

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

**Елерт
(Elert)**

Склад:

діюча речовина: ebastine;

1 таблетка, що диспергується в ротовій порожнині, містить ебастину 10 мг;

допоміжні речовини: маніт (Pearlitol 200SD) (E 421), кросповідон (Polyplasdone Ultra-10), кремнію діоксид (Syloid 244FP), аспартам (Nutrasweet) (E 951), м'ята перцева, магнію стеарат,

Лікарська форма. Таблетки, що диспергуються в ротовій порожнині.

Основні фізико-хімічні властивості: круглі плоскі таблетки без оболонки від білого до майже білого кольору зі скошеними краями, плоскі з обох боків.

Фармакотерапевтична група. Антигістамінні засоби для системного застосування. Ебастин. Код АТХ R06A X22.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Механізм дії

Ебастин спричиняє швидке і тривале інгібування ефектів, спричинених гістаміном, і тим самим проявляє високу афінність до зв'язування з H_1 -рецепторами.

Після перорального застосування ні ебастин, ні його метаболіти не проникають через гематоенцефалічний бар'єр. Дана властивість вказує на низьку седативну дію, що спостерігалася під час досліджень впливу ебастину на центральну нервову систему (ЦНС).

Дані *in vitro* та *in vivo* вказують на те, що ебастин є потужним високоселективним блокатором H_1 -гістамінових рецепторів тривалої дії, що не спричиняє побічної дії на ЦНС та не має антихолінергічної активності.

Фармакодинамічний вплив

Дослідження індукованих гістаміном папул вказують на клінічну та статистичну антигістамінну активність ебастину, що розпочинається через 1 годину і триває протягом

більше 48 годин. Після п'ятиденного курсу лікування препаратом Елерт антигістамінна активність зберігається протягом більше 72 годин після припинення застосування. Дана активність подібна до рівнів головного активного метаболіту каребастину у плазмі крові.

Після повторного прийому інгібування периферичних рецепторів залишається на сталому рівні без розвитку тахіфілаксії. Ці дані вказують на те, що ебастин у дозуванні щонайменше 10 мг спричиняє швидке, інтенсивне та довготривале інгібування периферичних

H₁-гістамінових рецепторів, що зберігається при прийомі одноразової добової дози.

Седативний вплив досліджували за допомогою енцефалограми, проведення оцінки когнітивної функції та тесту на зорово-моторну координацію, а також суб'єктивного оцінювання. При застосуванні рекомендованої дози значного підвищення седативної дії не спостерігалось. Ці результати збігаються з даними, отриманими під час подвійних сліпих клінічних досліджень: розвиток седації у групі плацебо співставний з групою, в якій застосовували ебастин.

Вплив ебастину на серце досліджували під час клінічних досліджень. Під час детального аналізу при застосуванні доз до 100 мг ебастину на добу (в 10 разів вище за рекомендовану добову дозу) не спостерігалось значних ефектів з боку серця.

Фармакокінетика.

Після прийому внутрішньо ебастин швидко всмоктується і майже повністю метаболізується у печінці, перетворюючись в активний метаболіт каребастин.

Після одноразового перорального застосування 10 мг препарату максимальна концентрація каребастину у плазмі крові досягається через 2,6-4 години і становить 80-100 нг/мл. Період напіввиведення активного метаболіту становить від 15 до 19 годин. 66 % препарату виводиться переважно у вигляді кон'югатів із сечею. При повторному прийомі препарату у дозі 10 мг 1 раз на добу концентрація у плазмі крові досягається через 3-5 днів і становить 130-160 нг/мл.

Дослідження на мікросомах печінки людини *in vitro* показують, що ебастин метаболізується до каребастину за допомогою ферментів CYP3A4. Сумісне застосування ебастину та кетаконазолу або еритроміцину (інгібіторів CYP3A4) здоровим добровольцям асоціювалося зі значним підвищенням рівня ебастину та каребастину у плазмі крові, особливо при сумісному застосуванні з кетоконазолом (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

Зв'язок з білками плазми крові ебастину і каребастину – більше 97 %.

У пацієнтів літнього віку фармакокінетичні показники суттєво не змінюються порівняно з відповідними показниками у більш молодих добровольців.

Концентрації ебастину та каребастину у плазмі крові зберігалися з 1 по 5 добу лікування у пацієнтів з легким, середнім або тяжким ступенем ниркової недостатності (20 мг на добу) та у пацієнтів із легким, середнім (20 мг на добу) та тяжким (10 мг на добу) ступенем печінкової недостатності, як і у здорових добровольців. Це означає, що фармакокінетичні показники ебастину та його метаболіту суттєво не змінюються у пацієнтів з різними ступенями ниркової та печінкової недостатності.

Клінічні характеристики.

Показання.

Симптоматичне лікування сезонного та цілорічного алергічного риніту або ринокон'юнктивіту.

Кропив'янка.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до компонентів препарату.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Дослідження взаємодії ебастину з кетоконазолом або еритроміцином вказують на подовження інтервалу QT на ЕКГ. Фармакокінетична та фармакодинамічна взаємодія спостерігалася при застосуванні обох комбінацій та призводила до підвищення концентрації ебастину і меншою мірою – до каребастину у плазмі крові, без будь-яких клінічно значущих фармакодинамічних наслідків. QT при сумісному застосуванні збільшувався лише на 10 мс порівняно із застосуванням кетоконазолу або еритроміцину окремо. Слід з обережністю застосовувати препарат Елерт пацієнтам, які приймають такі азольні протигрибкові засоби як кетоконазол та ітраконазол, та такі макролідні антибіотики як еритроміцин. Фармакокінетична взаємодія спостерігалась при сумісному застосуванні ебастину та рифампіцину. Дана взаємодія спричиняє низькі концентрації препарату у плазмі крові та знижену антигістамінну активність. Ебастин не взаємодіє з теофіліном, варфарином, циметидином, діазепамом та етанолом. Під час прийому ебастину з їжею рівні основного метаболіту ебастину у плазмі крові та AUC (площа під кривою «концентрація-час») зростають від 1,5 до 2 разів. Це підвищення не змінює T_{max} (час досягнення максимальної концентрації). Прийом ебастину сумісно з їжею не впливає на його клінічні ефекти. Ебастин може впливати на результати шкірних алергічних тестів, тому рекомендується припинити застосування препарату за 5-7 днів до їх проведення. Препарат може посилювати дію інших антигістамінних препаратів.

Особливості застосування.

З особливим застереженням необхідно застосовувати препарат пацієнтам із наявним ризиком розвитку серцевих ускладнень, а саме – пацієнтам із пролонгованим QT синдромом, гіпокаліємією, при сумісному лікуванні з іншими лікарськими засобами, що подовжують інтервал QT або інгібують CYP3A4 ензим (наприклад, азольні протигрибкові засоби (кетаконазол, ітраконазол) та макролідні антибіотики (наприклад, еритроміцин)) (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

Можливе виникнення фармакокінетичних взаємодій при застосуванні ебастину з рифампіцином (див. розділ «Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій»).

Слід з обережністю застосовувати ебастин пацієнтам із тяжким ступенем печінкової недостатності (див. розділ «Спосіб застосування та дози»).

Оскільки терапевтичний ефект препарату настає через 1-3 години після прийому, Елерт не слід застосовувати при гострих алергічних реакціях.

До складу препарату Елерт входить аспартам (Е 951), який є похідним фенілаланіну, що являє небезпеку для хворих на фенілкетонурію.

До складу препарату Елерт входить маніт (Е 421), який може чинити м'яку проносну дію.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність.

Дані щодо застосування ебастину вагітним жінкам обмежені. Дослідження на тваринах не виявили прямого або непрямого шкідливого впливу з точки зору репродуктивної токсичності. В якості запобіжного заходу не рекомендується приймати препарат у період вагітності.

Період годування груддю.

Невідомо, чи проникає ебастин у грудне молоко людини. Високе зв'язування ебастину та його основного метаболіту каребастину з білками крові (> 97 %) вказує на відсутність проникнення препарату в грудне молоко. В якості запобіжного заходу не рекомендується приймати препарат у період годування груддю.

Фертильність.

Дані щодо впливу ебастину на фертильність людини відсутні.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Згідно з дослідженнями препарат не впливає на психомоторну функцію людини. Елерт у рекомендованих терапевтичних дозах не впливає на швидкість реакцій під час керування автотранспортом або роботі зі складними механізмами. Проте особам, чутливим до ебастину, слід враховувати виникнення індивідуальних реакцій, а саме – сонливості або запаморочення до початку керування автотранспортом або роботи зі складними механізмами (див. розділ «Побічні реакції»).

Спосіб застосування та дози.

Дозування

Алергічний риніт/ринокон'юнктивіт

Для дітей віком від 12 років та дорослих діють наступні рекомендації щодо дозування:

10 мг ебастину 1 раз на добу. У випадку тяжких симптомів дозування може бути підвищене до 20 мг 1 раз на добу.

Кропив'янка

Дорослим пацієнтам віком від 12 років застосовувати 10 мг ебастину 1 раз на добу.

Особливі групи пацієнтів

У пацієнтів із порушеннями функції нирок легкого, помірного або тяжкого ступеня або порушеннями функції печінки легкого або помірного ступеня немає необхідності у корекції дозування. Досвід застосування доз вищих, ніж 10 мг, у пацієнтів із тяжкими порушеннями функцій печінки відсутній, тому доза не повинна перевищувати 10 мг.

Лікування можна продовжити до зникнення симптомів.

Спосіб застосування

Елерт призначений для перорального застосування. Препарат приймати незалежно від прийому їжі.

Таблетку слід помістити на язик, де вона буде диспергуватися: вживання води або будь-якої іншої рідини не потрібно.

Діти. Безпека та ефективність застосування ебастину дітям до 12 років не встановлена.

Передозування.

У ході досліджень із застосуванням високих доз препарату (до 100 мг 1 раз на добу) не спостерігалось значних клінічних ознак або симптомів передозування.

Спеціального антидоту немає. У випадку передозування рекомендується промивання шлунка, медичний нагляд за життєво важливими функціями (ЕКГ), симптоматичне лікування.

Побічні реакції.

За даними плацебо-контрольованих клінічних досліджень застосування ебастину, найчастіше повідомляли про розвиток таких побічних реакцій як сухість у роті та сонливість. Побічні реакції, які спостерігались у процесі клінічних досліджень у дітей, були такими ж, як і у дорослих пацієнтів. Небажані ефекти за частотою виникнення класифікують за такими категоріями: дуже часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$ і $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$ і $< 1/100$), рідко ($\geq 1/10000$ і $< 1/1000$), дуже рідко ($< 1/10000$), частота невідома (неможливо оцінити за наявними даними).

З боку імунної системи.

Рідко: реакції гіперчутливості, включаючи анафілаксію та ангіоневротичний набряк.

З боку обміну речовин і харчування.

Частота невідома: підвищений апетит.

З боку психіки.

Рідко: знервованість, безсоння.

З боку нервової системи.

Дуже часто: головний біль.

Часто: сонливість.

Рідко: запаморочення, гіпестезія, дисгевзія.

Дуже рідко: агеvзія.

З боку серця.

Рідко: відчуття серцебиття, тахікардія.

З боку шлунково-кишкового тракту.

Часто: сухість у роті.

Рідко: блювання, абдомінальний біль, нудота, диспепсія.

З боку печінки та жовчовивідних шляхів.

Рідко: гепатит, холестаз, зміни показників функції печінки (підвищення рівня трансаміназ, гамма-глутамілтрансферази (ГГТ), лужної фосфатази (ЛФ) та білірубіну).

З боку шкіри та підшкірних тканин.

Рідко: кропив'янка, висипання, дерматит.

З боку репродуктивної системи та молочних залоз.

Рідко: порушення менструального циклу.

З боку нирок та сечовивідних шляхів.

Дуже рідко: хлорурія, хроматурія.

Загальні розлади.

Рідко: набряк, астенія.

Лабораторні та інструментальні дані.

Частота невідома: збільшення маси тіла.

Звіт про підозрювані побічні реакції

Важливу роль відіграє звіт про побічні реакції після реєстрації препарату. Це дозволяє продовжити моніторинг співвідношення користь/ризик лікарського засобу. Фахівців у сфері медичного обслуговування закликають надавати звіт про підозрювані побічні реакції за допомогою державної системи звітування.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. Зберігати при температурі не вище 25 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 10 таблеток у блістері; по 1 або по 2, або по 3 блістери в картонній коробці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Виробник.

МІКРО ЛАБС ЛІМІТЕД/MICRO LABS LIMITED.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Ділянка №. S.155 - S.159 та N1, Промислова зона Верна, Фаза III та Фаза IV, Верна Салкетт, In-403 722, Індія/PLOT NO. S.155 TO S.159 & N1, VERNA INDUSTRIAL ESTATE, PHASE III & PHASE IV, VERNA SALCETTE, IN-403 722, India.