STOPALER®

CETIRIZINA DICLORHIDRATO 10 mg

Comprimidos recubiertos

Venta bajo receta — Industria Argentina

FÓRMULA

Cada comprimido recubierto contiene:
Cetirizina diclorhidrato 10 mg.
Excipientes: Almidón glicolato de sodio, Lactosa, Polivinilpirrolidona, Estearato de magnesio, Eudragit E, Polietilenglicol, Dioxído de titanio, Talco, Dibutilftalato, c.s.

CÓDIGO ATC: R06AE.

ACCIÓN TERAPÉUTICA

Antihistamínico H1 de segunda generación.

PROPIEDADES

Es un derivado de la hidroxicina, con efecto antihistamínico sobre los receptores histaminérgicos H1. Se caracteriza por su selectividad de acción. Se absorbe bien y por completo en el tracto digestivo y alcanza su pico plasmático en 1 a 2 horas, lo cual, sumado a su larga vida media (10 horas), permite ser administrada en una única dosis diaria. No atraviesa la barrera hematoencefálica.

INDICACIONES TERAPÉUTICAS

Afecciones alérgicas en general. Dermatitis. Prurito. Urticaria. Tratamiento sintomático de la rinitis alérgica (estacional o perenne) asociada a conjuntivitis alérgica y de la urticaria idiopática crónica.

POSOLOGÍA Y FORMA DE ADMINISTRACIÓN

Adultos y niños mayores de 12 años: La dosis inicial recomendada de STOPALER® es de 5 mg o 10 mg por día en adultos y niños mayores de 12 años, dependiendo de la gravedad de los síntomas. La mayoría de los pacientes en los ensayos clínicos empezaron con 10 mg. STOPALER® se administra como una dosis única diaria. El momento de la administración puede variar para ajustar las necesidades individuales de cada paciente.

Niños de 6 a 11 años: La dosis inicial recomendada de cetirizina en niños de 6 a 11 años es de 5 mg o 10 mg una vez por día, dependiendo de la gravedad de los síntomas. El momento de la administración puede variar para ajustar las necesidades individuales de cada paciente.

Ajuste de la dosis para pacientes con disfunción renal y hepática: En los pacientes mayores de 12 años con disminución de la función renal (clearance de la creatinina 11-31 mL/min), los pacientes en hemodiálisis (clearance de la creatinina menor a 7 mL/min) y en pacientes con disfunción hepática, se recomienda una dosis de 5 mg una vez por día. De la misma manera, los pacientes pediátricos entre 6 y 11 años de edad con disfunción renal o hepática deberán usar la menor dosis recomendada. Dada la dificultad de administrar dosis menores de 2.5 mg y al no disponer de información farmacocinética y de la seguridad de cetirizina en niños menores de 6 años con disfunción renal o hepática, no se recomienda su uso en este grupo de pacientes.

Ajuste de la dosis para pacientes geriátricos: En pacientes mayores de 77 años se recomienda una dosis de 5 mg una vez por día.

CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a cualquier componente de la especialidad.
Niños menores de 6 años.
Pacientes con insuficiencia renal grave.

PRECAUCIONES

Actividades que requieran concentración mental: En ensayos clínicos, se informó la frecuencia de somnolencia en algunos pacientes que tomaron CETIRIZINA, por lo tanto, se deberá tener precaución cuando se conduzca un auto o se operen maquinarias potencialmente peligrosas. Deberá evitarse el uso concurrente de STOPALER® con alcohol y otros agentes depresivos del SNC debido a las posibles reducciones adicionales del estado de alerta y la reducción adicional del rendimiento del SNC.

Interacciones farmacológicas: No se descubrieron interacciones medicamentosas clínicamente significativas con una dosis baja de teofilina, azitromicina, pseudoefedrina, ketoconazol o eritromicina. Se registró una reducción pequeña del clearance de cetirizina a causa de una dosis de 400 mg de teofilina; es posible que dosis mayores de teofilina puedan tener un mayor efecto.

Carcinogénesis, mutagénesis y trastornos de la fertilidad: En un estudio de carcinogenicidad de 2 años de duración realizado en ratas, cetirizina no fue carcinogénica en dosis dietarias de hasta 20 mg/kg (aproximadamente 15 veces la dosis diaria oral máxima recomendada en adultos en una base de mg/m2, o aproximadamente 7 veces la dosis diaria oral máxima recomendada en niños en una base de mg/m2). En un estudio de carcinogenicidad de 2 años de duración realizado en ratones, cetirizina provocó un aumento en la frecuencia de tumores benignos de hígado en hombres sobre una dosis dietaria de 16 mg/kg (aproximadamente 6 veces la dosis diaria oral máxima recomendada en adultos en una base de mg/m2, o aproximadamente 3 veces la dosis diaria oral máxima recomendada en niños en una base de mg/m2). No se observó aumento en la frecuencia de tumores de hígado en ratones con una dosis dietaria de 4 mg/kg (aproximadamente 2 veces la dosis diaria oral máxima recomendada en adultos en una base de mg/m2, o aproximadamente equivalente a la dosis diaria oral máxima recomendada en niños en una base de mg/m2). Se desconoce la importancia clínica de estos hallazgos durante el uso a largo plazo de cetirizina.
Cetirizina no fue mutagénica en el Ames test y tampoco fue clastogénica en el ensayo de linfocito humano, el ensayo de linfoma de ratón y el test de micronúcleo in vivo en ratas. En un estudio de fertilidad y de rendimiento general reproductivo en ratones, cetirizina no obstaculizó la fertilidad con dosis orales de 64 mg/kg (aproximadamente 25 veces la dosis oral diaria máxima recomendada en adultos sobre una base de mg/m2).

Embarazo categoría B: En ratones, ratas y conejos, cetirizina no fue teratogénico con dosis orales de hasta 96, 225, y 135 mg/kg, respectivamente (aproximadamente 40, 180 y 220 veces la dosis oral diaria máxima recomendada en adultos sobre una base de mg/m2). Sin embargo, no existen estudios adecuados y bien controlados en mujeres embarazadas. Dado que los estudios de reproducción animal no siempre predicen la respuesta humana, CETIRIZINA deberá utilizarse durante el embarazo sólo si realmente se lo necesita.

Mujeres en etapa de lactancia: En ratones, la cetirizina provocó un aumento de peso de las crías demorado durante la lactancia con dosis orales en hembras parturientas de 96 mg/kg (aproximadamente 40 veces la dosis oral diaria máxima recomendada en adultos sobre una base de mg/m2). Estudios realizados en perros beagle indicaron que aproximadamente un 3% de la dosis fue excretada en la leche. Se ha informado que Cetirizina ha sido excretada en la leche de madres amamantando. Dado que muchas drogas se excretan en la leche humana, no se recomienda el uso de CETIRIZINA en madres en etapa de lactancia.

Uso en pacientes geriátricos: Del número total de pacientes en estudios clínicos con CETIRIZINA, 186 pacientes tenían 65 años o más y 39 pacientes tenían 75 años o más. No se observaron diferencias generales en la seguridad entre estos pacientes y pacientes más jóvenes, pero no se puede descartar una mayor sensibilidad de algunos individuos más grandes. En relación con la eficacia, los estudios clínicos de CETIRIZINA para cada indicación aprobada no incluyeron números suficientes de pacientes mayores de 65 años como para poder determinar si ellos responden de una manera diferente a los pacientes más jóvenes. Se sabe que la CETIRIZINA se excreta substancialmente por el riñón y el riesgo de reacciones tóxicas para esta droga puede ser mayor en pacientes con la función renal debilitada. Dado que los pacientes mayores son los más propensos de padecer un debilitamiento de la función renal, se debe elegir la dosis con cuidado y puede ser útil monitorear la función renal.

Uso en pacientes pediátricos: La seguridad de cetirizina ha sido demostrada en pacientes pediátricos entre 6 meses y 11 años. La seguridad de cetirizina, con dosis diarias de 5 ó 10 mg, se ha demostrado en 376 pacientes pediátricos de entre 6 y 11 años en ensayos controlados con placebo que duraron hasta 4 semanas y en 254 pacientes en un ensayo no controlado por placebo de 12 semanas. La seguridad de cetirizina ha sido demostrada en 168 pacientes entre 2 y 5 años en ensayos controlados por placebo de hasta 4 semanas de duración. En una base de mg/kg, la mayoría de los 168 pacientes recibieron entre 0.2 y 0.4 mg/kg de cetirizina HCl. La seguridad de cetirizina en 399 pacientes entre 12 y 24 meses ha sido demostrada en un ensayo controlado por placebo de 18 meses de duración, en el que la dosis promedio fue de 0.25 mg/kg dos veces por día, correspondiente a un rango de 4 a 11 mg/día. La seguridad del jarabe CETIRIZINA ha sido demostrada en 42 pacientes de entre 6 y 11 meses en un ensayo controlado por placebo de 7 días de duración. La dosis recetada fue de 0.25 mg/kg dos veces por día, la cual corresponde a un promedio de 4.5 mg/día, con un rango de 3.4 a 6.2 mg/día. La efectividad de STOPALER® para el tratamiento de rinitis alérgica y urticaria idiopática crónica en pacientes pediátricos de entre 6 meses y 11 años se basa en una extrapolación de la eficacia demostrada de STOPALER® en adultos con estas condiciones y la posibilidad de que el curso de la enfermedad, la patofisiología y el efecto de la droga sean substancialmente similares entre estas dos poblaciones. La eficacia se extrapola a 6 meses para la rinitis alérgica perenne y a 2 años de edad para los casos de rinitis alérgica estacional dado que se creen que estas enfermedades ocurren en estas edades en niños. Las dosis recomendadas para la población pediátrica se basan en comparaciones de varios estudios acerca de la farmacocinética y farmacodinámica de cetirizina en adultos y pacientes pediátricos en el perfil de seguridad de cetirizina en los pacientes adultos y pediátricos con dosis iguales o mayores a las dosis recomendadas. El ABC y el Cmax de la cetirizina en pacientes pediátricos de 6 a 23 meses que recibieron un promedio de 2.3 mg en una dosis única y en sujetos de 2 a 5 años de edad que recibieron una dosis única de 5 mg de jarabe de cetirizina y en pacientes pediátricos de 6 a 11 años que recibieron una dosis única de 10 mg de jarabe de cetirizina fueron estimados como intermediario entre el observado en adultos que recibieron una dosis única de 10 mg de comprimidos de cetirizina y aquellos que recibieron una dosis única de 20 mg de comprimidos de cetirizina. La seguridad y efectividad de cetirizina en pacientes pediátricos menores de 6 meses no ha sido establecida.

Embarazo y lactancia: Estudios de la exposición al fármaco en un número limitado de pacientes embarazadas no han revelado efectos adversos de cetirizina diclorhidrato sobre el embarazo o la salud del feto o neonato. Actualmente no se dispone de otros estudios epidemiológicos relevantes. Los estudios en animales no han revelado efectos dañinos directos o indirectos sobre el embarazo, desarrollo embrionario/fetal, parto o desarrollo postnatal. Se recomienda precaución al prescribir a mujeres embarazadas.

Lactancia: No hay estudios en humanos disponibles de la excreción de cetirizina diclorhidrato en la leche. Se debe evitar la administración de cetirizina diclorhidrato durante la lactancia.

Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar maquinaria: Cetirizina diclorhidrato puede influenciar poco o moderadamente la capacidad de reacción del paciente, lo que se debe tener en cuenta cuando se requiera especial atención, como por ejemplo al conducir. Cetirizina diclorhidrato puede potenciar los efectos del alcohol y los depresivos del SNC.

REACCIONES ADVERSAS

Se realizaron ensayos clínicos controlados y sin controlar en los Estados Unidos y Canadá que incluyeron más de 6000 pacientes mayores de 12 años con más de 3900 que recibieron cetirizina a dosis de 5 a 20 mg por día. La duración del tratamiento varió de una semana a 6 meses, con una exposición promedio de 30 días. La mayoría de las reacciones adversas reportadas durante el tratamiento con cetirizina fueron leves a moderadas. En ensayos controlados por placebo, la incidencia de las discontinuaciones debido a las reacciones adversas en pacientes que recibieron 5 ó 10 mg de cetirizina no fue significativamente diferente a la del grupo con placebo (2.9% vs. 2.4%, respectivamente). El evento adverso más común observado en pacientes mayores de 12 años y que ocurrió con más frecuencia al administrar cetirizina que al administrar placebo fue somnolencia y su incidencia asociada con cetirizina estaba relacionada con la dosis, 6% en placebo, 11% con dosis de 5 mg y 14% con dosis de 10 mg. Las discontinuaciones debido a la somnolencia por la administración de cetirizina no fueron comunes (1.0% con cetirizina vs. 0.6% con placebo). Fatiga y sequedad bucal también fueron reacciones adversas relacionadas con el tratamiento. No se registraron diferencias por la edad, raza, género o peso corporal en relación con la frecuencia de las reacciones adversas. En la Tabla 1 se detallan las experiencias adversas en pacientes mayores de 12 años que se informaron con 5 y 10 mg de cetirizina en ensayos clínicos controlados realizados en los Estados Unidos y que fueron más comunes con CETIRIZINA que con placebo.

Tabla 1
Experiencias adversas reportadas en pacientes mayores de 12 años en ensayos clínicos de CETIRIZINA controlados con Placebo, realizados en los Estados Unidos (Dosis máxima de 10 mg) con índices del 2% o más (Porcentaje de incidencia)

Experiencia adversa	CETIRIZINA (N=2034)	Placebo (N=1612)
Somnolencia	13.7	6.3
Fatiga	5.9	2.6
Sequedad bucal	5.0	2.3
Faringitis	2.0	1.9
Mareos	2.0	1.2

Además, se registraron dolor de cabeza y náuseas en más del 2% de los pacientes, pero fueron más comunes en los pacientes que recibieron placebo. También se realizaron estudios con cetirizina en pacientes pediátricos. Se incluyeron más de 1300 pacientes pediátricos entre 6 y 11 años con más de 900 pacientes bajo tratamiento con cetirizina con dosis de 1.25 a 10 mg por día en ensayos clínicos controlados y sin controlar realizados en los Estados Unidos. La duración del tratamiento varió entre 2 y 12 semanas. Los ensayos controlados por placebo de hasta 4 semanas de duración incluyeron 168 pacientes pediátricos entre 2 y 5 años de edad que recibieron cetirizina y la mayoría de ellos recibieron dosis diarias únicas de 5 mg. Un ensayo controlado por placebo de 18 meses de duración incluyó 399 pacientes entre 12 y 24 meses bajo tratamiento con cetirizina (0.25 mg/kg 2 veces/ día) y otro ensayo controlado por placebo de 7 días de duración incluyó 42 pacientes entre 6 y 11 meses que recibieron tratamiento con cetirizina (0.25 mg/kg 2 veces/ día). La mayoría de las reacciones adversas que se informaron en los pacientes pediátricos entre 2 y 11 años con cetirizina fueron leves a moderadas. En ensayos controlados por placebo, la frecuencia de discontinuaciones debido a las reacciones adversas en pacientes pediátricas que recibieron hasta 10 mg de no cetirizina fue común (0.4% con cetirizina vs. 1.0% con placebo). La tabla 2 ofrece una lista de las experiencias adversas que se informaron en los pacientes pediátricos que recibieron 5 y 10 mg de cetirizina entre 6 y 11 años en ensayos controlados por placebo realizados en los Estados Unidos y fueron más comunes con cetirizina que con placebo. De todos estos, se consideró que el dolor abdominal relacionado con el tratamiento y la somnolencia parecieron estar relacionado con la dosis, 1.3% con placebo, 1.9% con dosis de 5 mg y 4.2% con dosis de 10 mg. Las experiencias adversas informadas en pacientes pediátricos de 2 a 5 años en ensayos controlados con placebo fueron cualitativamente similares en naturaleza y, generalmente, similares en frecuencia a aquellos reportados en ensayos con niños de entre 6 y 11 años. En los ensayos controlados con placebo, realizados en pacientes pediátricos entre 6 y 24 meses de edad, la frecuencia de las experiencias adversas fueron similares en los grupos de tratamiento con cetirizina y placebo en cada estudio. Se registraron casos de somnolencia con esencialmente la misma frecuencia en pacientes que recibieron cetirizina y los pacientes que recibieron placebo. En un estudio de 1 semana de duración en niños de 6-11 meses de edad, los pacientes que recibieron cetirizina exhibieron mayor irritabilidad/molestia que los pacientes que recibieron placebo. En un estudio de 18 meses de duración en pacientes mayores de 12 meses, los casos de insomnio tuvieron lugar con mayor frecuencia en los pacientes que recibieron cetirizina, en comparación con los pacientes que recibieron placebo (9.0% v. 5.3%). En aquellos pacientes que recibieron 5 mg o más por día de cetirizina, en comparación con los pacientes que recibieron placebo, los eventos adversos que se observaron con mayor frecuencia fueron fatiga (3.6% v. 1.3%) y malestar (3.6% v. 1.8%).

Tabla 2
Experiencias adversas informadas en pacientes pediátricos de 6 a 11 años en ensayos controlados con placebo realizados en los Estados Unidos (dosis de 5 ó 10mg) que ocurrieron con una frecuencia del 2% en cualquiera de los grupos cetirizina de 5mg o de 10mg y mayor frecuencia que en el grupo placebo.

		Cetirizina	
Experiencia adversa	Placebo (N=309)	5 mg (N=161)	10 mg (N=215)
Cefalea	12.3%	11.0%	14.0%
Faringitis	2.9%	6.2%	2.8%
Dolor abdominal	1.9%	4.4%	5.6%
Tos	3.9%	4.4%	2.8%
Somnolencia	1.3%	1.9%	4.2%
Diarrea	1.3%	3.1%	1.9%
Epistaxis	2.9%	3.7%	1.9%
Broncoespasmo	1.9%	3.1%	1.9%
Náusea	1.9%	1.9%	2.8%
Vómitos	1.0%	2.5%	2.3%

Los siguientes eventos se observaron con poca frecuencia (menos de 2%), en cualquiera de los 3982 adultos y niños mayores de 12 años o en 659 pacientes pediátricos de 6 a 11 años que recibieron cetirizina en ensayos de los Estados Unidos que incluyeron un estudio abierto con adultos de seis meses de duración. No se ha establecido una relación causal de estos eventos infrecuentes con la administración de CETIRIZINA.

Sistema nervioso autónomo: anorexia, sofocos, aumento de salivación, retención urinaria.

Cardiovascular: falla cardíaca, hipertensión, palpitación, taquicardia.

Sistemas nerviosos, central y periférico: coordinación anormal, ataxia, confusión, disfonía, hiperestesia, hiperquinesia, hipertonía, hipoestesia, calambres de piernas, migraña, mielitis, parálisis, parestesia, ptosis, síncope, temblor, fasciculaciones musculares, vértigo, defecto del campo visual.

Gastrointestinal: función hepática anormal, empeoramiento de la condición de las caries, constipación, dispepsia, eructos, flatulencia, gastritis, hemorroides, aumento de apetito, melena, hemorragia rectal, estomatitis que incluya estomatitis ulcerativa, decoloración de la lengua, edema de lengua.

Genitourinario: cistitis, disuria, hematuria, micción frecuente, poliuria, incontinencia urinaria, infección del tracto urinario.

Audición: sordera, dolor de oído, ototoxicidad, silbidos en los oídos.

Metabólico/Nutricional: deshidratación, diabetes mellitus, sed.

Musculoesquelético: artralgia, artritis, artrosis, debilidad muscular, mialgia.

Psiquiátrico: pensamientos anormales, agitación, amnesia, ansiedad, disminución de la libido, despersonalización, depresión, poca estabilidad emocional, euforia, falta de concentración, insomnio, nerviosismo, pesadillas, trastorno del sueño.

Sistema respiratorio: bronquitis, dispnea, hiperventilación, aumento de esputo, neumonía, trastornos respiratorios, rinitis, sinusitis, infección del tracto superior respiratorio.

Sistema reproductivo: dismenorrea, dolor de pecho femenino, hemorragia intermenstrual, leucorrea, menorragia, vaginitis.

Reticuloendotelial: linfoadenopatía.

Piel: acné, alopecia, angioedema, erupción bullous, dermatitis, piel seca, eczema, rash eritematoso, furunculosis, hiperqueratosis, hipertricosis, aumento de sudoración, rash maculopapular, reacción a la fotosensibilidad, reacción tóxica a la fotosensibilidad, prurito, púrpura, rash, seborrea, trastorno de la piel, nódulos en la piel, urticaria.

Sentidos especiales: alteración del olfato, pérdida del sabor, perversión del sabor.

Visión: ceguera, conjuntivitis, dolor en los ojos, glaucoma, pérdida de la acomodación, hemorragia ocular, xeroftalmia (sequedad de la visión).

Cuerpo en su totalidad: lección accidental, astenia, dolor de espalda, dolor de pecho, abdomen agrandado, edema facial, fiebre, edema generalizado, sofocos, aumento de peso, edema de pierna, malestar, pólipos nasales, dolor, palidez, edema periorbital, edema periférico, escalofríos con fiebre. Se han informado casos ocasionales de aumentos transitorios y reversibles de la transaminasa hepática durante el tratamiento con cetirizina. También se han informado casos de hepatitis con aumento significativo de la transaminasa y bilirrubina elevada en asociación con el uso de CETIRIZINA.

Experiencia Post-Marketing: En el período de post-marketing, se han informado los siguientes eventos adversos poco comunes, pero potencialmente graves: reacción agresiva, anafilaxis, colestasis, convulsiones, glomerulonefritis, alucinaciones, anemia hemolítica, hepatitis, disquinesia orofacial, hipotensión grave, muerte fetal intraútero, ideas de suicidio, suicidio y trombocitopenia.

SOBREDOSIS

Toxicidad: La experiencia con sobredosificación de cetirizina diclorhidrato es limitada. La administración de 20 mg a un paciente de 2 años, 30 mg a uno de 3 años y 40 mg a uno de 11 años no produjo sintomatología alguna. La administración de 60 mg a un paciente de 4 años ocasionó una intoxicación leve, 400 mg a uno de 14 años causó sintomatología leve, mientras que, 400-500 mg a un adulto no produjo sintomatología en absoluto.

Síntomas de sobredosis con antihistamínicos: Somnolencia, inconsciencia y/o excitación (principalmente en niños), Ataxia, temblores, cefalea, alucinaciones, ataques, sequedad de boca, eritema, hipertermia, midriasis, retención urinaria, taquicardia y en casos de dosis masivas, posible caída de la presión arterial y arritmias. Nauseas y vómitos. Es posible que también se presenten síntomas extrapiramidales. Cetirizina diclorhidrato posee efecto sedante leve y anticolinérgico. La sedación puede ser un síntoma de sobredosis y puede aparecer tras dosis únicas de menos de 50 mg.

Tratamiento: Actualmente no hay ningún antídoto específico. La experiencia en sobredosificación es limitada, pero no se han presentado casos de intoxicación severa hasta la fecha. El tratamiento primario consiste en un lavado gástrico, siempre que sea justificado y carbón activado. Se recomienda instaurar tratamiento sintomático en casos de intoxicación aguda, como diazepam para los ataques o las distonias agudas.

ANTE LA POSIBILIDAD DE UNA SOBREDOSIFICACIÓN, CONCURRIR AL HOSPITAL MÁS CERCANO O COMUNICARSE CON LOS CENTROS DE TOXICOLOGÍA:

Hospital de Pediatría Ricardo Gutierrez
Tel: (011) 4962-6666/2247.
Hospital Nacional Prof. A. Posadas
Tel: (011) 4654-6648 / 658-7777.

PRESENTACIONES

STOPALER®: envases conteniendo 10 y 20 comprimidos recubiertos.

CONSERVACIÓN

Conservar en su envase original, a temperatura ambiente menor a 30°C. Proteger de la luz, humedad y calor excesivo.

MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS.

Fecha de última revisión: Abril de 2010.

Especialidad Medicinal autorizada por el Ministerio de Salud.
Certificado Nº 44.497.

2005120140 A

Megalabs
Megalabs Argentina S.A.U.
Cuba 2760 - Buenos Aires
Director Técnico: Gustavo H. Aguirre - Farmacéutico

medihealth