





Không cần điều chỉnh liều ở bệnh nhân suy gan nhẹ hoặc nặng.  
Không nên vượt quá một liều 10 mg ebastin ở những bệnh nhân suy gan nặng, vì không có nghiên cứu lâm sàng đã được phát triển với liều cao hơn 10 mg ebastin.

#### **Cách dùng:**

Thuốc có thể uống cùng hoặc không cùng thức ăn. Có thể hoặc không cần uống cùng nước hoặc chất lỏng khác.

Viên nén phân tán trong miệng Ebasvitae được đặt trên lưỡi, thuốc được phân tán ngay lập tức.

Ngay trước khi sử dụng, phải bóc vỉ thuốc cẩn thận bằng tay khô và không được nghiền viên thuốc. Thuốc phải được uống ngay khi vỉ đã được mở.

#### **CHỐNG CHỈ ĐỊNH**

Người mẫn cảm với hoạt chất hoặc với bất kỳ tá dược nào khác.

Trẻ em dưới 12 tuổi.

Người có acid phenylpyruvic niệu.

#### **TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN**

Giống như tất cả các loại thuốc khác, thuốc này có thể gây ra tác dụng không mong muốn, mặc dù không xảy ra với mọi người.

Các tác dụng không mong muốn được báo cáo khi sử dụng ebastine trong các thử nghiệm lâm sàng (bao gồm các tác dụng kể trên) và sau khi lưu hành được báo cáo dưới đây. Tần suất được thể hiện bằng các quy ước: *Rất thường gặp* ( $ADR \geq 1/10$ ), *thường gặp* ( $1/100 \leq ADR < 1/10$ ), *ít gặp* ( $1/1000 \leq ADR < 1/100$ ), *hiếm gặp* ( $1/10000 \leq ADR < 1/1000$ ), *rất hiếm gặp* ( $ADR < 1/10000$ ).

*Rất thường gặp* ( $ADR \geq 1/10$ ):

- Rối loạn hệ thần kinh: Đau đầu

*Thường gặp* ( $1/100 \leq ADR < 1/10$ ):

- Rối loạn hệ thần kinh: Buồn ngủ
- Rối loạn tiêu hóa: Khô miệng

*Hiếm gặp* ( $1/10000 \leq ADR < 1/1000$ )

- Phản ứng quá mẫn (như sốc phản vệ và phù mạch);
- Rối loạn tâm thần: căng thẳng, mất ngủ;
- Rối loạn hệ thần kinh: chóng mặt, giảm cảm giác chạm hoặc nhạy cảm, giảm hoặc bất thường vị giác;
- Rối loạn tim mạch: đánh trống ngực, nhịp tim nhanh;
- Rối loạn tiêu hóa: đau bụng, nôn, buồn nôn, khó tiêu, các vấn đề về tiêu hóa;
- Rối loạn gan mật: vấn đề về gan, xét nghiệm chức năng gan bất thường (transaminase, gamma-GT, phosphatase tăng kiềm và bilirubin);



- Rối loạn da và mô dưới da: nổi mề đay, phát ban, viêm da;
- Rối loạn hệ thống sinh sản và chức năng vú: rối loạn kinh nguyệt;
- Rối loạn chung: phù nề, mệt mỏi.

Rất hiếm gặp ( $ADR < 1/10000$ )

- Các biểu hiện dị ứng nghiêm trọng.

*Hãy thông báo với bác sĩ về những tác dụng không mong muốn gặp phải, kể các những triệu chứng không được đề cập ở trên.*

### TƯƠNG TÁC THUỐC

Tương tác dược động học đã được quan sát thấy khi ebastin uống cùng với ketoconazole hoặc itraconazole và erythromycin. Các tương tác này dẫn đến sự gia tăng nồng độ ebastin trong huyết tương và làm carebastin đạt nồng độ thấp hơn, tuy nhiên, không liên quan đến bất kỳ kết quả dược lực học có ý nghĩa lâm sàng nào.

Tương tác dược động học đã được quan sát thấy khi dùng ebastin với rifampicin. Tương tác này có thể làm giảm nồng độ trong huyết tương và giảm tác dụng kháng histamin.

Không có tương tác nào được báo cáo giữa ebastin và theophyllin, warfarin, cimetidin, diazepam hoặc rượu.

Khi dùng ebastin với thức ăn, tăng nồng độ trong huyết tương là 1,5 đến 2,0 lần và AUC của chất chuyển hóa axit chính còn hoạt tính của ebastine. Sự gia tăng này không làm thay đổi Tmax. Việc dùng ebastine với thức ăn không gây ra thay đổi nào trong hiệu quả lâm sàng của nó.

Ebastin có thể ảnh hưởng đến kết quả xét nghiệm dị ứng da, vì vậy không nên thực hiện chúng sau 5-7 ngày khi ngừng điều trị.

Ebastin có thể tăng cường hiệu quả của các thuốc kháng histamin khác.

### CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG

Cũng như các thuốc kháng histamin khác, cần thận trọng khi sử dụng ebastin ở những bệnh nhân có nguy cơ mắc bệnh tim như hội chứng QT dài, hạ kali máu, điều trị bằng bất kỳ loại thuốc nào có tác dụng tăng thời gian QT hoặc ức chế các hệ enzyme CYP3A4 như thuốc kháng nấm azole và kháng sinh nhóm macrolid.

Thận trọng khi dùng cùng thuốc điều trị lao. Tương tác dược động học có thể xuất hiện khi ebastin được dùng đồng thời với rifampicin, có thể hạ nồng độ ebastine trong máu và giảm tác dụng kháng histamin.

Ebastin đạt hiệu quả điều trị khoảng giữa 1 và 3 giờ sau khi uống, không nên sử dụng trong các trường hợp dị ứng cấp tính mang tính cấp cứu.

Ebastin nên được sử dụng thận trọng ở những bệnh nhân suy gan nặng.

Thuốc Ebasvitae có chứa aspartame, nó là một nguồn phenylalanin, có thể gây hại cho những người bị phenylketone niệu.



Thuốc Ebasyitae chứa monohydrat lactose, vì vậy không nên dùng ở những bệnh nhân có các vấn đề di truyền hiếm gặp không dung nạp galactose, thiếu lactase Lapp hoặc kém hấp thu glucose-galactose.

## **ẢNH HƯỞNG CỦA THUỐC ĐỐI VỚI PHỤ NỮ CÓ THAI VÀ CHO CON BÚ:**

### **- Phụ nữ mang thai**

Có rất ít dữ liệu từ việc sử dụng ebastine ở phụ nữ mang thai. Các nghiên cứu trên động vật không chỉ ra các tác động có hại trực tiếp hoặc gián tiếp đối với độc tính sinh sản. Như một biện pháp phòng ngừa, tốt nhất là tránh sử dụng ebastine trong thai kỳ.

### **- Phụ nữ cho con bú**

Chưa biết liệu các hoạt chất có được bài tiết trong sữa mẹ. Do liên kết protein cao (> 97%) của ebastine và chất chuyển hóa chính, carebastin, có thể không bài tiết vào sữa mẹ. Như một biện pháp phòng ngừa, tốt nhất là tránh sử dụng ebastine trong thời kỳ cho con bú.

## **ẢNH HƯỞNG CỦA THUỐC ĐỐI VỚI KHẢ NĂNG LÁI XE, VẬN HÀNH MÁY MÓC**

Ở người, chức năng tâm thần đã được nghiên cứu rộng rãi và không thấy ảnh hưởng. Ebastine ở liều điều trị khuyến cáo không ảnh hưởng đến khả năng lái xe hoặc vận hành máy móc.

Tuy nhiên, ở những người nhạy cảm có phản ứng bất thường với ebastine, nên biết các phản ứng trước khi lái xe hoặc thực hiện các hoạt động đòi hỏi sự chú ý đặc biệt như buồn ngủ hoặc chóng mặt có thể xảy ra.

## **QUÁ LIỀU VÀ CÁCH XỬ TRÍ**

Trong các nghiên cứu được tiến hành ở liều cao, không có dấu hiệu hoặc triệu chứng có ý nghĩa lâm sàng nào được quan sát lên đến 100 mg mỗi ngày một lần. Không có thuốc giải độc đặc hiệu cho ebastine.

Rửa dạ dày, theo dõi các chức năng quan trọng bao gồm ECG và điều trị triệu chứng cần được thực hiện.

## **DƯỢC LỰC HỌC**

**Nhóm dược lý:** Thuốc kháng Histamin khác tác dụng toàn thân

**Mã ATC:** R06AX22

Các nghiên cứu về da mào ngứa do histamin đã cho thấy tác dụng kháng histamin có ý nghĩa thống kê và lâm sàng bắt đầu từ 1 giờ và kéo dài hơn 48 giờ. Sau khi ngừng dùng thuốc điều trị 5 ngày với ebastine, hoạt tính kháng histamin còn lại rõ trong hơn 72 giờ. Hoạt tính này tương đương với nồng độ trong huyết tương của chất chuyển hóa chính dạng axit, carebastin.

Sau khi sử dụng lặp lại, sự ức chế của các thụ thể ngoại biên vẫn ở mức không đổi, ngoài sự miễn dịch nhanh.



Những kết quả này cho thấy rằng ebastine ở liều ít nhất 10 mg tạo ra sự ức chế nhanh, mạnh và lâu dài của các thụ thể histamin H ngoại biên, phù hợp với cách dùng một lần mỗi ngày. Một liều hàng ngày 20 mg ebastine cho thấy một hoạt động cao hơn so với các thuốc kháng histamin khác trong 24 giờ.

Trong một thử nghiệm liều duy nhất, công thức đông khô uống được dung nạp tốt như được chứng minh bằng các xét nghiệm tiêu chuẩn an toàn trong phòng thí nghiệm, khám sức khỏe, các dấu hiệu quan trọng và ECG. Ebastine dạng uống đông khô đã được tìm thấy là tương đương sinh học để xây dựng viên nén bao phim của ebastine. Do đó, hiệu quả của dạng uống đông khô của ebastine dự kiến sẽ giống như hiệu quả của công thức viên nén bao phim.

An thần được nghiên cứu thông qua pharmaco-EEG (điện não đồ), thực hiện nhận thức, kiểm tra phối hợp thị giác – vận động và đánh giá chủ quan. Không có sự gia tăng đáng kể thuốc an thần ở liều khuyến cáo. Những kết quả này phù hợp với những kết quả từ các thử nghiệm lâm sàng mù đôi; tỷ lệ an thần có thể so sánh giữa giả dược và ebastine.

Tác dụng lên tim của ebastine đã được nghiên cứu kỹ, sau liều duy nhất từ 2,5 đến 50 mg và nhiều liều từ 10 đến 80 mg/ kg/ ngày trong 7 ngày, không có bằng chứng về ảnh hưởng trên khoảng thời gian hiệu chỉnh QT.

### **Cơ chế hoạt động**

Ebastine đã được chứng minh là tạo ra tác dụng sự ức chế nhanh chóng và lâu dài histamin và có ái lực mạnh đối với thụ thể Histamin H.

Sau khi uống, ebastine hoặc chất chuyển hóa của nó không vượt qua hàng rào máu não. Đặc điểm này phù hợp trong kết quả nghiên cứu ảnh hưởng của ebastine lên hệ thần kinh trung ương.

Dữ liệu in vitro và in vivo chứng minh rằng ebastine là một chất đối kháng thụ thể histamin H có hiệu lực cao, có độ bền cao và chọn lọc cao, không có các tác dụng rủi ro lên CNS và tác dụng kháng acetylcholin.

### **DƯỢC ĐỘNG HỌC**

Ebastine được hấp thụ nhanh chóng và trải qua quá trình chuyển hóa lần đầu sau khi uống.

Ebastine gần như hoàn toàn được chuyển hóa thành chất chuyển hóa dạng axit còn hoạt tính, carebastin.

Sau khi uống một liều duy nhất 10 mg ebastine, nồng độ đỉnh của chất chuyển hóa trong huyết tương đạt được ở 2,6 đến 4 giờ và đạt được mức 80 đến 100 ng/ ml. Thời gian bán thải của chất chuyển hóa axit là từ 15 đến 19 giờ với 66% thuốc được bài tiết trong nước tiểu chủ yếu là các chất chuyển hóa liên hợp. Sau khi sử dụng lặp lại 10 mg ebastine mỗi ngày, trạng thái ổn định đã đạt được trong 3 đến 5 ngày với nồng độ đỉnh trong huyết tương dao động từ 130 đến 160 ng/ ml.

Các thông số dược động học của ebastine, cũng như của chất chuyển hóa còn hoạt tính carebastin đã được tìm thấy là tuyến tính trong phạm vi liều điều trị khuyến cáo 10-20 mg.



Các nghiên cứu *in vitro* với các microsome (vi lập thể) gan ở người cho thấy ebastin được chuyển hóa thành carebastin chủ yếu thông qua con đường CYP3A4. Sử dụng đồng thời ebastine với ketoconazole hoặc erythromycin (cả chất ức chế CYP3A4) cho những người tình nguyện khỏe mạnh có liên quan với nồng độ huyết tương tăng đáng kể ebastine và carebastin.

Cả ebastine và carebastin đều có liên kết protein cao, > 97%.

Ở người già, không có sự thay đổi đáng kể về mặt thống kê trong dược động học so với những người tình nguyện trẻ trưởng thành.

Ở những bệnh nhân có nhiều mức độ suy thận được điều trị với liều hàng ngày là 20 mg ebastine, cũng như ở bệnh nhân suy gan nhẹ đến trung bình được điều trị với 20 mg ebastine, hoặc suy gan nặng được điều trị với 10 mg ebastine, nồng độ ebastine và carebastin trong huyết tương đạt được trong ngày đầu tiên và thứ năm của điều trị tương tự như những người đạt được trong tình nguyện viên khỏe mạnh. Do đó, thông tin dược động học của ebastine và các chất chuyển hóa của nó không thay đổi đáng kể ở những bệnh nhân có nhiều mức độ suy gan hoặc thận.

Trong một nghiên cứu chéo liều duy nhất của ebastine dạng uống đông khô so với viên nén bao phim, các công thức đã được tìm thấy là tương đương sinh học. Lượng nước uống vào sau khi uống ebastine dạng đông khô không ảnh hưởng đến phân bố ebastine.

#### **ĐIỀU KIỆN BẢO QUẢN**

Bảo quản nơi khô, tránh ánh sáng, nhiệt độ không quá 30°C

#### **HẠN DÙNG**

36 tháng kể từ ngày sản xuất

#### **ĐÓNG GÓI**

Hộp 1 vi \* 10 viên hoặc 2 vi \* 10 viên

#### **TIÊU CHUẨN CHẤT LƯỢNG**

Eur. Ph \* (\* *luôn cập nhật theo phiên bản mới nhất*)

#### **SẢN XUẤT BỞI**

**SEID, S.A.**

Carretera de Sabadell a Granollers Km 15  
08185 Lliçà de Vall – Barcelona, Tây Ban Nha