

Состав

действующее вещество: ebastine;

1 таблетка, диспергируемая в полости рта, содержит ебастина 10 мг;

другие составляющие: маннит (Pearlitol 200SD) (E 421), кросповидон (Polyplasdone Ultra-10), кремния диоксид (Syloid 244FP), аспартам (Nutrasweet) (E 951), мята перечная, магния стеарат,

Лекарственная форма

Таблетки диспергируются в полости рта.

Основные физико-химические свойства: плоские круглые таблетки без оболочки от белого до почти белого цвета со скошенными краями, плоские с обеих сторон.

Фармакотерапевтическая группа

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

Фармакологические свойства

Фармакодинамика.

Механизм действия

Эбастин приводит к быстрому и длительному ингибированию эффектов, вызванных гистамином, и тем самым проявляет высокую аффинность к связыванию с H₁-рецепторами. После перорального применения ни эбастин, ни его метаболиты не проникают через гематоэнцефалический барьер. Данное свойство указывает на низкое седативное действие, наблюдавшееся при исследованиях влияния ебастина на ЦНС. Данные *in vitro* и *in vivo* указывают на то, что эбастин является мощным высокоселективным блокатором H₁-гистаминовых рецепторов длительного действия, не оказывает побочного действия на ЦНС и не обладает антихолинергической активностью.

Фармакодинамическое воздействие

Исследования индуцированных гистамином папул указывают на клиническую и статистическую антигистаминную активность ебастина, которая начинается через 1 час и длится более 48 часов. После пятидневного курса лечения Элртом

антигистаминная активность сохраняется в течение более 72 часов после прекращения применения. Данная активность подобна уровням главного активного метаболита каребастина в плазме крови.

После повторного приема ингибирования периферических рецепторов остается на постоянном уровне без развития тахифилаксии. Эти данные указывают на то, что ебастин в дозировке не менее 10 мг вызывает быстрое, интенсивное и длительное ингибирование периферических

H1-гистаминовый рецептор сохраняется при приеме однократной суточной дозы.

Седативное влияние исследовали с помощью энцефалограммы, проведения оценки когнитивной функции и теста на зрительно-моторную координацию, а также субъективную оценку. При применении рекомендуемой дозы значительное повышение седативного действия не наблюдалось. Эти результаты совпадают с данными, полученными в ходе двойных слепых клинических исследований: развитие седации в группе плацебо сопоставимо с группой, в которой применяли ебастин.

Влияние ебастина на сердце исследовалось во время клинических исследований. При детальном анализе при применении доз до 100 мг ебастина в сутки (в 10 раз выше рекомендованной суточной дозы) не наблюдалось значительных эффектов со стороны сердца.

Фармакокинетика.

После приема внутрь эбастин быстро всасывается и почти полностью метаболизируется в печени, превращаясь в активный метаболит каребастин.

После однократного перорального применения 10 мг препарата максимальная концентрация каребастина в плазме крови достигается через 2,6-4 ч и составляет 80-100 нг/мл. Период полувыведения активного метаболита составляет от 15 до 19 часов. 66% препарата выводится преимущественно в виде конъюгатов с мочой. При повторном приеме препарата в дозе 10 мг 1 раз в сутки концентрация в плазме крови достигается через 3-5 дней и составляет 130-160 нг/мл.

Исследования на микросомах печени человека *in vitro* показывают, что ебастин метаболизируется каребастином с помощью ферментов CYP3A4. Совместное применение ебастина и кетаконазола или эритромицина (ингибиторов CYP3A4) здоровым добровольцам ассоциировалось со значительным повышением уровня ебастина и каребастина в плазме крови, особенно при совместном применении с кетоконазолом (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»). Связь с белками плазмы крови ебастина и каребастина – более 97%.

У пациентов пожилого возраста фармакокинетические показатели существенно не изменяются по сравнению с соответствующими показателями более молодых добровольцев.

Концентрации ебастина и каребастина в плазме крови сохранялись с 1 по 5 сутки лечения у пациентов с легкой, средней или тяжелой степенью почечной недостаточности (20 мг/сут) и у пациентов с легкой, средней (20 мг/сут) и тяжелой (10 мг/сут). сутки) степенью печеночной недостаточности, как и у здоровых добровольцев. Это означает, что фармакокинетические показатели ебастина и его метаболита существенно не изменяются у пациентов с разными степенями почечной и печеночной недостаточности.

Показания

Симптоматическое лечение сезонного и круглогодичного аллергического ринита или риноконъюнктивита.

Крапивница.

Противопоказание

Повышенная чувствительность к компонентам препарата.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействия

Исследования взаимодействия эбастина с кетоконазолом или эритромицином указывают на удлинение интервала QT на ЭКГ. Фармакокинетическое и фармакодинамическое взаимодействие наблюдалось при применении обеих комбинаций и приводило к повышению концентрации эбастина и в меньшей степени – к каребастину в плазме крови, без каких-либо клинически значимых фармакодинамических последствий. QT при совместном применении увеличивался на 10 мс по сравнению с применением кетоконазола или эритромицина отдельно. Следует с осторожностью применять препарат

Элерт пациентам, принимающим такие азольные противогрибковые средства как кетоконазол и итраконазол, и макролидные антибиотики как эритромицин. Фармакокинетическое взаимодействие наблюдалось при совместном применении эбастина и рифампицина. Данное взаимодействие приводит к низким концентрациям препарата в плазме крови и сниженной антигистаминной активности. Эбастин не взаимодействует с теофиллином, варфарином, циметидином, диазепамом и этанолом. При приеме эбастина с пищей уровни основного метаболита эбастина в плазме крови и AUC (площадь под кривой

концентрация-время) возрастают от 1,5 до 2 раз. Это повышение не изменяет T_{max} (время достижения максимальной концентрации). Прием ебастина совместно с едой не влияет на его клинические эффекты.

Эбастин может оказывать влияние 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 по применению

С особой оговоркой необходимо применять препарат пациентам с риском развития сердечных осложнений, а именно – пациентам с пролонгированным QT синдромом, гипокалиемией, при совместном лечении с другими лекарственными средствами, удлиняющими интервал QT или ингибирующими CYP3A4 энзим (например, азольные противогрибковые средства). итраконазол) и макролидные антибиотики (например, эритромицин) (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий»).

Возможно возникновение фармакокинетических взаимодействий при применении ебастина с рифампицином (см. Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий).

Следует с осторожностью применять эбастин пациентам с тяжелой степенью печеночной недостаточности (см. «Способ применения и дозы»).

Поскольку терапевтический эффект препарата наступает через 1-3 ч после приема, Элерт не следует применять при острых аллергических реакциях.

В состав препарата Элерт входит аспартам (Е 951), являющийся производным фенилаланина, представляющего опасность для больных фенилкетонурией. В состав препарата Элерт входит маннит (Е 421), который может оказывать мягкое слабительное действие.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Беременность.

Данные по применению ебастина беременным женщинам ограничены. Исследования на животных не выявили прямого или косвенного вредного воздействия с точки зрения репродуктивной токсичности. В качестве меры пресечения не рекомендуется принимать препарат в период беременности.

Период кормления грудью.

Неизвестно, проникает ли ебастин в грудное молоко человека. Высокое связывание эбастина и его основного метаболита каребастина с белками крови (>97%) указывает на отсутствие проникновения препарата в грудное молоко. В качестве меры пресечения не рекомендуется принимать препарат в период кормления грудью.

фертильность.

Данные о влиянии эбастина на фертильность человека отсутствуют.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Согласно исследованиям, препарат не влияет на психомоторную функцию человека. Элерт в рекомендованных терапевтических дозах не влияет на скорость реакций при управлении автотранспортом или работе со сложными механизмами. Однако лицам, чувствительным к ебастину, следует учитывать возникновение индивидуальных реакций, а именно – сонливость или головокружение до начала управления автотранспортом или работы со сложными механизмами (см. раздел «Побочные реакции»).

Способ применения и дозирование

Дозировка

Аллергический ринит/риноконъюнктивит

Для детей от 12 лет и взрослых действуют следующие рекомендации по дозировке:

10 мг ебастина 1 раз в сутки. В случае тяжелых симптомов дозировка может быть повышена до 20 мг 1 раз в сутки.

Крапивница

Взрослым пациентам от 12 лет применять 10 мг ебастина 1 раз в сутки.

Особые группы пациентов

У пациентов с нарушениями функции почек легкой, умеренной или тяжелой степени или нарушениями функции печени легкой или умеренной степени нет необходимости в коррекции дозировки. Опыт применения доз выше 10 мг у пациентов с тяжелыми нарушениями функций печени отсутствует, поэтому доза не должна превышать 10 мг.

Лечение можно продлить до исчезновения симптомов.

Способ применения

Элерт предназначен для перорального применения. Препарат принимать независимо от еды.

Таблетку следует поместить на язык, где она будет диспергироваться: употребление воды или любой другой жидкости не требуется.

Дети. Безопасность и эффективность применения ебастина детям младше 12 лет не установлена.

Передозировка

В ходе исследований с применением высоких доз препарата (до 100 мг 1 раз в сутки) не наблюдалось значительных клинических признаков или симптомов передозировки. Специального антидота нет. В случае передозировки рекомендуется промывание желудка, медицинское наблюдение за жизненно важными функциями (ЭКГ), симптоматическое лечение.

Побочные эффекты

По данным плацебо-контролируемых клинических исследований применения ебастина, чаще всего сообщали о развитии таких побочных реакций как сухость во рту и сонливость. Побочные реакции, которые наблюдались при клинических исследованиях у детей, были такими же, как и у взрослых пациентов.

Нежелательные эффекты по частоте возникновения классифицируют по следующим категориям: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$ и $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$ и $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$ и $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (невозможно оценить по имеющимся данным).

Со стороны иммунной системы.

Редко: реакции гиперчувствительности, включая анафилаксию и ангионевротический отек.

Со стороны обмена веществ и питания.

Частота неизвестна: повышен аппетит.

Со стороны психики.

Редко: нервозность, бессонница.

Со стороны нервной системы.

Очень часто: головная боль.

Часто: сонливость.

Редко: головокружение, гипестезия, дисгевзия.

Очень редко: агевзия.

Со стороны сердца.

Редко: сердцебиение, тахикардия.

Со стороны желудочно-кишечного тракта.

Часто: сухость во рту.

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

Со стороны печени и желчевыводящих путей.

Редко гепатит, холестаз, изменения показателей функции печени (повышение уровня трансаминаз, гамма-глутамилтрансферазы (ГГТ), щелочной фосфатазы (ЛФ) и билирубина).

Со стороны кожи и подкожных тканей.

Редко: крапивница, сыпь, дерматит.

Со стороны репродуктивной системы и молочных желез.

Редко: нарушение менструального цикла.

Со стороны почек и мочевыводящих путей.

Очень редко: хлорурия, хроматурия.

Общие нарушения.

Редко отек, астения.Лабораторные и инструментальные данные

Частота неизвестна: увеличение массы тела.

Отчет о подозреваемых побочных реакциях

Важную роль играет отчет о побочных реакциях после регистрации препарата.

Это позволяет продолжить мониторинг соотношения польза/риск лекарственного средства. Специалистов в сфере медицинского обслуживания призывают предоставлять отчет о подозреваемых побочных реакциях с помощью государственной системы отчетности.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере; по 1 или по 2, или по 3 блистера в картонной коробке.

Категория отпуска

Без рецепта.

Производитель

МИКРО ЛАБС ЛИМИТЕД/MICRO LABS LIMITED.

Адрес

Участок №. S.155 - S.159 и N1, Промышленная зона Верна, Фаза III и Фаза IV, Верна Салкетт, In-403 722, Индия/PLOT NO. S.155 TO S.159 & N1, VERNA INDUSTRIAL ESTATE, PHASE III & PHASE IV, VERNA SALCETTE, IN-403 722, Индия.