г/л). Проте у разі вживання алкоголю під час застосування лікарського засобу слід дотримуватися обережності.

Лікарський засіб слід застосовувати з обережністю пацієнтам, схильним до затримки сечі (пошкодження хребта, гіперплазія простати), з епілепсією та з ризиком виникнення судом.

Лікарський засіб містить лактозу, тому пацієнтам з рідкісною спадковою непереносимістю галактози, лактазною недостатністю або порушенням всмоктування глюкози-галактози не слід його застосовувати.

Застосування у період вагітності або годування груддю

Період вагітності

Проспективно зібрані дані для цетиризину щодо результатів вагітності не вказують на потенційну токсичність для матері або плода / ембріона. Дослідження на тваринах не вказують на прямий або непрямий шкідливий вплив на вагітність, ембріональний / фетальний розвиток, пологи або постнатальний розвиток. У період вагітності лікарський засіб слід застосовувати з обережністю.

Період годування груддю

Цетиризин проникає у грудне молоко у концентраціях, що становлять 25–90 % від концентрацій у плазмі крові залежно від проміжку часу після його застосування. У період годування груддю лікарський засіб слід застосовувати з обережністю.

Фертильність

Доступні дані про вплив на фертильність людини обмежені, проте негативного впливу на фертильність не виявлено.

Дослідження на тваринах не виявили негативного впливу на фертильність.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами

Об'єктивне визначення здатності керувати автотранспортом, латентності сну та здатності працювати на складальному конвеєрі не показало клінічно значущого впливу цетиризину при його застосуванні у рекомендованій дозі 10 мг.

Пацієнтам, які керують автотранспортом або іншими механізмами, не слід перевищувати рекомендовані дози та слід враховувати реакцію власного організму на лікарський засіб. Пацієнтам, які відчують сонливість, слід утриматися від керування автотранспортом або іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози

Спосіб застосування

Лікарський засіб призначений для перорального застосування. Таблетки слід ковтати, запиваючи 1 склянкою води.

Дозування

Дорослі

Лікарський засіб слід застосовувати у дозі 10 мг (1 таблетка) 1 раз на добу.

Педіатрична популяція

Діти віком від 6 до 12 років

Лікарський засіб слід застосовувати у дозі 5 мг (½ таблетки) 2 рази на добу.

Діти віком від 12 років

Лікарський засіб слід застосовувати у дозі 10 мг (1 таблетка) 1 раз на добу.

Дітям із порушенням функції нирок дозування коригувати індивідуально, залежно від значення кліренсу креатиніну пацієнта, віку та маси тіла.

Пацієнти літнього віку

За умови нормальної функції нирок таким пацієнтам немає необхідності коригувати дозування лікарського засобу.

Пацієнти з порушенням функції печінки

Таким пацієнтам немає необхідності коригувати дозування. Пацієнтам з порушенням функції печінки та нирок рекомендується коригувати дозування лікарського засобу (див. нижче розділ «Пацієнти із порушенням функції нирок»).

Пацієнти з порушенням функції нирок

Не існує підтверджених документально даних щодо співвідношення ефективність / безпека для пацієнтів з порушенням функцій нирок. Оскільки цетиризин головним чином виводиться нирками, у разі якщо не може бути застосовано альтернативне лікування, дозування має бути індивідуальним, залежно від стану функцій нирок. Слід звернутися до таблиці, наведеної нижче, та відкоригувати дозу відповідно до наведеної інформації.

<i>Стан функції нирок</i>	<i>ШКФ (мл/хв)</i>	<i>Дозування та частота</i>
Нормальна функція	≥ 90	10 мг 1 раз на добу
Легкий ступінь порушення	60 – < 90	10 мг 1 раз на добу
Помірний ступінь порушення	30 – < 60	5 мг 1 раз на добу
Тяжкий ступінь порушення	15 – < 30 не потребують діалізу	5 мг 1 раз на 2 доби
Термінальна стадія ниркової недостатності	< 15 потребують діалізу	Протипоказано

Діти

Застосування лікарського засобу у формі таблеток не рекомендується дітям віком до 6 років, оскільки ця лікарська форма не дає змоги проводити необхідну корекцію режиму дозування.

Передозування

Симптоми

Симптоми, що спостерігалися після суттєвого передозування цетиризину, головним чином пов'язані з впливом на ЦНС або з ефектами, що можуть вказувати на антихолінергічну дію. Побічні реакції, про які повідомляли після прийому дози, що перевищувала щонайменше у 5 разів рекомендовану добову дозу, включають: сплутаність свідомості, діарею, запаморочення, підвищену втомлюваність, головний біль, нездужання, мідріаз, свербіж, неспокій, седацію, сонливість, ступор, тахікардію, тремор, затримку сечовипускання.

Лікування

При передозуванні слід проводити симптоматичну та підтримувальну терапію. Можна провести промивання шлунка. Діаліз не є ефективним методом для виведення цетиризину. Специфічний антидот цетиризину невідомий.

Побічні реакції

Відомо, що цетиризин при застосуванні у рекомендованих дозах має незначний побічний вплив на ЦНС, що включає сонливість, підвищену втомлюваність, запаморочення та головний біль. У деяких випадках повідомляли про парадоксальну стимуляцію ЦНС.

Хоча цетиризин є селективним антагоністом периферичних H_1 -рецепторів та майже не чинить антихолінергічної дії, повідомляли про поодинокі випадки виникнення утруднення сечовипускання, порушення акомодатії ока, сухості у роті.

Повідомляли про випадки порушення функції печінки, які характеризувалися підвищеними рівнями ферментів печінки, що супроводжувалися підвищеним рівнем білірубіну. Зазвичай стан нормалізувався після припинення прийому лікарського засобу.

Повідомляли про такі побічні реакції, які виникали під час досліджень цетиризину, не менш ніж у 1 % пацієнтів:

з боку психіки – сонливість;

з боку нервової системи – запаморочення, головний біль;

з боку дихальної системи, органів грудної клітки та середостіння – фарингіт;

з боку травного тракту – біль у животі, сухість у роті, нудота;

загальні порушення – підвищена втомлюваність.

Хоча з точки зору статистики сонливість виникала частіше, ніж у групі плацебо, у більшості випадків вона була легкою або помірною ступеня. Як і під час проведення інших досліджень, результати об'єктивних досліджень підтвердили, що прийом рекомендованої добової дози не спричиняє негативного впливу на повсякденну діяльність у здорових досліджуваних.

Повідомляли про такі побічні реакції, які виникали під час досліджень цетиризину, не менш ніж у 1 % дітей віком від 6 місяців до 12 років:

з боку психіки – сонливість;

з боку дихальної системи, органів грудної клітки та середостіння – риніт;

з боку травного тракту – діарея;

загальні порушення – підвищена втомлюваність.

Під час застосування цетиризину також повідомляли про розвиток нижчезазначених побічних реакцій. Побічні реакції вказані за класами систем органів згідно з MedDRA (Медичний словник термінів для регулятивної діяльності), та за частотою: дуже часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$); рідко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$); дуже рідко ($< 1/10000$); невідомо (частоту не можна визначити за наявними даними).

З боку системи крові та лімфатичної системи:

дуже рідко – тромбоцитопенія.

З боку імунної системи:

рідко – реакції гіперчутливості; дуже рідко – анафілактичний шок.

З боку метаболізму та харчування:

невідомо – підвищений апетит.

З боку психіки:

нечасто – ажитація; рідко – агресивність, сплутаність свідомості, депресія, галюцинації, безсоння;

дуже рідко – тик; невідомо – суїцидальні думки, нічні жахи.

З боку нервової системи:

нечасто – парестезія; рідко – судоми; дуже рідко – дисгевзія, дискінезія, дистонія, синкопе, тремор;

невідомо – амнезія, порушення пам'яті.

З боку органів зору:

дуже рідко – порушення акомодатії, нечіткість зору, мимовільні рухи очного яблука.

З боку органів слуху та рівноваги:

невідомо – вертиго.

З боку серця:

рідко – тахікардія.

З боку травного тракту:

нечасто – діарея.

З боку гепатобіліарного тракту:

рідко – порушення функцій печінки (підвищення рівня трансаміназ, лужної фосфатази, γ -глутамілтрансферази та білірубіну); невідомо – гепатит.

З боку шкіри та підшкірної клітковини:

нечасто – свербіж, висипання; рідко – кропив'янка; дуже рідко – ангіоневротичний набряк, місцеві медикаментозні висипання; невідомо – гострий генералізований екзантематозний пустульоз.

З боку скелетно-м'язової системи та сполучної тканини:

невідомо – артралгія, міалгія.

З боку нирок та сечовивідної системи:

дуже рідко – дизурія, енурез; невідомо – затримка сечі.

Загальні порушення:

нечасто – астенія, нездужання; рідко – набряк.

Обстеження:

рідко – збільшення маси тіла.

Після припинення застосування цетиризину повідомляли про випадки інтенсивного свербіжу та кропив'янки.

Повідомлення про підозрювані побічні реакції

Повідомлення про побічні реакції після реєстрації лікарського засобу має важливе значення. Це дає змогу проводити моніторинг співвідношення користь/ризик при застосуванні цього лікарського засобу. Медичним та фармацевтичним працівникам, а також пацієнтам або їх законним представникам слід повідомляти про усі випадки підозрюваних побічних реакцій та відсутності ефективності лікарського засобу через Автоматизовану інформаційну систему з фармаконагляду за посиланням: <https://aisf.dec.gov.ua>.

Термін придатності

3 роки.

Умови зберігання

Зберігати при температурі не вище 25 °С у недоступному для дітей місці.

Упаковка

По 10 таблеток у блістері; по 1 або 2 блістери в картонній коробці.

Категорія відпуску

Без рецепта.

Виробник

УОРЛД МЕДИЦИН ІЛАЧ САН. ВЕ ТІДЖ. А.Ш./

WORLD MEDICINE İLAC SAN. VE TİC. A.Ş.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності

15 Теммуз Махаллеші Джамі Йолу Джаддесі №50 Гюнешлі Багджилар/Стамбул, Туреччина/

15 Temmuz Mahallesi Cami Yolu Caddesi No:50 Gunesli Bagcilar/Istanbul, Turkey.