

# AMAZINA®

## Cetirizina diclorhidrato

VIA ORAL

Comprimidos recubiertos / Solución

### FÓRMULA

#### Comprimidos

Cada comprimido contiene:

Cetirizina diclorhidrato.....10 mg  
Excipientes.....C.S.

#### Solución

Cada 100 mL de solución contienen:

Cetirizina diclorhidrato.....100 mg  
Excipientes.....C.S.

Cada 5 mL de solución contienen:

Cetirizina diclorhidrato.....5 mg  
Excipientes.....C.S.

### ACCIÓN FARMACOLÓGICA

Antihistamínico. Antagonista selectivo de receptores H1. Grupo farmacoterapéutico: Derivados de la piperazina, código ATC: R06A E07. Cetirizina, un metabolito humano de la hidroxizina, es un potente y selectivo inhibidor de los receptores periféricos H1. Los estudios in vitro de unión a receptores no han mostrado afinidad medible nada más que por los receptores H1. Además de su efecto anti-H1, la cetirizina posee actividades antialérgicas: a una dosis de 10 mg una vez al día o dos veces al día, inhibe la fase inicial de la reacción alérgica mediada por histamina, donde inhibe reclutamiento de eosinófilos, en la piel y el tejido conjuntivo cuando se realiza en personas a las que se les realiza test de alérgenos por vía tópica. (mediadores asociados con la respuesta alérgica tardía).

### Propiedades farmacocinéticas

La cetirizina se absorbe en un 70% tras la administración oral. El T<sub>max</sub> es de 1 hora tras la administración oral, y la acción se mantiene durante 24 horas. La cetirizina se une a las proteínas plasmáticas en un 93%. Se metaboliza poco, fundamentalmente por reacciones de oxidación, dando lugar a metabolitos inactivos. La semivida de eliminación es aproximadamente de: 10 horas en adultos, 6 horas en niños entre 6 y 12 años, 5 horas en niños entre 2 y 6 años, y 12 horas en ancianos. Se excreta mayoritariamente por la orina en forma inalterada. La concentración plasmática en el estado de equilibrio es aproximadamente de 300 ng/mL y se alcanza en 1,0 ± 0,5 h. No se observa acumulación de cetirizina tras la administración de dosis diarias de 10 mg durante 10 días. La distribución de los parámetros farmacocinéticos como la concentración máxima (C<sub>max</sub>) y el área debajo de la curva (AUC) es monocompartimental en voluntarios sanos. El grado de absorción de la cetirizina no se reduce con la comida, aunque la velocidad de absorción disminuye. El grado de biodisponibilidad es similar cuando la cetirizina se administra como solución, cápsula o comprimido. El volumen aparente de distribución es 0,50 l/kg. La unión a proteínas plasmáticas de cetirizina es del 93 ± 0,3 %. La cetirizina no modifica la unión de la warfarina a proteínas. La cetirizina no sufre mayoritariamente efecto primer paso. Dos terceras partes de la dosis se excreta sin modificación por la orina. La semivida terminal es aproximadamente de 10 horas. La cetirizina muestra una cinética lineal en el rango de 5 a 60 mg.

### Poblaciones especiales

**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 normales. La disminución en el aclaramiento de la cetirizina en estos voluntarios parece relacionarse con la disminución de su función renal.

**Niños, lactantes y niños pequeños:** La semivida de la cetirizina fue de 6 horas en niños de 6-12 años y 5 horas en niños de 2-6 años. En lactantes y niños pequeños de 6 a 24 meses, se redujo a 3,1 horas.

**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. La cetirizina se elimina poco por hemodilísis. Es necesario el ajuste de dosis en pacientes con insuficiencia renal moderada o grave.

**Pacientes con insuficiencia hepática:** Solo es necesario el ajuste de la dosis en pacientes con la función hepática dañada si presentan daño renal concomitante.

### Estudios Preclínicos:

Los datos en los estudios no clínicos no muestran riesgos especiales para los seres humanos según los estudios convencionales sobre farmacología de seguridad, toxicidad de dosis repetida, genotoxicidad, potencial carcinogénico, toxicidad para la reproducción. En estudios con animales, a dosis muy elevadas de cetirizina, el fármaco comporta como un inductor hepato-enzimático, causó incremento de peso, hipertrofia de los hepatocitos y formación de depósitos grasos. Estudios en voluntarios sanos muestran que la cetirizina a dosis de 5 y 10 mg inhibe estrechamente las pápulas y eritemas inducidos por altas concentraciones de histamina en la piel, pero no se establece la correlación con la eficacia. En un estudio de 35 días en niños de 5 a 12 años, no se encontró tolerancia a los efectos antihistamínicos de la cetirizina (supresión de la pápula y del eritema). Cuando se interrumpe el tratamiento con cetirizina después de una administración repetida, la piel recupera su reactividad normal a la histamina en 3 días. En un estudio de 6 semanas, controlado con placebo con 186 pacientes con rinitis alérgica y asma de leve a moderado, 10 mg de cetirizina administrados una vez al día, mejoraron los síntomas de la rinitis y no alteraron la función pulmonar. Este estudio avala la

seguridad de la administración de cetirizina a pacientes alérgicos con asma de leve a moderado. En un estudio controlado con placebo, la cetirizina administrada a la dosis diaria mayor de 60 mg durante 7 días no provocó una prolongación estadísticamente significativa del intervalo QT. A la dosis recomendada, la cetirizina ha demostrado que mejora la calidad de vida de los pacientes.

### INDICACIONES

AMAZINA comprimidos recubiertos y solución está indicada para el alivio de los síntomas nasales y oculares de la rinitis alérgica estacional y perenne, Alivio sintomático y temporal de los procesos alérgicos producidos por polen de las plantas (fiebre del heno), animales domésticos, polvo u otros agentes alérgicos. AMAZINA está indicada para el alivio de los síntomas de la urticaria crónica idiopática.

### PRECAUCIONES

**Se administrará con precaución a:** Pacientes con ataques agudos de asma, pacientes con insuficiencia renal o hepática, pacientes ancianos: se ha observado que cuando se les administra cetirizina por vía oral se produce un aumento de la semivida plasmática aproximadamente en un 50% y una disminución del aclaramiento total del principio activo (en torno a un 40 %). Esto podría generar un aumento de los efectos secundarios.

**Advertencia sobre excipientes:** los pacientes con intolerancia hereditaria a la galactosa, de insuficiencia de lactasa de Lapp o problemas de absorción de glucosa o galactosa no deben tomar este medicamento.

**Embarazo:** No hay evidencia de teratogenicidad. Se debe evitar el uso de Cetirizina durante el embarazo.

**Lactancia:** Se encuentran cantidades significativas de algunos antihistamínicos en leche materna. Se debe evitar su uso durante la lactancia.

**Epilepsia:** Cetirizina debe ser usado con cuidado en pacientes con epilepsia y en pacientes con riesgo de convulsiones.

**Insuficiencia Renal:** Se debe usar la mitad de la dosis normal en pacientes con depuración de creatinina menor a 30 mL/minuto.

### EFFECTOS SOBRE LA CAPACIDAD PARA CONDUCIR Y USAR MAQUINAS

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 vayan a conducir, realizar actividades potencialmente peligrosas o utilizar maquinaria deberán tener en cuenta su respuesta al fármaco. En estos pacientes sensibles, el uso conjunto de alcohol o cualquier depresor del SNC puede causar disminuciones adicionales en el estado de alerta y alteración del rendimiento.

### INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS

La absorción de cetirizina no se reduce con la comida, aunque la velocidad de absorción disminuye. Se recomienda evitar el consumo de alcohol. No se han notificado ni interacciones farmacodinámicas o farmacocinéticas significativas en los estudios de interacción fármaco-fármaco desarrollados con pseudoefedrina o teofilina (400 mg/día). Ritonavir: Podría elevar la concentración plasmática de Cetirizina. Alcohol, Anilíticos e hipnóticos: Posiblemente incrementan el efecto sedante de Cetirizina. Antidepresivos tricíclicos, Inhibidores MAO: Incrementan los efectos antimuscarínicos y sedantes al administrarse con Cetirizina. Antimuscarínicos: Incrementan el riesgo de efectos adversos antimuscarínicos. Betahistidina: Cetirizina antagoniza teóricamente el efecto de betahistidina. Estudios clínicos han demostrado que la administración concomitante de cetirizina con anticoagulantes orales (acenocumarol) provoca un desplazamiento de la unión de éste a las proteínas plasmáticas, lo que podría provocar una potenciación de la toxicidad de acenocumarol con riesgo de hemorragia.

### CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad al principio activo, a cualquiera de los excipientes, a la hidroxizina o a cualquier derivado piperazínico. Pacientes con insuficiencia renal grave con depuración renal inferior a 10 mL/min. Los pacientes con intolerancia hereditaria a galactosa, insuficiencia de lactasa Lapp o malabsorción de glucosa o galactosa no deben tomar este medicamento. Se debe evitar el exceso de alcohol. Se debe evitar el uso de Cetirizina en pacientes con Porfiria, aun cuando se cree que el uso de este es seguro en estos casos.

### REACCIONES ADVERSAS

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 esta 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 ha 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. Las reacciones adversas presentadas con el fármaco se resumen así:

**Trastornos generales de organismo:** Fatiga, Poco frecuentes: astenia, malestar; Raro: edema.

**Trastornos del sistema nervioso central y periférico:** Mareos, Dolor de cabeza.

**Trastornos gastrointestinales:** Dolor abdominal, Sequedad de boca, Nausea, Diarrea.

**Trastornos psiquiátricos:** Somnolencia, Poco frecuente: agitación; Raros: agresividad, confusión, depresión, alucinación, insomnio; Muy raro: tic.

**Trastornos respiratorios:** Faringitis, Rinitis.

**Trastornos de la sangre y del sistema linfático:** Muy raro: trombocitopenia.

**Trastornos del sistema inmune:** Raro: hipersensibilidad; Muy raro: shock anafiláctico.

**Trastornos del sistema nervioso:** Poco frecuente: parestesia; Raros: convulsiones, trastornos del movimiento; Muy raros: disgeusia, síncope, temblor, distonía, discinesia.

**Trastornos oculares:** Muy raros: trastornos de la acomodación, visión borrosa, giro ocular.

**Trastornos cardíacos:** Raro: taquicardia.

**Trastornos hepatobiliares:** Raro: función hepática anormal (aumento de las transaminasas, fosfatasa alcalina, -GT y bilirrubina).

**Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo:** Poco frecuentes: prurito, sarpullido; Raro: urticaria; Muy raros: edema angioneurótico, erupción debida al fármaco.

**Trastornos renales y urinarios:** Muy raros: disuria, enuresis.

**Exploraciones:** Raro: aumento de peso.

**Trastornos renales y urinarios:** Muy raros: disuria, enuresis.

**Exploraciones:** Raro: aumento de peso.

## PRESENTACIÓN

**AMAZINA** comprimidos recubiertos: caja conteniendo 10, 15, 20, 30, 50 y 100 comprimidos recubiertos.

**AMAZINA** solución: caja conteniendo frasco x 60 mL

## PRODUCTO MEDICINAL

### REQUIERE RECETA MÉDICA

**MANTÉNGASE FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS.**

**MANTENER UN LUGAR FRESCO Y SECO A UNA TEMPERATURA NO MAYOR DE 30°C. PROTÉJASE DE LA LUZ.**

## ADVERTENCIAS

Aun cuando la somnolencia es rara, el paciente debe ser advertido de esta posibilidad, más aun si realiza actividades de precisión. A dosis terapéuticas, no se ha demostrado interacción clínicamente significativa con alcohol (para un nivel de alcohol en sangre de 0,5 g/L). Sin embargo, se recomienda precaución si se toma concomitantemente alcohol. Se recomienda precaución en pacientes epilépticos y pacientes con riesgo de convulsiones. No se recomienda el uso de la formulación de comprimidos recubiertos con película en niños menores de 6 años, ya que esta formulación no permite realizar ajustes apropiados de la dosis. Los antihistamínicos pueden disminuir la respuesta en pruebas cutáneas en las que se emplean extractos alérgicos, por lo que se recomienda suspender su ingestión al menos 3 días antes de comenzar estas pruebas.

## POSOLOGÍA Y ADMINISTRACIÓN

### Dosis Usual en Niños de 1 a 2 años

Utilizar **AMAZINA** solución: 250 microgramos/kg dos veces al día.

### Dosis Usual en Niños de 2 a 6 años

Utilizar **AMAZINA** solución: Rinitis alérgica estacional (fiebre del heno), 5mg una vez al día o 2,5 mg dos veces al día.

### Niños de 6 a 12 años

5 mg dos veces al día (medio comprimido dos veces al día).

### Adultos y adolescentes mayores de 12 años

10 mg una vez al día (1 comprimido).

Los comprimidos deben administrarse con abundante líquido.

### Pacientes adultos mayores

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 pueda utilizar un tratamiento alternativo, se deberán individualizar los intervalos de dosificación de acuerdo con la función renal. Consulte la siguiente tabla y ajuste la dosis según proceda. Para utilizar esta tabla de dosificación, es preciso disponer de una estimación de la depuración de creatinina (CLCr) del paciente, en mL/min.

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

Grupo	Depuración 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 día
Enfermedad renal terminal -Pacientes que requieren diálisis	< 10	Contraindicado

En pacientes pediátricos con insuficiencia renal, se deberá ajustar la dosis de modo individual en cada caso teniendo en cuenta la depuración renal del paciente, su edad y su peso.

### Pacientes con insuficiencia hepática

No es necesario ajustar la dosis en pacientes con únicamente insuficiencia hepática.

### Pacientes con insuficiencia hepática y renal concomitante

Se recomienda ajustar la dosis como en pacientes con insuficiencia renal de moderada a grave.

## SOBREDOSIS

### Síntomas

Efectos anticolinérgicos; arritmias cardíacas; depresión o estimulación del SNC; hipotensión; somnolencia. Nota: Los efectos anticolinérgicos y de estimulación del SNC son más propensos a presentarse en niños con sobredosis. La hipotensión también puede ocurrir en adultos mayores a dosis usuales. Los efectos anticolinérgicos y sobre el SNC son menos propensos de presentarse con Cetirizina comparados con los antihistamínicos de primera generación.

### Tratamiento

Debido a que no se cuenta con un antídoto específico para la sobredosis con antihistamínicos, el tratamiento es sintomático y de soporte. Para reducir la absorción: Inducción del vómito, especialmente en niños. Lavado gástrico si el paciente es incapaz de vomitar dentro de las 3 horas posteriores a la ingesta. Para aumentar la eliminación: Los catárticos salinos son usados en ciertos casos. Tratamiento específico: Vasopresores para tratar la hipotensión. Sin embargo no se debe usar epinefrina pues podría reducir aún más la presión arterial. Oxígeno y fluidos endovenosos. Tener cuidado con el uso de estimulantes (agentes analépticos), pues pueden producir convulsiones. En el caso de sobredosificación masiva, deberá realizarse lavado gástrico si no han transcurrido más de 30 minutos después de la ingestión, junto con las medidas de apoyo habituales.

Fabricado por:

**Laboratorios Rowe, S.R.L.**

Santo Domingo, Rep. Dominicana.

Reg. Ind. 17090.

Última revisión de texto febrero, 2013

Atención al cliente: 809 687-2701, Ext. 105



**Rowe**®