

Allerzet® 10 mg Film Tablet

FORMÜLÜ

Her bir film tablette, 10 mg setirizin dihidroklorür; ayrıca boyar madde titan dioksit bulunur.

FARMAKOLOJİK ÖZELLİKLERİ

Farmakodinamik özellikleri

Allerzet® Tablet'in etkin maddesi setirizin, belirgin antikolinergik ve antiserotoninerjik etkileri olmayan selektif histamin H₁ reseptör antagonistidir. Farmakolojik aktif dozları sedasyona ve davranış değişikliklerine sebep olmaz. Bu özelliği, kan-beyin engelini aşmaması ile açıklanabilir.

İnsanda setirizinin farmakolojik olarak ekzojen histamine bağlı belirgin bazı etkileri inhibe edecek güçte olduğu gösterilmiştir. Bu etki, çabuk kendini gösterir. Setirizin, aynı zamanda 48/80 gibi bir histamin liberatörünün in vivo koşullarda açığa çıkardığı endojen histaminin etkilerini de inhibe eder. Aynı zamanda vazoaaktif intestinal polipeptidin (VIP) ve P maddesinin (alerjik reaksiyonlarda rol oynadığı bilinen polipeptidler) başlattığı deri reaksiyonunu da önler. Alerjik reaksiyonun histamine bağlı erken fazını inhibe eder ve iltihap hücrelerinin migrasyon gücünü azaltır; "geç" alerjik reaksiyonun bir sonucu olan mediyatör salınımını önler.

Setirizin, astmatik kimselerin histamine karşı gösterdiği bronş hiperaktivitesini belirgin bir ölçüde azaltır. Aynı şekilde spesifik alerjenlerin başlattığı alerjik reaksiyonu da hafifletir. Bütün bu etkiler, ne psikometrik testlerle objektif bir şekilde saptanabilecek, ne de elektroensefalografi yardımı ile nicelendirilebilecek bir santral etki görülmezsizin elde edilir.

Farmakokinetik özellikleri

Emilim: Setirizin, oral yoldan uygulamayı takiben hızlı bir şekilde emilir. Setirizin, plazma doruk konsantrasyonlarına oral yolla alımından 1 saat sonra ulaşır. Birikme gözlenmez. 5 ila 60 mg arasında değişen oral dozlar yönünden setirizin farmakokinetiği doğrusaldır. Yiyecek, tablet şeklinde verilen setirizinin eğri altında kalan alan (EAA) parametresini etkilemezken; T_{maks} değerini geciktirir; C_{maks} değerini düşürür.

Dağılım: Setirizin, plazma proteinlerine kuvvetle bağlanır.

Metabolizma: İlk-geçiş metabolizması düşük derecededir. Setirizin, oksidatif O-dealkilasyon yoluyla ihmal edilebilir düzeyde antihistaminik etkisi olan bir metabolite sınırlı miktarda metabolize olur. Bu metabolizmadan sorumlu enzim veya enzimler henüz belirlenememiştir. Radyoaktif işaretleme yoluyla yapılan çalışmalarda verilen dozun yaklaşık %50'sinin değişmemiş ilaç şeklinde idrarda tespit edildiği gözlenmiştir.

İtrah: Plazma yarılanma ömrü, erişkinlerde yaklaşık 11 saattir. Bu bulgular, böbrekten atılma yarı ömrü ile de doğrulanmıştır. Radyoaktif işaretleme yoluyla yapılan çalışmalarda verilen dozun %70'inin idrar, %10'unun feçes ile atıldığı görülmüştür.

Pediyatrik farmakokinetik: 7-12 yaş arasındaki pediyatrik hastalara oral yolla 5 mg setirizin verildiğinde ortalama C_{maks} 275 ng/ml; 5 mg setirizin verilen 2-5 yaş arasındaki pediyatrik hastalarda ortalama C_{maks} 660 ng/ml; 0,25 mg/kg tek doz setirizin verilen 6-23 aylık pediyatrik hastalarda ise ortalama C_{maks} 390 ng/ml olarak bulunmuştur. Pediyatrik popülasyonda erişkinlere kıyasla ölçülen toplam vücut klerensinin daha yüksek; eliminasyon yarı-ömrünün daha kısa olduğu tespit edilmiştir. Setirizin solüsyonunun en yüksek dozunun (günde 2 kez 2,5 mg) verildiği 6 ay-2 yaş arasındaki çocuklarda ortalama EAA'nın (Eğri Altındaki Alan) (0-t), günde 1 kez 10 mg setirizin tablet verilen erişkinlerde gözlenen değerden 2 kat daha yüksek olması beklenir.

ENDİKASYONLARI

- Saman nezlesi (mevsimlere bağlı alerjik rinit ve konjunktivit),
- Kronik alerjik rinit,
- Alerjik kaşıntılar,
- İdiyopatik ürtiker.

KONTRENDİKASYONLARI

Bileşiminde bulunan maddelerden birine karşı aşırı duyarlılığı olan kimselere **Allerset® Tablet** verilmemelidir.

UYARILAR/ÖNLEMLER

Böbrek yetmezliği olan hastalarda uygulanacak günlük doz yarıya indirilmelidir.

Karaciğer yetmezliği olan hastalarda dikkatli bir şekilde kullanılmalıdır. Bu hastalarda doz ayarlamasına ihtiyaç duyulabilir.

Setirizinin esas olarak böbrekler tarafından itrah edildiği bilinmektedir. Dolayısı ile böbrek fonksiyon bozukluğu olan hastalarda, bu ilaca karşı toksik reaksiyon gelişme riski artabilir. Yaşlı hastaların böbrek fonksiyonlarındaki azalma olasılığı yüksek olduğundan yaşlı hastalarda doz seçiminde dikkatli davranılmalıdır. Bu hastalarda böbrek fonksiyonlarının izlenmesi yararlı olabilir.

2 yaşından küçük çocuklarda **Allerset® Şurup** kullanımı önerilmektedir.

GEBELİK ve EMZİRME DÖNEMİNDE KULLANIMI

Gebelerde kullanımı

Gebelik kategorisi, B'dir. Hayvanlarda yapılan teratojenik çalışmalarda herhangi bir advers etkiye rastlanmamıştır. Buna rağmen gebelik esnasında ihtiyatlı davranmalı ve **Allerset® Tablet** kullanılmamalıdır.

Emzirenlerde kullanımı

Setirizinin anne sütüne geçtiği bildirilmiştir. Bu nedenle, emzirme devresinde ihtiyatlı davranmalı ve **Allerset® Tablet** kullanılmamalıdır.

ARAÇ ve MAKİNE KULLANMA YETENEĞİ ÜZERİNDEKİ ETKİLERİ

Motorlu taşıt ve tehlikeli makineler kullanılacaksa verilen dozlardan fazlası alınmamalıdır.

YAN ETKİLER/ADVERS ETKİLER

%10'dan yüksek

Santral sinir sistemi: Baş ağrısı (çocuklarda %11-14; plasebo ile %12), somnolans (erişkinlerde %14; çocuklarda %2-4)

%2 ila %10 arasında

Santral sinir sistemi: İnsomnia (çocuklarda %9; erişkinlerde < %2), yorgunluk (erişkinlerde %6), kırıklık (%4), baş dönmesi (erişkinlerde %2)

Gastrointestinal sistem: Karın ağrısı (çocuklarda %4-6), ağız kuruluğu (erişkinlerde %5), diyare (çocuklarda %2-3), bulantı (çocuklarda %2-3; plasebo ile %2), kusma (çocuklarda %2-3)

Solunum sistemi: Epistaksis (çocuklarda %2-4; plasebo ile %3), farenjit (çocuklarda %3-6; plasebo ile %3), bronkospazm (çocuklarda %2-3; plasebo ile %2).

%2'den küçük (erişkinlerde ve/veya çocuklarda bildirildiği kadarıyla önemli veya hayatı tehdit edici olmaya sınırlı)

Anaflaksi, anjiyoödem, ataksi, göğüs ağrısı, konfüzyon, depersonalizasyon, depresyon, ödem, telaş, hemolitik anemi, hepatit, hipertansiyon, huzursuzluk, karaciğer fonksiyon testlerinde anormallik, sinirlilik, ototoksikite, çarpıntı, paralizi, parestezi, fotosensitivite, döküntü, tat bozukluğu, dilde solgunluk, dil ödemi, tremor, görme alanı kusuru ve halsizlik.

BEKLENMEYEN BİR ETKİ GÖRÜLDÜĞÜNDE DOKTORUNUZA BAŞVURUNUZ.

İLAÇ ETKİLEŞMELERİ ve DİĞER ETKİLEŞMELER

Setirizin, CYP3A4'ün minör substratıdır.

Santral sinir sistemi depresanı ve antikolinerjiklerle birlikte kullanılmasından kaçınılmalıdır.

Santral sinir sistemi depresyonu artabileceği için etanol ile birlikte kullanımından kaçınılmalıdır.

KULLANIM ŞEKLİ ve DOZU

Yetişkinlerde ve 30 kg'ın üstündeki çocuklarda günde tek doz halinde 10 mg'lık bir tablet **Allerset**[®] alınması önerilir. 2-12 yaş arasındaki ve 30 kg'ın altındaki çocuklarda günde tek doz halinde 5 mg **Allerset**[®] alınması yeterlidir. Alınış zamanının yemeklerle bir ilgisi yoktur. İlacın alınmasına neden olan semptomlar, gece en rahatsız edici biçimde ortaya çıktığından, ilacın akşam yemeklerinde bir miktar sıvı ile alınması önerilmektedir. Tedavi süresi şikayetlerin şekline, devamına ve seyrine bağlıdır. Saman nezlesinde genellikle 3-6 haftalık bir tedavi yeterlidir.

2-12 yaş arasındaki çocuklarda

30 kg'ın altında; ½ tablet (5 mg)

30 kg'ın üstünde; 1 tablet (10 mg)

12 yaş üzerindeki çocuklarda ve erişkinlerde

1 tablet (10 mg)

Böbrek ve karaciğer fonksiyon bozukluğunda dozaj

Böbrek fonksiyon bozukluğu (kreatinin klerensi 11-31 ml/dakika) olan 12 yaş ve üzerindeki hastalarda, hemodiyaliz hastalarında (kreatinin klerensi 7 ml/dakika'dan düşük) ve karaciğer fonksiyon bozukluğu olan hastalarda günde 1 kez 5 mg'lık doz önerilir. Benzer şekilde, böbrek veya karaciğer fonksiyon bozukluğu olan 6-11 yaş arasındaki çocuklarda önerilenden daha düşük dozlar kullanılmalıdır. Böbrek veya karaciğer fonksiyon bozukluğu olan 6 yaşından küçük çocuklarda, setirizinin farmakokinetik ve güvenlik bilgilerinin eksikliği nedeni ile, kullanımı önerilmez.

Yaşlı hastalarda dozaj

77 yaş ve üzerindeki hastalarda günde 1 kez 5 mg'lık doz önerilir.

DOZ AŞIMI ve TEDAVİSİ

Tek doz halinde 50 mg setirizin uygulandığı zaman görülen uykulu hal, doz aşımının bir belirtisi olabilir. Çok yüksek miktarda bir doz aşımı söz konusu ise, diğer takviye önlemleri ile birlikte mide yıkanmalıdır. Halen setirizinin özel bir antidotu yoktur.

SAKLAMA KOŞULLARI

25 °C'nin altındaki oda sıcaklığında, çocukların göremeyeceği, erişemeyeceği yerlerde ve ambalajında saklayınız.

Doktora danışmadan kullanılmamalıdır.

TİCARİ TAKDİM ŞEKLİ ve AMBALAJ MUHTEVASI

Allerset® 10 mg Film Tablet; 10, 20 ve 30 film tabletlik blister ambalajlarda.

PIYASADA MEVCUT DİĞER FARMASÖTİK DOZAJ ŞEKİLLERİ

Allerset® Oral Damla 10 mg/ml; 20 ml solüsyon içeren damlalıklı şişelerde.

Allerset® Şurup 1 mg/ml; 200 ml solüsyon içeren şişelerde, 5 ml'lik ölçeceği ile birlikte.

RUHSAT SAHİBİNİN İSİM ve ADRESİ

SANTA FARMA İLAÇ SANAYİİ A.Ş.

34382 Şişli - İSTANBUL

RUHSAT TARİHİ ve NUMARASI

16.02.1995 - 172/75

ÜRETİM YERİ İSİM ve ADRESİ

SANTA FARMA İLAÇ SANAYİİ A.Ş.

34091 Edirnekapı - İSTANBUL

REÇETE İLE SATILIR.

Prospektüsün son güncellenme tarihi: 24.01.2007