

## **Состав**

*действующее вещество:* эбастин;

1 таблетка содержит эбастина 10 мг;

*вспомогательные вещества:* маннит (Е 421), крахмал кукурузный, ароматизатор мятный, аспартам (Е 951), кремния диоксид коллоидный, натрия стеарилфумарат.

## **Лекарственная форма**

Таблетки, диспергируются в ротовой полости.

*Основные физико-химические свойства:* белые или почти белые круглые таблетки.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Антигистаминные средства для системного применения. Эбастин. Код АТХ R06A X22.

## **Фармакодинамика**

В процессе исследований *in vitro* и *in vivo* для эбастина было обнаружено релевантную аффинность по H<sub>1</sub>-рецепторов с быстрой и селективной их блокадой на длительное время.

После приема ни эбастин, ни его активный метаболит не переходят через гематоэнцефалический барьер. Эта особенность сопровождается низким уровнем седативного эффекта, что подтверждается экспериментальными исследованиями влияния Эбастин на центральную нервную систему.

Полученные в процессе исследований *in vitro* и *in vivo* данные показывают, что для Эбастин характерен мощный, долговечный и высокоселективный антагонистическое влияние на H<sub>1</sub>-рецепторы, в то же время лишен нежелательных центральных и антихолинергических эффектов.

Клинические свойства: исследование с помощью провоцируемых гистамином кожных реакций продемонстрировали статистически и клинически значимый антигистаминный эффект, который проявляется через час после приема препарата и затем сохраняется в течение более 48 часов. После окончания лечения, которое продолжалось в течение пяти дней, антигистаминное действие

сохраняется в течение 72 часов. Это действие подтверждается концентрацией в плазме существенного активного метаболита - карэбастина.

После повторного приема блокировки периферийных рецепторов оставалось на постоянном уровне, без быстрого снижения лечебного эффекта (тахифилаксии). Эти результаты подтверждают, что эбастин с дозировкой не менее 10 мг обеспечивает быструю, мощную, долговременную блокаду периферийных H1-рецепторов, кроме того, прием Эбастин может происходить ежедневно.

Седативный эффект был исследован путем фармакологического электроэнцефалографии, когнитивного тестирования, тестов глазодвигательной координации и на базе субъективной оценки.

При применении рекомендуемой терапевтической дозы не наблюдалось никакого существенного роста седативного действия. Эти результаты согласуются с результатами, полученными в процессе двойных слепых клинических исследований: уровень седативного эффекта Эбастин сравним с аналогичным показателем для плацебо.

### **Фармакокинетика**

После приема эбастин быстро абсорбируется в желудочно-кишечном тракте, при этом наблюдается эффект первого прохождения. Эбастин почти полностью превращается в фармакологически активный метаболит карэбастина. После однократного приема 10 мг максимальный уровень метаболита в плазме составляет около 80-100 нг / мл. Установление максимального уровня метаболита в плазме происходит через 2,5-4 часа после приема препарата. Период полувыведения метаболита составляет 15-19 часов. 66% Эбастин выделяются с мочой, преимущественно в виде сопряженных метаболитов. При повторном ежедневном приеме однократной дозы 10 мг через 3-5 дней устанавливается устойчивая равновесная концентрация с максимальной концентрацией в плазме крови от 130 до 160 нг / мл.

После приема однократной дозы 20 мг концентрация Эбастин в крови принимает максимальное значение за 1-3 часа со средним значением 2,8 нг / мл. Максимальная концентрация метаболита карэбастина составляет в среднем 157 нг / мл.

Исследования *in vitro* с микросомами человеческой печени показывают, что преобразования Эбастин на карэбастина происходит преимущественно путем CYP3A4. Связывание Эбастин и карэбастина с белками плазмы крови составляет более 95%. У пациентов пожилого возраста отсутствуют какие-либо релевантные изменения фармакокинетического профиля. Фармакокинетика Эбастин, как и

его активного метаболита карэбастина, линейная в пределах рекомендованного терапевтического диапазона дозирования 10-20 мг.

## **Показания**

*Симптоматическое лечение:*

- аллергический ринит (сезонный и круглогодичный), связанный или не связан с аллергическим конъюнктивитом;
- хроническая идиопатическая крапивница и аллергический дерматит.

## **Противопоказания**

Повышенная чувствительность к активному веществу или другим компонентам препарата. Возраст до 12 лет.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

Применение Эбастин совместно с кетоконазолом или эритромицином приводит к удлинению интервала QT на ЭКГ. В обоих случаях наблюдается фармакокинетические и фармакодинамические взаимодействия, что приводит к увеличению плазматического уровня Эбастин и, в меньшей степени, к карэбастина, без клинически значимых фармакодинамических последствий. QT при совместном применении увеличивался лишь на 10 мс по сравнению с применением кетоконазола или эритромицина отдельно. Следует с осторожностью применять препарат при совместном применении с азольными противогрибковыми препаратами (кетоконазол, итраконазол) и макролидами (например, эритромицин).

Фармакокинетическая взаимодействие наблюдалась при совместном применении Эбастин рифампицин, что может привести к снижению концентрации в плазме крови и терапевтического эффекта антигистаминных препаратов.

Взаимодействия Эбастин с теофиллином, варфарином, циметидином, диазепамом и алкоголем не было зафиксировано.

Во время приема Эбастин с едой уровне основного метаболита Эбастин в плазме крови и AUC (площадь под кривой «концентрация-время») растут от 1,5 до 2 раз. Это повышение не меняет T<sub>max</sub> (время достижения максимальной концентрации). Прием Эбастин совместно с пищей не влияет на его клинический эффект.

Препарат может влиять на результаты кожных аллергических тестов, поэтому рекомендуется прекратить применение препарата за 5-7 дней до их проведения.

Препарат может усиливать действие других антигистаминных препаратов.

### **Особенности применения**

Следует с осторожностью применять препарат пациентам с пролонгированным QT синдромом, гипокалиемией, при совместном лечении с другими лекарственными средствами, распространяют интервал QT или ингибируют энзим CYP3A4, такими как азольные противогрибковые препараты (кетоназол, итраконазол) и макролиды (например, эритромицин) .

Совместное применение Эбастин рифампицин может привести к фармакокинетического взаимодействия (см. Раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Для пациентов с легким, умеренным или тяжелой степенью почечной недостаточности, а также с легкой или умеренной степенью печеночной недостаточности отсутствует необходимость согласования дозирования (лечение в течение 5-7 дней). Отсутствует опыт применения препарата пациентам с тяжелой степенью печеночной недостаточности в дозе, превышающей 10 мг поэтому для пациентов с тяжелой степенью печеночной недостаточности доза не должна превышать 10 мг.

Поскольку терапевтический эффект наступает через 1-3 часа после применения, не следует применять его при острых аллергических реакциях в неотложных случаях.

Лекарственное средство содержит аспартам, который является производным фенилаланина, что может представлять опасность для больных фенилкетонурией.

### **Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами**

Проведено детальные исследования влияния на психомоторную функцию человека, которые подтвердили отсутствие негативного эффекта Эбастин. Лекарственное средство в рекомендуемых терапевтических дозах не влияет на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами.

Однако лицам с особой чувствительностью к Эбастин рекомендуется пройти дополнительный анализ на выявление индивидуальных реакций до момента

управления транспортным средством или выполнения пациентом сложных действий, поскольку препарат может вызывать сонливость или головокружение (см. Раздел «Побочные реакции»).

### **Применение в период беременности или кормления грудью**

*Беременность.* Есть лишь ограниченные данные по применению Эбастин беременным женщинам. Исследования на животных не подтверждают наличие прямого или опосредованного влияния препарата на репродуктивную функцию организма. Поэтому рекомендуется избегать применения Эбастин в период беременности.

*Период кормления грудью.* Высокая степень сочетание с белками (> 97%) Эбастин и его основного метаболита карэбастина, свидетельствует об отсутствии проникновения лекарственного средства в грудное молоко. В качестве меры пресечения, следует избегать применения Эбастин в период кормления грудью.

*Фертильность.* Данных о влиянии Эбастин на фертильность человека нет.

### **Способ применения и дозы**

Таблетку следует положить на язык. Любая жидкость не нужна. Прием пищи не влияет на эффективность препарата.

Рекомендуемая доза для взрослых и детей старше 12 лет - 10 мг (1 таблетка) 1 раз в сутки, в серьезных случаях суточная доза составляет 20 мг.

Пациенты пожилого возраста не требуется коррекции дозы.

Пациенты с почечной недостаточностью не требуется коррекции дозы.

Пациенты с печеночной недостаточностью легкой или средней степени тяжести не требуется коррекции дозы. Пациентам с тяжелой степенью печеночной недостаточности не следует превышать максимальную рекомендованную дозу 10 мг в сутки, поскольку данных о безопасности применения высоких доз препарата этим пациентам нет.

Срок лечения может продолжаться до исчезновения симптомов и определяется индивидуально.

### **Дети**

Препарат не рекомендован для применения детям до 12 лет.

## **Передозировка**

В исследованиях, проведенных с применением больших доз препарата, не наблюдалось клинически значимых признаков или симптомов при применении доз до 100 мг 1 раз в сутки. Специального антидота нет. В случае передозировки рекомендуется промывание желудка, медицинское наблюдение за жизненно важными функциями (ЭКГ), симптоматическое лечение.

## **Побочные реакции**

В общем анализе плацебо-контролируемых клинических исследований с участием 5708 пациентов, получавших эбастин, наиболее распространенными побочными реакциями были головная боль, сухость во рту и сонливость.

Побочное действие, о котором сообщали в клинических исследованиях, проведенных с участием детей (количество = 460), имеет те же характеристики, что и у взрослых.

*При оценке нежелательных эффектов применяли такие частоты:*

очень часто ( $\geq 1/10$ ), часто ( $\geq 1/100$ ,  $<1/10$ ), нечасто ( $\geq 1/1000$ ,  $<1/100$ ), редко ( $\geq 1/10000$ ,  $<1/1000$ ), очень редко ( $<1/10000$ ), или неизвестно (невозможность определения из-за отсутствия данных).

*Со стороны иммунной системы*

Редко реакции гиперчувствительности (анафилаксия и ангионевротический отек).

*Со стороны психики*

Редко нервозность, бессонница.

*Со стороны нервной системы*

Часто сонливость, головная боль.

Редко: головокружение, гипестезия, дисгезия.

*Со стороны сердца*

Очень редко усиленное сердцебиение, тахикардия.

*Респираторные, торакальные и медиастинальные нарушения*

Нечасто: кровотечение из носа, фарингит, ринит.

Очень редко синусит.

*Со стороны пищеварительной системы*

Часто сухость во рту.

Редко: тошнота, рвота, боль в животе, диспепсия.

*Нарушение функции печени и желчного пузыря*

Редко гепатит, холестаз, изменения функции печени при сдаче аналитических анализов (повышение уровня трансаминаз, гамма-глутамилтрансферазы, щелочной фосфатазы и билирубина).

*Со стороны кожи и подкожной ткани*

Очень редко: сыпь, крапивница, экзема, сыпь, дерматит.

*Со стороны репродуктивной системы и молочных желез*

Очень редко: нарушение менструального цикла, дисменорея.

*Общие нарушения и изменения в месте введения*

Редко отек, астения.

Неизвестно повышенный аппетит, увеличение веса.

### **Срок годности**

3 года.

### **Условия хранения**

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 ° С.

Хранить в недоступном для детей месте.

### **Упаковка**

По 10 таблеток в блистере, по 1 блистеру в картонной упаковке.

### **Категория отпуска**

Без рецепта.

**Производитель**

Фарма Вернигероде ГмбХ, Германия.

**Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

Дорнбергсвег 35, 38855 Вернигероде, Германия.

**Источник инструкции**

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).