

## **ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

### **1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Кестин, 20 мг, таблетки-лиофилизат

### **2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ**

Действующее вещество: эбастин

Каждая таблетка содержит 20 мг эбастина.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: аспартам (см. раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

### **3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА**

Таблетки-лиофилизат

Таблетки лиофилизированные белого или почти белого цвета, круглые.

### **4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**

#### **4.1. Показания к применению**

Препарат Кестин показан к применению у взрослых и детей в возрасте от 12 лет до 18 лет при симптоматическом лечении:

- аллергического ринита различной этиологии (сезонного и/или круглогодичного) сопровождающегося аллергическим конъюнктивитом или без него;
- хронической идиопатической крапивницы;
- аллергического дерматита.

#### **4.2. Режим дозирования и способ применения**

##### Режим дозирования

##### *Взрослые*

Рекомендуется начинать терапию с дозы 10 мг 1 раз в сутки, используя препарат Кестин, таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 10 мг.

При недостаточной эффективности или выраженной симптоматике рекомендуется использовать Кестин, таблетки-лиофилизат, 20 мг, по 1 таблетке 1 раз в сутки.

Курс лечения будет определяться исчезновением симптомов заболевания.

### Особые группы пациентов

#### *Пациенты пожилого возраста*

Коррекция дозы не требуется.

#### *Пациенты с нарушением функции почек*

Коррекция дозы не требуется.

#### *Пациенты с нарушением функции печени*

При легкой или средней степени печеночной недостаточности (класс А, В по классификации Чайлд-Пью) коррекция дозы не требуется.

При тяжелых нарушениях функции печени (класс С по классификации Чайлд-Пью) суточная доза не должна превышать 10 мг, поэтому рекомендуется использовать препарат Кестин таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 10 мг.

### Дети

Режим дозирования для детей от 12 лет до 18 лет не отличается от режима дозирования для взрослых.

Безопасность и эффективность препарата Кестин у детей в возрасте от 0 до 12 лет на данный момент не установлены. Данные отсутствуют.

### Способ применения

Для рассасывания в полости рта, независимо от приема пищи.

Извлечение препарата из блистера должно осуществляться *сухими руками* в соответствии с инструкцией ниже:

1. во избежание повреждения таблеток, не доставайте препарат из блистера посредством нажатия. Откройте ячейку блистера, осторожно подняв свободный край защитной пленки (рис. 1);
2. снимите защитную пленку (рис. 2);
3. осторожно выдавите таблетку из ячейки, не прикасаясь к ней (рис. 3);
4. аккуратно извлеките препарат (рис. 4) и положите его на язык, где он быстро растворится.

**Нет необходимости запивать водой или другой жидкостью,** прием пищи не влияет на действие препарата.



рис. 1



рис. 2



рис. 3



рис. 4

#### **4.3. Противопоказания**

- гиперчувствительность к эбастину или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.

#### **4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении**

Препарат Кестин следует применять с осторожностью у пациентов:

- с увеличенным интервалом QT на ЭКГ;
- с гипокалиемией;
- с почечной недостаточностью;
- с тяжелым нарушением функции печени (см. раздел 4.2);
- одновременно принимающих кетоконазол или интраконазол, эритромицин (из-за возможного увеличения риска удлинения интервала QT на ЭКГ), рифампицин (из-за возможного фармакокинетического взаимодействия) (см. раздел 4.5).

Эбастин может искажать результаты кожных аллергических проб. Поэтому рекомендуется проводить такие пробы не ранее, чем через 5–7 дней после отмены препарата.

#### **Вспомогательные вещества**

Препарат Кестин содержит 2 мг аспартама в каждой таблетке.

Аспартам является источником фенилаланина. Он может быть вреден, если у Вас фенилкетонурия (ФКУ) – редкое генетическое нарушение, при котором накапливается фенилаланин из-за неспособности организма правильно выводить его.

#### **4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия**

При одновременном применении препарата Кестин с кетоконазолом или итраконазолом и эритромицином возможно увеличение риска удлинения интервала QT на ЭКГ.

Фармакокинетические взаимодействия наблюдались при одновременном назначении эбастина с рифампицином. Эти взаимодействия могут привести к снижению концентрации эбастина в плазме крови и оказывать ингибирующее влияние на антигистаминный эффект эбастина.

Препарат Кестин не взаимодействует с теофиллином, варфарином, циметидином, диазепамом, этанолом и этанолсодержащими препаратами.

#### **Дети**

Исследования взаимодействия проводились только у взрослых.

#### **4.6. Фертильность, беременность и лактация**

##### Беременность

Данные по применению эбастина при беременности ограничены. Предпочтительно избегать применения эбастина во время беременности.

##### Лактация

Кормящим матерям не рекомендуется применять препарат Кестин, поскольку неизвестно, выделяется ли эбастин с грудным молоком. Высокая степень связывания эбастина и его основного метаболита, карэбастина, с белками ( $> 97\%$ ) не предполагают выделения препарата с грудным молоком.

В качестве меры предосторожности, предпочтительно не применять эбастин в период лактации. При необходимости применения препарата в период лактации необходимо решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

##### Фертильность

Не имеется данных о влиянии эбастина на фертильность человека.

#### **4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами**

Эбастин в рекомендованных терапевтических дозах не оказывает влияния на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами. Однако у чувствительных лиц с необычными реакциями на эбастин, целесообразно до начала вождения автотранспорта или выполнения сложных видов деятельности оценить индивидуальную реакцию. У таких лиц возможно появление сонливости или головокружения.

В случае возникновения побочных эффектов со стороны центральной нервной системы, таких как сонливость и головокружение, необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

#### **4.8. Нежелательные реакции**

##### Табличное резюме нежелательных реакций

Ниже перечислены нежелательные реакции, наблюдавшиеся в клинических исследованиях и в ходе пострегистрационного применения препарата.

Нежелательные реакции разделены на группы в соответствии с системно-органными классами MedDRA с указанием их частоты:

очень часто ( $\geq 1/10$ ); часто (от  $\geq 1/100$ , но  $< 1/10$ ); нечасто (от  $\geq 1/1000$ , но  $< 1/100$ ); редко (от  $\geq 1/10000$ , но  $< 1/1000$ ); или частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Системно- органный класс MedDRA	Очень часто	Часто	Редко	Частота неизвестна
Нарушения со стороны иммунной системы			реакции гиперчувствительн ости (такие, как анафилаксия и ангионевротическ ий отек)	
Нарушения метаболизма и питания				усиление аппетита
Психические нарушения			нервозность, бессонница	
Нарушения со стороны нервной системы	головная боль	сонливость	головокружение, гипестезия, дисгевзия	
Нарушения со стороны сердца			сердцебиение, тахикардия	
Желудочно- кишечные нарушения		сухость во рту	рвота, боль в животе, тошнота, диспепсия	
Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей			гепатит, холестаз, отклонение от нормы показателей функциональных проб печени (повышение активности печеночных трансаминаз, гамма- глутамилтранспеп	

			тидазы (ГГТ), щелочной фосфатазы, билирубина)	
Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей			крапивница, сыпь, дерматит	
Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез			расстройства менструального цикла	
Общие нарушения и реакции в месте введения			отеки, астения	
Лабораторные и инструментальные данные				увеличение веса

### Дети

Нежелательные реакции, наблюдавшиеся в клинических исследованиях с участием детей старше 12 лет (n = 460), не отличались от реакций, отмеченных у взрослых.

### Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза - риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств - членов Евразийского экономического союза.

### *Российская Федерация*

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения

109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

тел.: +7 800 550 99 03

email: [pharm@roszdravnadzor.gov.ru](mailto:pharm@roszdravnadzor.gov.ru)

<https://roszdravnadzor.gov.ru>

*Республика Казахстан*

РГП на ПХВ «Национальный центр экспертизы лекарственных средств и медицинских изделий» Комитета медицинского и фармацевтического контроля Министерства здравоохранения Республики Казахстан

010000, г. Астана, район Байконур, ул. А. Иманова, 13 (БЦ «Нурсаулет 2»)

тел.: +7 7172 235-135

email: [pdlc@dari.kz](mailto:pdlc@dari.kz)

<https://www.ndda.kz>

#### **4.9. Передозировка**

##### Симптомы

В исследованиях с использованием высоких доз эбастина (более 100 мг 1 раз в сутки) не наблюдалось клинически значимых признаков или симптомов.

##### Лечение

Специфического антидота для эбастина нет. В случае передозировки рекомендуется промывание желудка, контроль жизненно важных функций организма, включая ЭКГ; симптоматическое лечение.

### **5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА**

#### **5.1. Фармакодинамические свойства**

Фармакотерапевтическая группа: антигистаминные средства системного действия; другие антигистаминные средства системного действия.

Код АТХ: R06AX22

##### Механизм действия

Эбастин является блокатором H<sub>1</sub>-гистаминовых рецепторов длительного действия.

Эбастин обеспечивает быстрое и длительное подавление эффектов, вызванных гистамином, таким образом демонстрируя высокую связывающую способность с H<sub>1</sub>-рецепторами.

После приема внутрь ни эбастин, ни его метаболиты не проникают через гематоэнцефалический барьер. Эта характеристика соответствует низкому профилю седации, наблюдаемому в результатах экспериментов, в которых исследовали влияние эбастина на центральную нервную систему.

Данные *in vitro* и *in vivo* демонстрируют, что эбастин является мощным, высокоселективным антагонистом H<sub>1</sub>-гистаминовых рецепторов с продолжительным

действием и не оказывает побочных эффектов на центральную нервную систему (ЦНС) и антихолинергических эффектов.

#### Фармакодинамические эффекты

После приема препарата внутрь выраженное противоаллергическое действие начинается через 1 ч и длится более 48 ч. После 5-дневного курса лечения препаратом Кестин антигистаминная активность сохраняется в течение 72 ч за счет действия активных метаболитов. При длительном приеме сохраняется высокий уровень блокады периферических H<sub>1</sub>-гистаминовых рецепторов без развития тахифилаксии. Препарат не оказывает выраженного антихолинергического и седативного эффекта, не проникает через гематоэнцефалический барьер. Не отмечено влияния препарата Кестин на интервал QT на ЭКГ в дозе 100 мг - дозе, превышающей рекомендованную суточную дозу (20 мг) в 5 раз.

### **5.2. Фармакокинетические свойства**

#### Абсорбция

После приема внутрь эбастин быстро всасывается.

#### Распределение

После однократного приема внутрь 20 мг препарата максимальная концентрация карэбастина в плазме достигается через 1-3 ч и составляет 157 нг/мл.

При ежедневном приеме препарата от 10 мг до 40 мг равновесная концентрация достигается через 3-5 дней, не зависит от вводимой дозы и составляет 130-160 нг/мл.

Как эбастин, так и карэбастин демонстрируют высокую степень связывания с белками плазмы более 97 %.

#### Биотрансформация

Почти полностью метаболизируется в печени, превращаясь в активный метаболит карэбастин.

#### Элиминация

Период полувыведения метаболита составляет от 15 до 19 часов, 66 % препарата выводится с мочой, в основном в виде конъюгированных метаболитов.

#### Лица пожилого возраста

У пациентов пожилого возраста фармакокинетические показатели существенно не изменяются.

#### Почечная недостаточность

При почечной недостаточности период полувыведения возрастает до 23–26 часов.

#### Печеночная недостаточность

При печеночной недостаточности период полувыведения возрастает до 27 часов, однако концентрация препарата не превышает терапевтических значений.



### **5.3. Данные доклинической безопасности**

Данные доклинических исследований не выявили какого-либо значимого токсического действия, исходя из традиционных исследований фармакологической безопасности, токсичности повторных доз, генотоксичности, канцерогенного потенциала или репродуктивной токсичности.

## **6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА**

### **6.1. Перечень вспомогательных веществ**

желатин

маннитол

аспартам

ароматизатор мятный

### **6.2. Несовместимость**

Не применимо.

### **6.3. Срок годности**

3 года.

### **6.4. Особые меры предосторожности при хранении**

Данный лекарственный препарат не требует специальных условий хранения.

### **6.5. Характер и содержимое первичной упаковки**

По 10 таблеток в блистере из поливинилхлорида и алюминиевой фольги.

По 1 блистеру вместе с листком-вкладышем помещают в картонную пачку.

### **6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом**

Особые требования отсутствуют.

## **7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ**

Испания

Spain

Альмиралль, С.А.

Almirall, S.A.

Ронда Хенераль Митре, 151, 08022 Барселона, Испания

Rda. General Mitre, 151, 08022 Barcelona, Spain

## **7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения на территории Союза**

Претензии потребителей направлять по адресу:

*Российская Федерация*

ООО «Зентива Фарма»

127030, г. Москва, вн. тер. г. муниципальный округ Тверской,

ул. Новослободская, д. 31, стр. 4, помещение VI

тел.: +7 (499) 350-13-48

e-mail: [PV-Russia@zentiva.ru](mailto:PV-Russia@zentiva.ru)

*Республика Казахстан*

Представительство "Алвоген Фарма Трейдинг Юроп ЕООД" в Казахстане

Республика Казахстан, г.Алматы, индекс 050008

улица Ауэзова, дом 48, 3 этаж, 3/3

тел.: +7 (727) 345-04-05

e-mail: [PV-Kazakhstan@zentiva.com](mailto:PV-Kazakhstan@zentiva.com)

## **8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ**

## **9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)**

Дата первой регистрации:

## **10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА**

Общая характеристика лекарственного препарата Кестин доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://eec.eaeunion.org/>