

quá trình điều trị. Cần phải tiến hành thử chức năng thận khi có chỉ định.

Trường hợp suy thận:

Không cần giảm liều cefuroxim dùng đường tiêm cho các bệnh nhân có độ thanh thải creatinin > 20 ml/phút. Bệnh nhân có độ thanh thải < 20 ml/phút, cần hiệu chỉnh liều bằng cách giảm liều dùng một lần hoặc tăng khoảng thời gian giữa 2 lần dùng cefuroxim natri. Người lớn, độ thanh thải creatinin 10 - 20 ml/phút, dùng liều 750 mg, 12 giờ một lần; độ thanh thải creatinin < 10 ml/phút, dùng liều 750 mg một lần trong 24 giờ.

Người bệnh đang lọc máu: Dùng liều 750 mg vào cuối mỗi lần lọc máu. Người bệnh đang thẩm phân phúc mạc chu kỳ và đang lọc máu động mạch - tĩnh mạch chu kỳ, liều thích hợp thường là 750 mg/lần, ngày hai lần.

Với trẻ em bị suy thận, hiệu chỉnh liều cần tăng khoảng thời gian giữa 2 lần dùng thuốc, dựa trên nguyên tắc hiệu chỉnh như ở người lớn bị suy thận.

Cho đến nay cefuroxim axetil dùng đường uống chưa có thông tin về tính an toàn và hiệu lực ở bệnh nhân suy thận, những bệnh nhân suy thận dùng cefuroxim natri hiệu chỉnh liều theo hướng dẫn trên.

Tương tác thuốc

Tăng nồng độ cefuroxim: Probenecid làm giảm độ thanh thải cefuroxim ở thận, làm cho nồng độ cefuroxim trong huyết tương cao hơn và kéo dài hơn. Nồng độ đỉnh trong huyết tương và nửa đời thải trừ của cefuroxim tăng lên 30%, AUC tăng 50% khi uống cùng với probenecid.

Tăng độc tính: Cefuroxim dùng đồng thời với các thuốc kháng sinh aminoglycosid hoặc thuốc lợi tiểu mạnh (như furosemid) có thể làm tăng độc tính đối với thận, tương tự như với các cephalosporin. Giảm tác dụng của estrogen và progesteron: Cefuroxim axetil dùng đường uống có thể ảnh hưởng đến hệ vi khuẩn chí ở ruột, làm giảm tái hấp thu estrogen, do đó có thể làm giảm tác dụng của các thuốc tránh thai đường uống có chứa estrogen và progesteron.

Gây nhiễu kết quả xét nghiệm: Khi dùng cefuroxim, test Coombs dương tính giả, glucose niệu dương tính giả, xác định nồng độ glucose huyết bằng phương pháp ferricyanid cho kết quả âm tính giả.

Tương kỵ

Không nên dùng dung dịch tiêm natri bicarbonat để pha loãng cefuroxim.

Kháng sinh aminoglycosid (gentamicin, kanamycin, netilmicin, streptomycin, amikacin, tobramycin) tương kỵ với cefuroxim vì vậy không trộn lẫn cefuroxim natri với các kháng sinh này trong bất cứ túi/chai dịch truyền nào, đồng thời cũng không truyền đồng thời trên 1 dây truyền dịch hoặc qua 2 dây truyền khác nhau qua vị trí chữ Y.

Filgrastim, fluconazol, protamin, rapacuronium cũng đã được báo cáo là tương kỵ với cefuroxim axetil.

Quá liều và xử trí

Triệu chứng: Buồn nôn, nôn, và ỉa chảy. Tuy nhiên, có thể gây phản ứng tăng kích thích thần kinh - cơ và cơ co giật, nhất là ở người suy thận.

Xử trí: Cần quan tâm đến khả năng quá liều của nhiều loại thuốc, sự tương tác thuốc và dược động học bất thường ở người bệnh.

Bảo vệ đường hô hấp của người bệnh, hỗ trợ thông thoáng khí và truyền dịch. Nếu phát triển các cơn co giật, ngừng ngay sử dụng thuốc; có thể sử dụng liệu pháp chống co giật nếu có chỉ định về lâm sàng. Lọc máu có thể loại bỏ thuốc khỏi máu, nhưng phần lớn việc điều trị là hỗ trợ hoặc điều trị triệu chứng.

Cập nhật lần cuối: 2017.

CELECOXIB

Tên chung quốc tế: Celecoxib.

Mã ATC: M01AH01, L01XX33.

Loại thuốc: Thuốc chống viêm không steroid ức chế chọn lọc COX-2.

Dạng thuốc và hàm lượng

Viên nang: 50 mg, 100 mg, 200 mg, 400 mg.

Dược lực học

Celecoxib là một thuốc chống viêm không steroid, ức chế chọn lọc cyclooxygenase-2 (COX-2), có các tác dụng chống viêm, giảm đau, hạ sốt. Cơ chế tác dụng của celecoxib được coi là ức chế sự tổng hợp prostaglandin, chủ yếu thông qua tác dụng ức chế isoenzym cyclooxygenase-2 (COX-2), dẫn đến làm giảm sự tạo thành các prostaglandin. Khác với phần lớn các thuốc chống viêm không steroid có trước đây, celecoxib không ức chế isoenzym cyclooxygenase-1 (COX-1) với các nồng độ điều trị ở người. COX-1 là một enzym có ở hầu hết các mô, bạch cầu đơn nhân to và tiểu cầu. COX-1 tham gia vào quá trình tạo cục máu đông (như thúc đẩy tiểu cầu ngưng tập) duy trì hàng rào niêm mạc dạ dày và chức năng thận (như duy trì tưới máu thận). Do không ức chế COX-1 nên celecoxib ít có nguy cơ gây các tác dụng phụ (thí dụ xuất huyết, viêm loét dạ dày, kéo dài thời gian chảy máu), nhưng có thể gây các tác dụng phụ ở thận tương tự như các thuốc chống viêm không steroid khác. Celecoxib có thể làm tăng nguy cơ huyết khối mạch máu ở một số bệnh nhân vì thuốc ức chế tổng hợp prostaglandin (một chất kháng huyết khối) và không tác động đến thromboxan A₂ (một chất dễ gây huyết khối). Ngoài ra, celecoxib còn có thể ngăn chặn tăng sinh tế bào ung thư đại tràng và làm giảm kích thước polyp đại trực tràng.

Dược động học

Hấp thu: Celecoxib hấp thu nhanh qua đường tiêu hóa. Uống celecoxib với thức ăn có nhiều chất béo làm chậm thời gian đạt nồng độ đỉnh trong huyết tương so với uống lúc đói khoảng 1 - 2 giờ và làm tăng 10 - 20% AUC. Có thể dùng celecoxib khi ăn hoặc xa các bữa ăn.

Nồng độ đỉnh trong huyết tương của thuốc thường đạt ở 3 giờ sau khi uống một liều duy nhất 200 mg lúc đói và trung bình bằng 705 nanogram/ml. Nồng độ thuốc ở trạng thái ổn định trong huyết tương đạt được trong vòng 5 ngày; không thấy có tích lũy. Ở người trên 65 tuổi, nồng độ đỉnh trong huyết tương và AUC tăng 40 và 50%, tương ứng, so với người trẻ; AUC của celecoxib ở trạng thái ổn định tăng 40 hoặc 180% ở người suy gan nhẹ hoặc vừa, tương ứng, và giảm 40% ở người suy thận mạn tính (tốc độ lọc cầu thận 35 - 60 ml/phút) so với ở người bình thường.

Phân bố: Thể tích phân bố ở trạng thái ổn định khoảng 400 lít (khoảng 7,14 lít/kg) như vậy thuốc phân bố nhiều vào mô. Ở nồng độ điều trị trong huyết tương, 97% celecoxib gắn với protein huyết tương. Celecoxib có khả năng phân bố vào sữa mẹ.

Chuyển hóa: Celecoxib được chuyển hóa chủ yếu trong gan bởi isoenzym CYP450 2C9 thành các chất chuyển hóa không có hoạt tính dược lý như các thuốc ức chế enzym COX-1 và COX-2.

Thải trừ: Nửa đời thải trừ trong huyết tương của celecoxib sau khi uống lúc đói là 11 giờ và hệ số thanh thải trong huyết tương khoảng 500 ml/phút. Nửa đời thải trừ của thuốc kéo dài ở người suy thận là 13,1 giờ và suy gan là 11 giờ hoặc 13,1 giờ. Celecoxib thải trừ khoảng 27% trong nước tiểu và 57% trong phân, dưới 3% liều được thải trừ không thay đổi.

Chỉ định

Điều trị triệu chứng thoái hóa khớp ở người lớn.

Điều trị triệu chứng viêm khớp dạng thấp ở người lớn.

Điều trị đau cấp.

Điều trị thống kinh nguyên phát.

Chống chỉ định

Mẫn cảm với celecoxib, sulfonamid.

Viêm loét dạ dày tá tràng tiến triển hoặc chảy máu dạ dày ruột.

Bệnh thiếu máu cục bộ cơ tim, bệnh mạch ngoại biên, bệnh mạch não.

Suy tim sung huyết độ II - IV theo phân loại NYHA.

Suy thận nặng ($Cl_{cr} < 30$ ml/phút).

Suy gan nặng (albumin huyết tương dưới 25 g/l hoặc điểm Child-Pugh ≥ 10).

Bệnh viêm ruột (bệnh Crohn, viêm loét đại tràng).

Tiền sử bị hen, viêm mũi cấp, polyp mũi, phù mạch thần kinh, mày đay hoặc các phản ứng kiểu dị ứng khác sau khi dùng aspirin hoặc các thuốc chống viêm không steroid khác. Đã có báo cáo về các phản ứng kiểu phản vệ nặng, đôi khi gây chết, với các thuốc chống viêm không steroid ở những người bệnh này.

Không dùng giảm đau trong thời gian ghép nối tắt động mạch vành.

Phụ nữ đang mang thai và phụ nữ có khả năng mang thai trừ khi đang dùng một biện pháp tránh thai có hiệu quả cao. Celecoxib gây dị tật thai nhi trong hai nghiên cứu trên động vật. Nguy cơ trên phụ nữ mang thai chưa rõ nhưng cũng chưa thể loại trừ.

Phụ nữ cho con bú.

Thận trọng

Người có tiền sử loét dạ dày tá tràng, hoặc chảy máu đường tiêu hóa, mặc dù thuốc được coi là không gây tai biến đường tiêu hóa do ức chế chọn lọc COX-2.

Người cao tuổi, suy nhược vì dễ gây chảy máu đường tiêu hóa và thường chức năng thận bị suy giảm do tuổi.

Celecoxib có thể gây độc cho thận, nhất là khi duy trì lưu lượng máu qua thận phải cần đến prostaglandin thận hỗ trợ. Cần rất thận trọng dùng celecoxib cho những người bệnh có nguy cơ cao như suy tim, suy thận hoặc suy gan.

Người bị phù, giữ nước (như suy tim, thận) vì thuốc gây ứ dịch, làm bệnh nặng lên.

Người bị mất nước ngoài tế bào (do dùng thuốc lợi tiểu mạnh). Cần phải điều trị tình trạng mất nước trước khi dùng celecoxib.

Vì chưa rõ celecoxib có làm giảm nguy cơ ung thư đại - trực tràng liên quan đến bệnh polyp dạng tuyến đại - trực tràng có tính chất gia đình hay không, cho nên vẫn phải tiếp tục chăm sóc bệnh này như thường lệ, nghĩa là phải theo dõi nội soi, cắt bỏ đại - trực tràng dự phòng khi cần. Ngoài ra, cần theo dõi nguy cơ biến chứng tim mạch (nhồi máu cơ tim, thiếu máu cơ tim cục bộ). Celecoxib không có hoạt tính nội tại kháng tiểu cầu và như vậy không bảo vệ được các tai biến do thiếu máu cơ tim, nhất là nếu dùng liều cao kéo dài (400 - 800 mg/ngày).

Nguy cơ huyết khối tim mạch:

Các thuốc NSAID, không phải aspirin, dùng đường toàn thân, có thể làm tăng nguy cơ xuất hiện biến cố huyết khối tim mạch, bao gồm cả nhồi máu cơ tim và đột quy, có thể dẫn đến tử vong. Nguy cơ này có thể xuất hiện sớm trong vài tuần đầu dùng thuốc và có thể tăng lên theo thời gian dùng thuốc. Nguy cơ huyết khối tim mạch được ghi nhận chủ yếu ở liều cao. Cần đánh giá định kỳ sự xuất hiện của các biến cố tim mạch, ngay cả khi bệnh nhân không có các triệu chứng tim mạch trước đó. Người bệnh cần được cảnh báo về các triệu chứng của biến cố tim mạch nghiêm trọng và cần thăm khám bác sĩ ngay khi có các triệu chứng này. Để giảm thiểu nguy cơ xuất hiện biến cố bất lợi, cần sử dụng thuốc ở liều hàng ngày thấp nhất có hiệu quả trong thời gian ngắn nhất có thể.

Thời kỳ mang thai

Cho tới nay, chưa có các nghiên cứu đầy đủ về celecoxib ở phụ nữ mang thai. Tuy nhiên các nghiên cứu độc tính trên thai thỏ với liều 150 mg/kg/ngày cho thấy tăng tỷ lệ khuyết tật vách ngăn tâm thất và bất thường ở các xương sườn thai. Vì vậy, chỉ nên dùng celecoxib cho phụ nữ mang thai khi lợi ích cao hơn nguy cơ có thể xảy ra đối với thai. Đặc biệt, không dùng celecoxib ở 3 tháng cuối của thai kỳ, vì các chất ức chế tổng hợp prostaglandin có thể có tác dụng xấu trên hệ tim mạch của thai.

Thời kỳ cho con bú

Celecoxib được thải trừ qua sữa mẹ ở chuột nuôi con, nồng độ tương tự như trong huyết tương. Tuy nhiên ở người, vẫn chưa có bằng chứng thuốc có phân bố vào sữa mẹ hay không. Do celecoxib có thể có ADR nghiêm trọng ở trẻ nhỏ bú sữa mẹ, cần cân nhắc lợi/hại hoặc ngừng cho bú, hoặc ngừng dùng celecoxib cho mẹ.

Tác dụng không mong muốn (ADR)

ADR của celecoxib ở liều thường dùng nói chung nhẹ và có liên quan chủ yếu đến đường tiêu hóa. ADR khiến phải ngừng dùng thuốc nhiều nhất gồm: Khó tiêu, đau bụng. Khoảng 7,1% người bệnh dùng celecoxib phải ngừng dùng thuốc vì ADR so với 6,1% người bệnh dùng placebo phải ngừng. Celecoxib đường dùng toàn thân có nguy cơ xảy ra huyết khối tim mạch (xem phần Thận trọng).

Thường gặp

Tiêu hóa: đau bụng, ỉa chảy, khó tiêu, đầy hơi, buồn nôn.

Hô hấp: viêm họng, viêm mũi, viêm xoang, nhiễm khuẩn đường hô hấp trên.

TKTW: mất ngủ, chóng mặt, đau đầu.

Tim mạch: tăng huyết áp, nhồi máu cơ tim.

Da: ban.

Chung: đau lưng, các triệu chứng giống cúm, phù ngoại biên.

Hiếm gặp

Tim mạch: ngất, suy tim sung huyết, rung thất, nghẽn mạch phổi, tai biến mạch máu não, hoại thư ngoại biên, viêm tĩnh mạch huyết khối, viêm mạch.

Tiêu hóa: tắc ruột, thủng ruột, chảy máu đường tiêu hóa, viêm đại tràng chảy máu, thủng thực quản, viêm tụy, tắc ruột.

Gan mật: bệnh sỏi mật, viêm gan, vàng da, suy gan.

Huyết học: giảm lượng tiểu cầu, mất bạch cầu hạt, thiếu máu không tái tạo, giảm toàn thể huyết cầu, giảm bạch cầu.

Chuyển hóa: giảm glucose huyết.

TKTW: mất điều hoà, hoang tưởng tự sát.

Thận: suy thận cấp, viêm thận kẽ.

Da: ban đỏ đa dạng, viêm da tróc, hội chứng Stevens-Johnson.

Chung: nhiễm khuẩn, chết đột ngột, phản ứng kiểu phản vệ, phù mạch.

Hướng dẫn cách xử trí ADR

Nếu có biểu hiện độc hại thận trong khi điều trị celecoxib, cần phải ngừng thuốc, thường chức năng thận sẽ trở về mức trước điều trị sau khi ngừng điều trị thuốc.

Test gan có thể tăng (gấp 3 lần mức bình thường ở giới hạn cao). Sự tăng này có thể tiến triển, hoặc không thay đổi hoặc chỉ tạm thời trong một thời gian khi tiếp tục điều trị. Nhưng nếu có biểu hiện nặng của viêm gan (vàng da, biểu hiện suy gan...) phải ngừng ngay thuốc.

Nói chung, khi dùng với liều thông thường và ngắn ngày, celecoxib dung nạp tốt.

Liều lượng và cách dùng

Cách dùng: Nuốt cả nang thuốc với nước. Nếu không được, có thể hòa với nước hoặc dịch trái cây rồi uống ngay vào bữa ăn hoặc xa bữa ăn. Dùng liều thấp nhất có hiệu quả và trong thời gian ngắn nhất phù hợp với mục đích điều trị. Nếu dùng liều 200 mg, ngày 2 lần,

có thể uống không cần chú ý đến bữa ăn. Nếu dùng liều cao hơn (400 mg, ngày 2 lần), phải uống với thức ăn để cải thiện hấp thu.

Liều lượng

Thoái hóa xương - khớp: Liều thông thường: 200 mg/ngày, uống 1 lần hoặc chia làm 2 liều bằng nhau. Liều cao hơn không có hiệu quả hơn.

Viêm khớp dạng thấp: Người lớn, liều thông thường: 100 - 200 mg/lần, ngày uống 2 lần, liều cao hơn không có tác dụng tốt hơn. Trẻ em 10 - 25 kg, liều 50 mg/lần, ngày 2 lần; Trẻ em > 25 kg, liều 100 mg/lần, ngày 2 lần.

Viêm cột sống dính khớp ở người lớn: Ngày 200 mg, uống 1 lần hoặc chia 2 lần. Nếu sau 6 tuần không có đáp ứng, liều có thể tăng lên 400 mg/ngày. Nếu sau 6 tuần tiếp theo với liều 400 mg/ngày không có đáp ứng, phải chuyển sang thuốc khác.

Polyp đại - trực tràng: Liều 400 mg/lần, ngày uống 2 lần. Theo nhà sản xuất, độ an toàn và hiệu quả của liệu pháp trên 6 tháng chưa được nghiên cứu.

Đau nói chung và thống kinh: Liều thông thường ở người lớn: 400 mg, uống 1 lần, tiếp theo 200 mg nếu cần, trong ngày đầu. Để tiếp tục giảm đau, có thể cho liều 200 mg/lần, ngày uống 2 lần, nếu cần.

Người cao tuổi: Trên 65 tuổi, không cần điều chỉnh liều, mặc dù nồng độ thuốc tăng trong huyết tương. Tuy nhiên, đối với người cao tuổi có trọng lượng cơ thể dưới 50 kg, phải dùng liều khuyến cáo thấp nhất khi bắt đầu điều trị.

Suy thận: Chưa được nghiên cứu và không khuyến cáo dùng cho người suy thận. Nếu cần thiết phải dùng celecoxib cho người suy thận nặng, phải giám sát cẩn thận chức năng thận. Nhà sản xuất không có khuyến cáo đặc biệt nào về điều chỉnh liều cho người suy thận mạn.

Suy gan: Chưa được nghiên cứu. Theo nhà sản xuất, không được dùng cho người bệnh suy gan nặng. Đối với suy gan vừa, nhà sản xuất khuyến cáo giảm liều khoảng 50%.

Tương tác thuốc

Chung: Chuyển hóa của celecoxib qua trung gian cytochrom P450 2C9 trong gan. Sử dụng đồng thời celecoxib với các thuốc có tác dụng ức chế enzym này có thể ảnh hưởng đến dược động học của celecoxib, nên phải thận trọng khi dùng đồng thời các thuốc này. Ngoài ra, celecoxib cũng ức chế cytochrom P450 2D6. Do đó có khả năng tương tác giữa celecoxib và các thuốc được chuyển hóa bởi P450 2D6.

Thuốc ức chế enzym chuyển angiotensin: Các thuốc chống viêm không steroid có thể làm giảm tác dụng chống tăng huyết áp của các thuốc ức chế enzym chuyển angiotensin. Cần chú ý đến tương tác này khi dùng celecoxib đồng thời với các thuốc ức chế enzym chuyển angiotensin.

Thuốc lợi tiểu: Các thuốc chống viêm không steroid có thể làm giảm tác dụng tăng bài tiết natri niệu của furosemid và thiazid ở một số bệnh nhân, có thể do ức chế tổng hợp prostaglandin và nguy cơ suy thận có thể gia tăng.

Aspirin: Mặc dù có thể dùng celecoxib cùng với liều thấp aspirin, việc sử dụng đồng thời hai thuốc chống viêm không steroid này có thể dẫn đến tăng tỷ lệ loét đường tiêu hóa hoặc các biến chứng khác, so với việc dùng celecoxib riêng rẽ. Vì không có tác dụng kháng tiểu cầu, celecoxib không phải là chất thay thế aspirin đối với việc dự phòng bệnh tim mạch.

Fluconazol: Dùng đồng thời celecoxib với fluconazol có thể dẫn đến tăng đáng kể nồng độ huyết tương của celecoxib. Tương tác dược động học này có vẻ do fluconazol ức chế isoenzym P450 2C9 có liên quan với sự chuyển hóa celecoxib. Nên bắt đầu điều trị celecoxib với liều khuyến dùng thấp nhất ở người bệnh dùng fluconazol đồng thời.

Lithi: Celecoxib có thể làm giảm sự thanh thải qua thận của lithi, điều này dẫn đến tăng nồng độ lithi trong huyết tương. Cần theo dõi chặt chẽ người bệnh dùng đồng thời lithi và celecoxib về các dấu hiệu độc của lithi và cần điều chỉnh liều cho phù hợp khi bắt đầu hoặc ngừng dùng celecoxib.

Warfarin: Các biến chứng chảy máu kết hợp với tăng thời gian prothrombin đã xảy ra ở một số người bệnh (chủ yếu người cao tuổi) khi dùng celecoxib đồng thời với warfarin. Do đó, cần theo dõi các xét nghiệm về đông máu như thời gian prothrombin, đặc biệt trong mấy ngày đầu sau khi bắt đầu hoặc thay đổi liệu pháp, vì các người bệnh này có nguy cơ biến chứng chảy máu cao.

Quá liều và xử trí

Triệu chứng: Quá liều các thuốc chống viêm không steroid có thể gây ngủ lịm, ngủ lơ mơ, buồn nôn, nôn, và đau vùng thượng vị; các biểu hiện này thường phục hồi với việc điều trị nâng đỡ. Cũng xảy ra chảy máu đường tiêu hóa. Các biểu hiện xảy ra hiếm hơn là tăng huyết áp, suy thận cấp, ức chế hô hấp và hôn mê. Các phản ứng kiểu phản vệ đã được thông báo với liều điều trị của thuốc chống viêm không steroid và có thể xảy ra khi quá liều.

Xử trí: Điều trị triệu chứng và nâng đỡ; không có thuốc giải độc đặc hiệu đối với thuốc chống viêm không steroid. Trong 4 giờ đầu sau dùng quá liều, liệu pháp gây nôn và/hoặc cho than hoạt (60 - 100 g cho người lớn, hoặc 1 - 2 g/kg cho trẻ em), và/hoặc một thuốc tẩy thẩm thấu có thể có ích đối với những người bệnh đã có biểu hiện bệnh lý hoặc đã uống một lượng thuốc quá lớn. Mặc dù chưa rõ celecoxib có loại được bằng thẩm tách máu hay không nhưng các biện pháp bài niệu cưỡng bức, kiểm hóa nước tiểu, thẩm tách máu, hoặc truyền máu có thể không có hiệu quả loại bỏ lượng lớn celecoxib khỏi cơ thể do thuốc gắn vào protein với tỷ lệ cao.

Cập nhật lần cuối: 2017.

CETIRIZIN HYDROCLORID

Tên chung quốc tế: Cetirizine hydrochloride.

Mã ATC: R06AE07.

Loại thuốc: Thuốc kháng histamin H₁ thế hệ hai.

Dạng thuốc và hàm lượng

Viên nén: 5 mg, 10 mg.

Viên nén nhai: 5 mg, 10 mg.

Viên nén phân tán trong miệng: 10 mg.

Viên nén bao phim: 5 mg, 10 mg.

Sirô: 1 mg/ml (118 ml, 120 ml).

Viên nang (chứa chất lỏng): 10 mg.

Dược lực học

Cetirizin là dẫn chất của piperazin và là chất chuyển hóa của hydroxyzin. Cetirizin là thuốc kháng histamin thế hệ hai, thuốc có tác dụng đối kháng mạnh và chọn lọc ở thụ thể H₁ ngoại vi, nhưng hầu như không có tác dụng đến các thụ thể khác, do vậy hầu như không có tác dụng đối kháng acetylcholin và không có tác dụng đối kháng serotonin. Cetirizin ức chế giai đoạn sớm của phản ứng dị ứng qua trung gian histamin và cũng làm giảm sự di dời của các tế bào viêm và giảm giải phóng các chất trung gian ở giai đoạn muộn của phản ứng dị ứng.

Tính phân cực của cetirizin tăng so với hydroxyzin nên phân bố của thuốc vào hệ TKTW giảm và ít tác động lên TKTW so với các thuốc kháng histamin thế hệ thứ nhất (diphenhydramin, hydroxyzin) nên ít gây buồn ngủ. Tuy nhiên, tỷ lệ người bệnh dùng cetirizin có ADR như ngủ gà lại cao hơn so với người bệnh dùng các thuốc kháng histamin thế hệ thứ hai khác như loratadin.