

## FICHA TÉCNICA

### NOMBRE DEL PRODUCTO

ALERGIZINA 5mg/5mL Jarabe

### COMPOSICIÓN

Cada 5mL de Jarabe contiene:

Cetirizina clorhidrato..... 5mg

Excipientes c.s.p..... 5mL

Sacarosa, sorbitol solución, propilenglicol, ácido cítrico anhidro, citrato de sodio, metilparabeno, propilparabeno, esencia de fresa, alcohol etílico, agua purificada.

### INDICACIONES Y USO CLINICO

#### Subconjuntos de pacientes

**Adultos y niños de 12 años de edad y mayores:** Alergizina (cetirizina clorhidrato) está indicado para el alivio rápido de síntomas nasales y no nasales asociados con rinitis alérgica estacional y perenne (es decir, estornudos, rinorrea, secreción posnasal, taponamiento/congestión nasal, lagrimeo y enrojecimiento de los ojos, picazón en la nariz/garganta) y urticaria crónica idiopática (por ejemplo, prurito y urticaria).

**Pediatría - Niños de 2 a 12 años de edad:** Alergizina (cetirizina clorhidrato) está indicada para el alivio de los síntomas asociados con rinitis alérgica estacional. Cetirizina clorhidrato también está indicado para el alivio rápido y duradero de la picazón debido a reacciones alérgicas cutáneas como urticaria.

El taponamiento/congestión nasal y los síntomas de picazón en la nariz/garganta no se han estudiado adecuadamente en el subgrupo de pacientes pediátricos de 2-12 años de edad. La efectividad de cetirizina clorhidrato en el tratamiento de síntomas asociados con la rinitis alérgica perenne y la urticaria idiopática crónica no se han establecido en este grupo de edad.

### CONTRAINDICACIONES

Alergizina (cetirizina clorhidrato) está contraindicado en aquellos pacientes con hipersensibilidad conocida a cetirizina, a su compuesto original, hidroxicina o derivados de piperazina, en pacientes hipersensibles a cualquier otro ingrediente en la formulación o en pacientes con insuficiencia renal grave (menos de 10 mL/min de aclaramiento de creatinina).

### ADVERTENCIA Y PRECAUCIONES

#### General

Raramente se han notificado reacciones cutáneas graves, como pustulosis exantematosa aguda generalizada (AGEP) con productos que contienen cetirizina. Esta erupción pustulosa aguda puede exhibir un inicio temprano o tardío con numerosas pústulas pequeñas, en su mayoría no foliculares, que surgen en un eritema edematoso generalizado localizado principalmente en los pliegues de la piel, tronco y extremidades superiores, que pueden ir acompañadas de fiebre. Los pacientes deben ser monitoreados cuidadosamente.

Si los síntomas persisten o empeoran, o si aparecen nuevos síntomas, el paciente debe suspender su uso y consultar a un médico.

**Actividades que requieren alerta mental:** Los estudios que utilizan mediciones objetivas no han demostrado ningún efecto de cetirizina clorhidrato sobre la función cognitiva, el rendimiento motor o la latencia del sueño en voluntarios sanos. Sin embargo, En ensayos clínicos se ha observado la aparición de algunos efectos sobre el SNC, particularmente somnolencia. Si la somnolencia ocurre, se debe aconsejar a los pacientes que no conduzcan ni operen maquinaria y que eviten el uso concurrente de cetirizina clorhidrato con sustancias sedantes porque las reducciones adicionales en el estado de alerta y el deterioro adicional del rendimiento del SNC pueden ocurrir. (Ver Interacciones farmacológicas).

#### Poblaciones especiales

**Mujeres embarazadas:** No se produjeron efectos teratogénicos por dosis orales tan altas como 60, 188 y 133 veces la dosis máxima humana estudiada clínicamente en ratones, ratas y conejos, respectivamente. No se observaron efectos sobre la reproducción y la fertilidad a dosis tan altas como 40 y 10 veces la dosis humana máxima recomendada en ratones machos y hembras, respectivamente. Una dosis oral de 60 veces la dosis humana máxima estudiada clínicamente en ratones hembra no afectó el parto o lactancia. Aunque los estudios en animales no son indicativos

de ningún efecto adverso durante el embarazo a dosis clínicamente relevantes, tales estudios no siempre predicen una respuesta humana. No existen estudios adecuados y bien controlados. En mujeres embarazadas hasta que tales datos estén disponibles, cetirizina clorhidrato no debe usarse durante el embarazo, a menos que un médico le indique lo contrario.

**Mujeres lactantes:** Los estudios en perros beagle indican que aproximadamente el 3% de la dosis se excreta en la leche. El grado de excreción en la leche humana es desconocida. No se recomienda el uso de cetirizina clorhidrato en madres lactantes, a menos que un médico indique lo contrario.

**Pediatría:** a menos que un médico indique lo contrario, cetirizina clorhidrato no debe administrarse a niños menores de 2 años de edad. (Ver DOSIS Y ADMINISTRACIÓN).

**Geriatría:** Cetirizina clorhidrato fue bien tolerado por pacientes mayores de 65 años. La eliminación de cetirizina clorhidrato se reduce en proporción al aclaramiento de creatinina. En pacientes cuyo aclaramiento de creatinina se reduce (es decir, aquellos con insuficiencia renal moderada), se recomienda una dosis inicial de 5 mg día (ver FARMACOCINÉTICA HUMANA).

Se han producido ocasionalmente casos de elevación de la prueba de función hepática (transaminasa) durante la terapia con cetirizina clorhidrato. Esta incidencia fue del 1,6% en los ensayos a corto plazo y del 4,4% en los ensayos de 6 meses. Estas elevaciones de las enzimas hepáticas, principalmente ALT, fueron generalmente reversibles. No hubo evidencia de ictericia o hepatitis, y la importancia clínica es actualmente desconocida. En consecuencia, cetirizina clorhidrato debe usarse con precaución en pacientes con enfermedad hepática preexistente. En pacientes con insuficiencia hepática moderada, se recomienda una dosis inicial de 5 mg.

**Uso en asmáticos:** Cetirizina clorhidrato se ha administrado de forma segura a pacientes con asma leve a moderada. Cetirizina clorhidrato no causó exacerbación de los síntomas de asma.

## REACCIONES ADVERSAS

### Ensayo clínico de Reacciones adversas al medicamento

Debido a que los ensayos clínicos se llevan a cabo en condiciones muy específicas, las tasas de reacciones adversas observadas en los ensayos clínicos pueden no reflejar las tasas observadas en la práctica y no deben compararse con las tasas en los ensayos clínicos de otro medicamento. La información sobre la reacción adversa al medicamento de los ensayos clínicos es útil para identificar efectos de los eventos adversos relacionados con los medicamentos y para tasas aproximar las tasas.

En los programas de desarrollo clínico (nacional e internacional), cetirizina clorhidrato ha sido evaluado en más de 6000 pacientes tratados a dosis diarias que varían de 5 a 20 mg. Las reacciones adversas más comunes fueron dolor de cabeza y somnolencia (véase el párrafo a continuación). La incidencia de dolor de cabeza asociado con cetirizina clorhidrato no fue diferente del placebo. La incidencia de somnolencia asociada con cetirizina clorhidrato estuvo relacionado con la dosis y fue predominantemente leve a moderado. El perfil de reacciones adversas en niños muestra una menor incidencia de somnolencia.

La incidencia de somnolencia reportada en ensayos de eficacia controlados con placebo con cetirizina no debe malinterpretarse ya que estos estudios no fueron diseñados ni potenciados para evaluar la somnolencia o la falta de somnolencia. Varios estudios placebo controlados que involucran pruebas objetivas y subjetivas en voluntarios sanos han demostrado que cetirizina clorhidrato a dosis de hasta a 10 mg no difirió significativamente del placebo con respecto al deterioro del SNC o el desempeño de la tarea.

La mayoría de las reacciones adversas reportadas durante el tratamiento con cetirizina clorhidrato en ensayos clínicos fueron de leve a moderada. La incidencia de interrupción debido a reacciones adversas en pacientes que recibieron cetirizina clorhidrato no fue significativamente diferente del placebo (1.0% vs 0.6%, respectivamente, en ensayos controlados con placebo). No hubo diferencia por género o por peso corporal con respecto a la incidencia de reacciones adversas.

Han ocurrido casos esporádicos, transitorios y reversibles de elevaciones de transaminasas hepáticas durante la terapia con cetirizina clorhidrato sin evidencia de ictericia, hepatitis u otros hallazgos clínicos.

Las reacciones adversas que se notificaron con una incidencia superior a 1/50 (2%) en los ensayos clínicos se enumeran en las Tablas 1 y 2.

**TABLA 1**  
**REACCIONES ADVERSAS REPORTADAS EN ENSAYOS PLACEBO-CONTROLADOS CON CETIRIZINA CLORHIDRATO (DOSIS MÁXIMA DE 10 mg) A TASAS DE 2% O MAYOR (Porcentaje de incidencia)**

Experiencia Adversa	Cetirizina Clorhidrato (N=3260)	Placebo (N=3061)	Diferencia de porcentaje
Dolor de cabeza	7.42	8.07	(0.65)*
Boca seca	2.09	0.82	1.27
Somnolencia	9.63	5.00	4.63

()\*= Mayor frecuencia en el grupo placebo

**TABLA 2**  
**REACCIONES ADVERSAS REPORTADAS EN ENSAYOS PLACEBO-CONTROLADOS CON CETIRIZINA CLORHIDRATO EN ESTADOS UNIDOS (DOSIS DIARIA TOTAL 20 mg) A TASAS DE 2% O MAYOR (Porcentaje de incidencia)**

Experiencia Adversa	Cetirizina Clorhidrato 20 mg (N=272)	Placebo (N=671)	Diferencia de porcentaje
Somnolencia	23.9%	7.7%	16.2
Dolor de cabeza	16.5	18.8	(2.3)*
Boca seca	7.7	1.5	6.2
Fatiga	7.0	2.4	4.6
Nausea	2.9	4.2	(1.3)*

()\*= Mayor frecuencia en el grupo placebo

Los siguientes eventos se observaron con poca frecuencia (igual o inferior al 2%), en 3982 pacientes que recibieron cetirizina clorhidrato en ensayos mundiales, incluido un estudio abierto de 6 meses de duración; no se ha establecido una relación causal con la administración de cetirizina clorhidrato.

**Sitio de aplicación:** reacción en el sitio de aplicación, inflamación en el sitio de inyección.

**Sistema nervioso autónomo:** anorexia, retención urinaria, enrojecimiento, aumento de saliva.

**Cardiovascular:** palpitación, taquicardia, hipertensión, arritmia, insuficiencia cardíaca.

**Sistema nervioso central y periférico:** fatiga, mareos, insomnio, parestesia nerviosa, confusión, hipercinesia, hipertonía, migraña, temblor, vértigo, calambres en las piernas, ataxia, disfonía, coordinación anormal, hiperestesia, hipoestesia, mielitis, parálisis, ptosis, trastorno del habla, espasmos, defectos del campo visual.

**Endocrino:** trastorno de la tiroides

**Gastrointestinales:** náuseas, faringitis, aumento del apetito, dispepsia, dolor abdominal, diarrea, flatulencia, estreñimiento, vómitos, estomatitis ulcerosa, trastorno de la lengua, caries dental agravada, estomatitis, decoloración de la lengua, edema de lengua, gastritis, hemorragia del recto, hemorroides, melena, función hepática anormal.

**Genitourinario:** poliuria, infección del tracto urinario, cistitis, disuria, hematuria, orina anormal

**Audición y vestibular:** dolor de oído, tinnitus, sordera, ototoxicidad.

**Metabólico / Nutricional:** sed, edema, deshidratación, diabetes mellitus.

**Musculoesquelético:** mialgia, artralgia, trastorno óseo, artrosis, trastorno del tendón, artritis, debilidad muscular.

**Psiquiátrico:** depresión, labilidad emocional, deterioro de la concentración, ansiedad, despersonalización, paranoia, pensamiento anormal, agitación, amnesia, disminución de la libido, euforia.

**Mecanismo de resistencia:** curación deteriorada, herpes simple, infección, infección por hongos, infección viral.

**Sistema respiratorio:** epistaxis, rinitis, tos, trastorno respiratorio, broncoespasmo, disnea, infección del tracto respiratorio superior, hiperventilación, sinusitis, aumento del esputo, bronquitis, neumonía.

**Reproductivo:** dismenorrea, trastorno menstrual, dolor de seno femenino, sangrado intermenstrual, leucorrea, menorragia, embarazo no deseado, vaginitis, trastorno testicular

**Reticuloendotelial:** linfadenopatía

**Piel:** prurito, erupción cutánea, trastorno de la piel, piel seca, urticaria, acné, dermatitis, erupción eritematosa, aumento de la sudoración, alopecia, angioedema, furunculosis, erupción ampollosa,

eccema, hiperqueratosis, hipertrichosis, fotosensibilidad, reacción tóxica de fotosensibilidad, erupción maculopapular, seborrea, púrpura.

**Sentidos especiales:** alteración del gusto, pérdida del gusto, parosmia

**Visión:** anomalía ocular, visión anormal, dolor ocular, conjuntivitis, xeroftalmia, glaucoma, hemorragia ocular.

**Cuerpo en general:** aumento de peso, dolor de espalda, malestar general, dolor, dolor en el pecho, fiebre, astenia, edema generalizado, edema periorbital, edema periférico, rigores, edema en las piernas, edema facial, sofocos, abdomen agrandado, reacción alérgica, pólipos nasales.

El perfil de reacciones adversas en niños es similar al de adultos, sin embargo hay una menor incidencia de somnolencia. (En general 3.7% versus 0.84% para niños que reciben placebo) y una mayor incidencia de dolor abdominal, faringitis, tos y epistaxis, como se indica en la Tabla 3 a continuación. Las Reacciones adversas a medicamentos en un índice de 1% o más en niños de 6 meses a 12 años, incluidos en ensayos clínicos o farmacológicos controlados con placebo son:

**TABLA 3**  
**REACCIONES ADVERSAS MÁS COMUNES REPORTADA EN ENSAYOS PEDIÁTRICOS PLACEBO – CONTROLADOS**

Reacción adversa	Placebo (N=239)	Cetirizina 5mg (N=161)	Cetirizina 10mg (N=144)
Dolor de cabeza	10.9	11.2	12.5
Dolor abdominal	2.1	4.4	6.3
Faringitis	3.8	6.2	4.2
Tos	3.4	4.4	3.5
Epistaxis	2.5	3.7	2.8
Somnolencia	0.8	1.9	4.2
Nausea	2.1	1.9	4.2

#### **Reacciones adversas a medicamentos menos comunes en ensayos clínicos (<1%)**

El aumento de peso se informó como un evento adverso en el 0,4% de los pacientes con cetirizina en ensayos controlados con placebo. En un estudio abierto de 6 meses de duración, el aumento de peso promedio fue de 2.8% después de 20 semanas, sin aumento adicional a las 26 semanas.

En un estudio de 6 semanas controlado con placebo de 186 pacientes con rinitis alérgica y asma leve a moderada, cetirizina clorhidrato 10 mg o.d. mejoró los síntomas de rinitis y no alteró la función pulmonar. Este estudio respalda la seguridad de administrar cetirizina clorhidrato a pacientes con rinitis alérgica con asma leve a moderada.

#### **Hallazgos anormales de química hematológica y clínica.**

Casos esporádicos, transitorios y reversibles de elevación de transaminasas hepáticas ocurrieron durante el tratamiento con cetirizina.

#### **Reacciones adversas a medicamentos posteriores a la comercialización**

Las reacciones adversas a medicamentos adicionales identificadas durante la experiencia postcomercialización con cetirizina incluyen: visión borrosa, hinchazón de los ojos, sensación anormal, enuresis, función hepática anormal (aumento de transaminasas, fosfatasa alcalina, alanina aminotransferasa, aspartato aminotransferasa y  $\gamma$ -glutamyl transferasa), disfunción eréctil, alucinaciones, disgeusia, discinesia, distonía, deterioro de la memoria, temblor, artralgia, retención urinaria, prurito al retirarse y aumento de peso.

En la experiencia posterior a la comercialización, se han informado los siguientes eventos adversos graves, raros pero potenciales: anemia hemolítica, trombocitopenia, discinesia orofacial, hipotensión grave, anafilaxia, hepatitis, glomerulonefritis, muerte fetal, colestasis y pustulosis exantematosa aguda generalizada. Además, se han informado casos aislados de las siguientes reacciones adversas al medicamento: convulsiones, síncope, agresión e hipersensibilidad.

#### **INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS**

##### **Visión General**

Los estudios de interacción con cetirizina clorhidrato y alcohol o diazepam indican que a dosis terapéuticas, cetirizina clorhidrato no aumenta el deterioro del rendimiento motor y mental inducido por el alcohol o el diazepam.

El medicamento no debe usarse con sustancias sedantes como el alcohol y algunos otros medicamentos, incluidos los medicamentos contra la ansiedad, el sueño, los antihistamínicos, los antidepresivos, los relajantes musculares o los analgésicos recetados debido a posibles interacciones.

### **Interacciones medicamento/medicamento**

No se han encontrado interacciones farmacológicas clínicamente significativas con teofilina, pseudoefedrina, cimetidina, eritromicina y ketoconazol. Los datos epidemiológicos sugieren que tampoco habría interacción con otros antibióticos macrólidos o antifúngicos de imidazol. En ensayos clínicos, cetirizina clorhidrato ha sido administrado de forma segura con agonistas beta, medicamentos antiinflamatorios no esteroideos, anticonceptivos orales, analgésicos narcóticos, corticosteroides, antagonistas H<sub>2</sub>, cefalosporinas, penicilinas, hormonas tiroideas y diuréticos tiazídicos. Si la somnolencia ocurre, se debe evitar el uso concurrente de cetirizina clorhidrato con sustancias sedantes debido a reducciones adicionales en el estado de alerta y el deterioro adicional del rendimiento del SNC pueden ocurrir. (Ver Actividades que requieren alerta mental). Basado en (1) su nivel relativamente bajo de eliminación metabólica, (2) ningún efecto sobre los intervalos QT corregidos a concentraciones plasmáticas tres veces los niveles máximos terapéuticos, y (3) no hay interacciones aparentes con ketoconazol o eritromicina, es poco probable que la cetirizina tenga interacciones clínicamente significativas con otros macrólidos como claritromicina u otros antifúngicos imidazoles como el itraconazol en pacientes con función renal y hepática normal. Aunque no hay datos disponibles con estos otros medicamentos en este momento, no hay evidencia epidemiológica (la base de datos de seguridad compuesta por 6.490 pacientes evaluados en estudios estadounidenses y canadienses) de interacciones entre antibióticos macrólidos y / o antifúngicos de imidazol por vía oral, y cetirizina / hidroxicina. Los datos epidemiológicos no sugieren un aumento de los eventos adversos, cardíacos o no cardíacos, en pacientes tratados con cetirizina y macrólido concomitante o medicamento antimicótico imidazol.

### **DOSIS Y ADMINISTRACION**

#### **Dosificación recomendada y ajuste de dosis.**

La dosis inicial recomendada de cetirizina clorhidrato es de 5 a 10 mg, según la gravedad del síntoma, administrada en una sola dosis diaria, con o sin alimentos. Si no se obtiene una respuesta suficiente, la dosis puede aumentarse y prescribirse según sea necesario hasta la dosis diaria máxima recomendada de 20 mg. El tiempo de administración, con o sin alimentos, puede variar según las necesidades individuales del paciente.

En pacientes con insuficiencia hepática y/o renal moderada o adultos de 65 años y más, se recomienda una dosis inicial de 5 mg/día.

Cetirizina clorhidrato no debe administrarse a niños menores de 2 años de edad, a menos que lo indique un médico.

Los estudios clínicos hasta la fecha respaldan el tratamiento por hasta 6 meses, por lo que se aconseja una recomendación médica para el uso a largo plazo

Instrucciones específicas de dosificación para varias formas de dosificación de cetirizina clorhidrato se proporcionan a continuación:

#### **Jarabe (tomado con o sin comida):**

**Niños de 2 a 6 años de edad:** 5 mL de jarabe administrados una vez al día. Para la dosificación de dos veces al día, 2.5 mL de jarabe en mañana y 2.5 mL de jarabe por la tarde.

**Niños de 6 a 12 años de edad:** 10 mL de jarabe una vez al día. Para la dosificación de dos veces al día, 5 mL por la mañana y 5 mL por la tarde.

**Adultos y niños de 12 años de edad y mayores:** 5 o 10 mL de jarabe una vez al día.

**Adultos mayores de 65 años y más:** 5 mL de jarabe una vez al día. Consulte a un médico si no está seguro acerca de la dosis.

### **SOBREDOSIS**

Se ha informado sobredosis con cetirizina clorhidrato. Los síntomas observados después de una sobredosis de cetirizina se asocia principalmente con los efectos del SNC o con síntomas que podrían sugerir un efecto anticolinérgico. Los eventos adversos reportados después de una ingesta de al menos 5 veces la dosis diaria recomendada son: confusión, diarrea, mareos, fatiga, dolor de cabeza, malestar, midriasis, prurito, inquietud, sedación, somnolencia, estupor, taquicardia, hipertensión, temblor y retención urinaria. Se ha observado hiperactividad y letargo severo en niños. Si ocurre una sobredosis aguda, se debe considerar la evacuación del estómago durante las primeras horas después de esta sobredosis. El tratamiento debe ser sintomático y de soporte

teniendo en cuenta los medicamentos ingeridos concomitantemente. No se conoce un antídoto específico para cetirizina clorhidrato. Cetirizina clorhidrato no se elimina eficazmente mediante diálisis, y la diálisis será ineficaz a menos que se haya ingerido concomitantemente un agente dializable. La dosis oral mínima letal en roedores es al menos 590 veces la dosis máxima clínicamente estudiada.

Para el manejo de una sospecha de sobredosis medicamentosa, comuníquese con un Centro de Control Toxicológico inmediatamente.

## **ACCION Y FARMACOLOGIA CLINICA**

### **Mecanismo de Acción**

Cetirizina clorhidrato, un metabolito humano activo de la hidroxicina, es un compuesto antialérgico del receptor H<sub>1</sub> de la histamina; sus principales efectos están mediados por la inhibición selectiva de los receptores H<sub>1</sub> periféricos. Cetirizina clorhidrato se distingue de otros antagonistas del receptor H<sub>1</sub> de histamina por la presencia de una función de ácido carboxílico. Esta diferencia puede ser en parte responsable de la selectividad de cetirizina clorhidrato visto en modelos farmacológicos y sus propiedades farmacocinéticas distintivas en humanos.

### **Farmacodinamia**

La actividad antihistamínica de cetirizina clorhidrato ha sido bien documentada en una variedad de modelos animales y humanos. Los modelos animales in vivo han mostrado una actividad anticolinérgica o antiserotonérgica insignificante. Estudios de unión a receptores in vitro no han detectado afinidad medible para otros receptores que distintos de H<sub>1</sub>. Los estudios autorradiográficos han demostrado una penetración insignificante en el cerebro. La cetirizina administrada por vía sistémica no ocupa significativamente los receptores H<sub>1</sub> cerebrales. Varios estudios que involucran pruebas objetivas y subjetivas en voluntarios sanos han demostrado que cetirizina clorhidrato en dosis de hasta 10 mg no fue significativamente diferente del placebo con respecto al deterioro del SNC, somnolencia diurna, tiempos de reacción, estado de alerta mental, desempeño de tareas, depresión objetiva del SNC y otras pruebas de la función cognitiva.

Cetirizina clorhidrato no exacerba el asma y es eficaz en una variedad de trastornos mediados por histamina. Las dosis orales de 5-20 mg en adultos humanos inhiben fuertemente la erupción cutánea y la respuesta causada por la inyección intradérmica de histamina. El inicio de la actividad ocurre dentro de los 20 (50% de los sujetos) a 60 (95% de los sujetos) minutos y persiste durante al menos 24 horas después de una dosis única. También se inhiben los efectos de la inyección intradérmica de varios otros mediadores o liberadores de histamina, así como los componentes de la cascada de alergias, incluida la respuesta inflamatoria alérgica cutánea a la exposición al antígeno.

En niños de 2 a 12 años, con antecedentes documentados de rinitis alérgica inducida por polen, el tratamiento una vez al día con 5 mg o 10 mg de cetirizina suprimió significativamente la respuesta de ronchas y la respuesta a la histamina, con el inicio de acción que ocurre dentro de 1 hora y persiste durante 24 horas después de la dosis inicial; la supresión significativa de la erupción de las ronchas y la respuesta persistió al repetir el tratamiento una vez al día durante 35 días y estuvo acompañado de mejoras significativas en síntomas nasales y oculares.

## **FARMACOCINETICA**

**Absorción:** En adultos, cetirizina clorhidrato se absorbe rápidamente después de la administración oral. Los niveles plasmáticos máximos después de una dosis de 10 mg son aproximadamente 300 ng/mL y ocurre aproximadamente a 1 hora. La administración conjunta de cetirizina clorhidrato con los alimentos no afecta la biodisponibilidad medida por el AUC, pero la absorción se retrasa en aproximadamente 1 hora, con un 23% menos de C<sub>max</sub>.

Si bien una comida rica en grasas no afecta el grado de absorción de la cetirizina tableta de desintegración oral (TDO) según lo medido por AUC<sub>T</sub>, la absorción se retrasa en aproximadamente 3 horas y la C<sub>máx</sub> se reduce en aproximadamente un 37% cuando el TDO se administra con una comida rica en grasas en relación con el TDO administrado en ayunas.

**Distribución:** la unión a proteínas plasmáticas es del 93% en el rango de concentración observado en estudios clínicos.

**Metabolismo:** en adultos, cetirizina clorhidrato se metaboliza menos que otros antihistamínicos y aproximadamente el 60% de una dosis administrada se excreta sin cambios en 24 horas. La alta biodisponibilidad se asocia con una variación generalmente baja entre los sujetos en los niveles sanguíneos. Se atribuye principalmente al bajo metabolismo de primer paso. Solo un metabolito ha sido identificado en humanos: el producto de la desalquilación oxidativa del grupo carboximetilo terminal. La actividad antihistamínica de este metabolito es insignificante.

**Excreción:** la vida media de eliminación plasmática es de aproximadamente 8 a 9 horas y no cambia con la administración de dosis múltiples. La farmacocinética es independiente de la dosis y los niveles plasmáticos son proporcionales a la dosis administrada en el rango estudiado clínicamente de 5 a 20 mg.

En niños, en comparación con los adultos, la  $C_{max}$  y el AUC observados aumentan con la disminución de la edad, en relación inversa al peso corporal. Según la comparación entre estudios, la vida media de eliminación fue 33-41% más corta en niños que en adultos, con un peso corporal total normalizado el aclaramiento fue 33% mayor en niños entre 7 a 12 años de edad y de 88-111% mayor en niños que en adultos. La naturaleza de los metabolitos formados en los niños es desconocida en la actualidad. La tabla 4 a continuación compara parámetros farmacocinéticos típicos en niños versus adultos.

**TABLA 4**  
**PARAMETROS FARMACOCINETICOS TÍPICOS DE CETIRIZINA EN NIÑOS Y EN ADULTOS**

Parámetros	Adultos Dosis única de 10mg	Niños de 6-12 años Dosis única de 5mg
$C_{max}$ (ng/mL)	300	275
$T_{max}$ (hr)	1.1	1.1
$T_{1/2}$ (hr)	8.0	5.6
AUC (ng.hr/mL)	2871	2201
Recuperación urinaria (%)	60	40-50

#### **Poblaciones y condiciones especiales**

**Insuficiencia hepática / insuficiencia renal:** en pacientes con insuficiencia hepática y renal leve a moderada, el aclaramiento corporal total de cetirizina clorhidrato se reduce y el AUC y la vida media aumentan en aproximadamente 2 a 3 veces. El aclaramiento se reduce en proporción a la disminución del aclaramiento de creatinina. Los niveles plasmáticos no se ven afectados por la hemodiálisis. La semivida de eliminación plasmática en pacientes en diálisis es de aproximadamente 20 horas y el AUC plasmático aumenta aproximadamente tres veces.

**CONDICIONES DE ALMACENAMIENTO:** Almacenar a temperaturas no mayor a 30°C.

**TIEMPO DE VIDA ÚTIL:** 3 años

#### **NATURALEZA Y CONTENIDO DEL ENVASE**

Alergizina (cetirizina clorhidrato) jarabe está disponible en una solución transparente de olor y sabor a fresa. Se presentan en frasco PET Ámbar x 60mL.

#### **PRECAUCIONES ESPECIALES DE ELIMINACIÓN Y OTRAS MANIPULACIONES**

Ninguna especial.

La eliminación del medicamento no utilizado y de todos los materiales que hayan estado en contacto con él, se realizará de acuerdo con la normativa local.

#### **TITULAR DE LA COMERCIALIZACIÓN**

**INTIPHARMA S.A.C.**  
RUC 20428837780  
Calle Bolívar 270 Of. 701, Miraflores  
Lima-Perú

Responsable de la fabricación: Laboratorios Gabblan S.A.C.

#### **FECHA DE LA REVISIÓN DEL TEXTO**

Mayo 2020