

Ebastel

Solución oral Ebastina 1mg/1ml

Composición por 5 ml:

Ebastina (DC) 5 mg
Excipientes: ácido láctico, oxiestearato de glicerol polietilenglicol, neohesperidina dihidrochalcona, anetol, metil-parahidroxibenzoato de sodio, propil-parahidroxibenzoato de sodio, glicerol, sorbitol, dimeticona, hidróxido de sodio y agua purificada.

Forma farmacéutica y contenido del envase

Solución para administración oral. Frascos de 120 ml con jeringa dosificadora de 5 ml.

Propiedades farmacológicas

Ebastina, el componente activo de Ebastel, induce un potente y prolongado bloqueo selectivo de los receptores periféricos H1 para histamina. Su duración de acción hace posible administrar Ebastel una vez al día. El fármaco carece de acciones anticolinérgicas. Asimismo, al no tener acceso a los receptores centrales H1 para histamina, no presenta efecto sedante. Tampoco potencia los efectos del alcohol.

Propiedades farmacocinéticas

Tras su administración oral, Ebastina se absorbe rápidamente, sufriendo un importante efecto de metabolismo de primer paso hepático que da lugar a su metabolito ácido activo, carebastina.

Después de una dosis oral única de 10 mg, los niveles plasmáticos máximos del metabolito se obtienen entre las 2,6 y las 4 horas y alcanzan valores de 80 a 100 ng/ml. La vida media del metabolito ácido se sitúa entre 15 y 19 horas, siendo un 66% del fármaco excretado en orina, principalmente en forma de metabolitos conjugados. Tras la administración reiterada de 10 mg una vez al día, el estado estacionario se alcanza en 3 a 5 días con unos niveles plasmáticos máximos entre 130 y 160 ng/ml. Ebastina es metabolizada a carebastina mediante el enzima CYP3A4.

La administración concomitante de Ebastina con fármacos inhibidores del CYP3A4 a voluntarios sanos se asocia a concentraciones plasmáticas significativamente elevadas de Ebastina y carebastina. Tanto Ebastina como carebastina muestran una elevada unión a proteínas, >95%. No se observan diferencias estadísticamente significativas en el perfil farmacocinético de ancianos en comparación con adultos jóvenes.

Las concentraciones plasmáticas de Ebastina y carebastina en pacientes con insuficiencia renal leve, moderada o severa (dosis diarias de 20 mg), y en pacientes con insuficiencia hepática leve, moderada (ambos con dosis de 20 mg/día) o severa (dosis de 10 mg/día) fueron similares a las alcanzadas en voluntarios sanos, indicando que el perfil farmacocinético de Ebastina y de su metabolito no sufre cambios significativos en pacientes con varios grados de insuficiencia hepática o renal.

Propiedades farmacodinámicas

Los estudios realizados han demostrado un efecto antihistamínico clínicamente y estadísticamente significativo, iniciándose al cabo de 1 hora y prolongándose durante más de 48 horas. Después de la interrupción de la administración en un tratamiento durante 5 días con Ebastina, el efecto antihistamínico se mantuvo aparente durante más de 72 horas. Esta actividad fue paralela a los niveles plasmáticos del principal metabolito ácido activo, carebastina.

Tras administración reiterada, la inhibición de los receptores periféricos se mantuvo a un nivel constante, sin que se produjera taquifilaxia. Estos resultados sugieren que Ebastina a una dosis de al menos 10 mg produce una inhibición rápida, intensa y duradera de los receptores periféricos de la histamina H1, consecutivamente con una única administración diaria. A la dosis recomendada no se observó ningún aumento significativo de la sedación. Estos resultados concuerdan con los obtenidos en los ensayos clínicos a doble-ciego: la incidencia de la sedación es comparable entre placebo y Ebastina.

Los efectos cardíacos de Ebastina han sido investigados en estudios clínicos. No se han observado efectos cardíacos significativos en análisis detallados, a dosis de hasta 100 mg diarios (diez veces la dosis diaria recomendada).

Indicaciones terapéuticas

Tratamiento sintomático de procesos alérgicos, tales como: rinitis o conjuntivitis alérgicas, tanto estacionales como perennes (descargas nasales, picor de nariz, picor de ojos, lagrimeo, ganas de estornudar...), urticaria crónica, dermatitis alérgica.

Contraindicaciones

- Hipersensibilidad conocida al principio activo o alguno de los excipientes.
- Niños menores de dos años.

Precauciones de empleo

Administrar Ebastina con precaución en pacientes con riesgo cardíaco conocido tales como prolongación del intervalo QT, hipokaliemia, tratamiento concomitante con fármacos que incrementen el intervalo QT o que inhiban el enzima CYP3A4, tales como antifúngicos azólicos

Ebastel

Oral solution Ebastine 1mg/1ml

Composition per 5 ml:

Ebastine (INN) 5 mg
Excipients: lactic acid, polyoxyl 40 hydrogenated castor oil, neohesperidine dihydrochalcone, anethole, sodium methyl-parahydroxybenzoate, sodium propyl-parahydroxybenzoate, glycerol, sorbitol, polydimethylsiloxane, sodium hydroxide and purified water.

Pharmaceutical form and contents of container

Solution for oral administration. Bottle containing 120 ml, and a 5 ml dosing syringe.

Pharmacological properties

Ebastine, the active ingredient of Ebastel, produces a strong and prolonged selective blocking of the peripheral H1 receptors for histamine. The duration of its action allows to administer Ebastel once daily. The drug lacks any anticholinergic activity. Since it has not access to central H1 receptors for histamine, it does not show sedative effects. It does not strengthen alcohol effects either.

Pharmacokinetic properties

Ebastine is rapidly absorbed after oral administration. It undergoes considerable first pass hepatic metabolism, leading to the appearance of its active acid metabolite, carebastine. Maximum Ebastine metabolite plasma levels after a single oral dose of 10 mg are obtained between 2.6 and 4 hours after administration and reach values between 80-100 ng/ml. The half-life of the acid metabolite is between 15 and 19 hours, with 66% of the compound excreted in urine, mainly as conjugated metabolites. After repeated administration of 10 mg once daily, steady state is reached in 3 to 5 days with maximum plasma levels between 130 and 160 ng/ml.

The enzyme CYP3A4 mediates the metabolism of Ebastine to carebastine. Concomitant administration of Ebastine and CYP3A4 inhibitors to healthy volunteers has been associated with significantly elevated Ebastine and carebastine plasma concentrations. Both Ebastine and carebastine show a high affinity for protein binding, >95%.

No statistically significant differences were observed in the pharmacokinetic profile in elderly when compared to young adults. Ebastine and carebastine plasma concentrations in patients suffering of mild, moderate or serious renal impairment (20 mg daily) and in patients suffering of slight, moderate (both at 20 mg daily) or serious (10 mg daily) hepatic impairment, were similar to those reached in healthy volunteers. The pharmacokinetic profile of Ebastine and its metabolite does not undergo significant changes in patients with various degrees of renal or hepatic impairment.

Pharmacodynamic properties

Studies carried out have demonstrated a clinically and statistically significant antihistamine effects, initiating 1 hour and lasting more than 48 hours. After suspending administration of treatment with Ebastine for 5 days, the antihistamine effect was apparent for more than 72 hours. This activity was parallel with plasma levels of the main active acid metabolite, carebastine. Inhibition of the peripheral receptors remained constant after repeated administration, with the absence of tachyphylaxis. These results suggest that a dose of at least 10 mg of Ebastine causes rapid, intense and lasting inhibition of the peripheral H1 histamine receptors following a single daily administration.

No significant increase in sedation was observed at the recommended dose. These results are in accordance with those obtained in double-blind clinical trials: the incidence of sedation is comparable between placebo and Ebastine.

The cardiac effects of Ebastine were studied in clinical trials. No significant cardiac effects were observed in detailed analyses of doses of up to 100 mg per day (ten times the recommended daily dose).

Therapeutic indications

Symptomatic treatment of allergic conditions, such as: allergic rhinitis or conjunctivitis, both seasonal and perennial (nasal discharge, nose itching, eye itching, weeping, sneezing, etc...), chronic urticaria, allergic dermatitis.

Contraindications

- Hypersensitivity to the active ingredient or any of the excipients.
- Children under 2 years of age.

Precautions for use

Administer with caution in patients with known cardiac risk, such as patients with prolonged QT interval, hypokaliemia, concomitant treatment with drugs which increase the QT interval or which inhibit the CYP3A4 enzyme, such as azolic antifungal agents and macrolid antibiotics. Since Ebastine achieves its therapeutic effect between 1 and 3 hours after administration, it is not to be used in acute allergy emergency cases.

Ebastel

Solution buvable Ébastine 1 mg/1ml

Composition par 5 ml:

Ebastine (DC) 5 mg
Excipients: acide lactique, oxiestearate de glycérine polyéthylène glycol, néohesperidine dihydrochalcone, anéthol, méthylparabén sodique, propyl-parabén sodique, glycérine, sorbitol, diméticone, hydroxyde de sodium et eau purifiée.

Forme pharmaceutique et contenu

Solution buvable. Flacons de 120 ml et seringue doseuse de 5 ml.

Propriétés pharmacologiques

L'ébastine, composant actif d'Ebastel, induit un blocage sélectif puissant et durable au niveau des récepteurs périphériques H1 de l'histamine. Sa durée d'action permet d'administrer Ebastel une fois par jour. Le médicament ne possède pas d'effets anticholinergiques. De même, en n'ayant pas accès aux récepteurs centraux H1 de l'histamine, il ne présente pas d'effet sédatif. Il n'y a pas non plus de potentialisation des effets de l'alcool.

Propriétés pharmacocinétiques

Après administration orale, l'ébastine est rapidement absorbée, et elle subit un effet important de métabolisme de premier passage hépatique qui la transforme en son métabolite acide actif, la carebastine.

Après une dose orale unique de 10 mg les concentrations plasmatiques maximales du métabolite sont atteintes entre 2.6 et 4 heures et elles ont des valeurs allant de 80 à 100 ng/ml. La demi-vie du métabolite acide se situe entre 15 et 19 heures, avec une excrétion urinaire de 66% du médicament, principalement sous forme de métabolites conjugués. Après l'administration répétée de 10 mg une fois par jour, l'état stationnaire est atteint en 3 à 5 jours avec des concentrations plasmatiques maximales comprises entre 130 et 160 ng/ml. L'ébastine est métabolisée en carebastine par l'enzyme CYP3A4. L'administration concomitante d'ébastine avec des médicaments inhibiteurs du CYP3A4 chez des volontaires sains est associée à des concentrations plasmatiques significativement élevées d'ébastine et de carebastine. L'ébastine et la carebastine présentent une forte liaison aux protéines plasmatiques, >95%.

On n'observe pas de différences statistiquement significatives dans le profil pharmacocinétique des sujets âgés comparativement aux adultes jeunes. Les concentrations plasmatiques de l'ébastine et de la carebastine chez des patients ayant une insuffisance rénale légère, modérée ou sévère (20 mg par jour), et chez des patients ayant une insuffisance hépatique légère, modérée (20 mg par jour) ou sévère (10 mg par jour) ont été similaires à celles qui ont été atteintes chez des volontaires sains, en indiquant que le profil pharmacocinétique de l'ébastine et de son métabolite ne subit pas de modifications significatives chez des patients présentant divers degrés d'insuffisance hépatique ou rénale.

Les concentrations plasmatiques de l'ébastine et de la carebastine en patients souffrant de légère, modérée (les deux à 20 mg/jour) ou sévère (10 mg/jour) insuffisance rénale, et chez des patients souffrant de légère, modérée (les deux à 20 mg/jour) ou sévère (10 mg/jour) insuffisance hépatique, ont été similaires à celles qui ont été atteintes chez des volontaires sains, indiquant que le profil pharmacocinétique de l'ébastine et de son métabolite ne subit pas de modifications significatives chez des patients présentant divers degrés d'insuffisance hépatique ou rénale.

Propriétés pharmacodynamiques

Les études réalisées ont montré un effet antihistaminique cliniquement et statistiquement significatif qui s'initie au bout d'1 heure et se prolonge pendant plus de 48 heures. Après l'arrêt de l'administration d'un traitement pendant 5 jours avec l'ébastine, l'effet antihistaminique reste apparent pendant plus de 72 heures. Cette activité a été parallèle aux concentrations plasmatiques du principal métabolite acide actif, la carebastine. Après l'administration répétée, l'inhibition des récepteurs périphériques s'est maintenue à un niveau constant, sans produire de tachyphylaxie. Ces résultats suggèrent que l'ébastine à une dose d'au moins 10 mg produit une inhibition rapide, intense et durable des récepteurs périphériques de l'histamine H1, consécutivement avec une seule administration quotidienne.

A la dose recommandée on n'observe aucune augmentation significative de la sédation. Ces résultats coïncident avec ceux qui sont obtenus dans des essais cliniques en double aveugle: l'incidence de la sédation est comparable entre le placebo et l'ébastine. Les effets cardiaques de l'ébastine ont été analysés dans des études cliniques. On n'a pas observé d'effets cardiaques significatifs dans des analyses détaillées, à des doses allant jusqu'à 100 mg par jour (dix fois la dose quotidienne recommandée).

Les effets cardiaques de l'ébastine ont été étudiés dans des études cliniques. On n'a pas observé d'effets cardiaques significatifs dans des analyses détaillées, à des doses allant jusqu'à 100 mg par jour (dix fois la dose quotidienne recommandée).

Indications thérapeutiques

Traitement symptomatique des processus allergiques, tels que: les rhinites ou les conjonctivites allergiques, aussi bien saisonnières que permanentes (écoulement nasal, picotement du nez, picotement des yeux, larmoiement, enlèvement d'éternuer...), l'urticaire chronique, la dermatite allergique.

Contre-indications

- Hypersensibilité connue au principe actif ou à l'un des excipients.
- Enfants de moins de deux ans.

Précautions d'emploi

Administrer l'ébastine avec précaution chez les patients ayant un risque cardiaque connu tel que l'allongement de l'intervalle QT, une hypokaliémie, un traitement concomitant avec des médicaments qui allongent l'intervalle

y antibióticos macrólidos.

Dado que Ebastina alcanza su efecto terapéutico entre 1 y 3 horas después de su administración, no debe ser utilizado en cuadros alérgicos agudos de urgencia.

Advertencias

Embarazo y lactancia

Dado que el riesgo de teratogenicidad no puede ser excluido con absoluta certeza, este medicamento no debe usarse en el embarazo, salvo en caso de ser claramente necesario. Tampoco debe ser administrado a madres lactantes.

Efectos sobre la capacidad de conducir y utilizar maquinaria

En el hombre no se han observado efectos sobre la función psicomotora, ni sobre la capacidad de conducir o utilizar maquinaria, a las dosis terapéuticas recomendadas.

Interacciones

- La administración de Ebastina en combinación con ketoconazol o eritromicina da lugar a interacciones farmacocinéticas y farmacodinámicas. Como resultado, incrementan los niveles plasmáticos de Ebastina. Se recomienda administrar Ebastina con precaución a aquellos pacientes que realicen tratamiento concomitante con ketoconazol, eritromicina y fármacos inhibidores del enzima CYP3A4.

- La administración de Ebastina con comida no modifica su efecto clínico.
- Ebastina puede interferir con los resultados de las pruebas alérgicas cutáneas, por lo que se aconseja no realizarlas hasta transcurridos 5-7 días desde la interrupción del tratamiento.
- Puede potenciar los efectos de otros antihistamínicos.

Incompatibilidades

No se han descrito hasta el momento.

Posología

Adultos y niños mayores de 12 años: 2 dosis de 5 ml (10 mg) una vez al día.

Niños entre 6 y 11 años: 1 dosis de 5 ml (5 mg) una vez al día.

Niños entre 2 y 5 años: La dosis habitual es de ½ dosis de 5 ml (2.5 mg) una vez al día.

Niños menores de 2 años: La seguridad de Ebastel no ha sido establecida en esas edades.

Anzianos: No es necesario ajustar la dosis.

Insuficiencia renal: No es necesario ajustar la dosis.

Insuficiencia hepática: No es necesario ajustar la dosis. En pacientes con insuficiencia hepática severa no debe excederse la dosis máxima recomendada (10 mg/día).

Instrucciones para la correcta administración del preparado

El preparado se puede administrar directamente o mezclado con agua. Introducir la jeringa dosificadora en el frasco de solución, con el émbolo totalmente presionado. Aspirar, hasta conseguir la dosificación indicada.



Sobredosis

En estudios realizados con dosis elevadas, no se observaron signos o síntomas clínicamente significativos a dosis de hasta 100 mg una vez al día. No existe ningún antídoto específico para Ebastina. Deberá considerarse la necesidad de realizar un lavado gástrico, monitorización de las constantes vitales, incluyendo ECG, y tratamiento sintomático.

Reacciones adversas

Las reacciones adversas fueron leves o moderadas, transitorias y se resolvieron espontáneamente sin tratamiento específico. Los efectos adversos descritos con mayor frecuencia fueron dolor de cabeza, sequedad de boca y somnolencia.

Si se observa cualquier otra reacción no descrita en este prospecto, consulte con su médico o farmacéutico.

Caducidad

Este medicamento no se debe utilizar después de la fecha de caducidad indicada en el envase.

Condiciones de conservación

Conservar a temperatura inferior a 25°C.

Otras presentaciones

Ebastel 10 mg Comprimidos recubiertos con película: Envases de 10, 20 y 30 comprimidos.

No todas las presentaciones ni formas farmacéuticas están disponibles en todos los mercados.

Venta bajo receta médica.

Mantener fuera del alcance de los niños.

Warnings

Pregnancy and lactation

Since the teratogenic risk cannot be completely excluded, this drug must not be used during pregnancy, unless it is absolutely necessary. It must not be administered to breast-feeding women either.

Effects on ability to drive and use machines

Recommended therapeutic doses have had no effects on the psychomotor function in man or on the ability to drive or operate machinery.

Interactions

- The concomitant administration of Ebastina along with ketoconazole, erythromycin or CYP3A4 enzyme inhibitors leads to pharmacokinetic and pharmacodynamic interaction. Subsequently, Ebastina plasma levels increase. Ebastel should therefore be administered with caution in those patients treated concomitantly with ketoconazol, erythromycin or CYP3A4 enzyme inhibitors.
- Administration of Ebastine with food does not modify its clinical effects.
- Ebastine can interfere with the results of dermal allergic tests and therefore it is recommended not to perform these tests until 5-7 days after treatment discontinuation.
- It could strengthen the effects of other antihistaminic agents.

Incompatibilities

Up to date, none have been described.

Posology

Adults and children over 12 years: 2 doses of 5 ml (10 mg) once daily.

Children 6 to 11 years: 1 dose of 5 ml (5 mg) once daily.

Children 2 to 5 years: ½ dose of 5 ml (2.5 mg) once daily.

Children under 2 years: The safety of Ebastel has not been established in these patients.

The elderly: There is no need to adjust the dose.

Renal impairment: There is no need to adjust the dose.

Hepatic impairment: There is no need to adjust the dose. In patients with serious hepatic impairment the dose of 10 mg/day must not be exceeded.

Instructions for use and handling

The preparation can be administered directly or mixed with water. Immerse the dosing syringe into the solution bottle, with the plunger completely pressed down. Draw in until the indicated dose is obtained.



Overdose

Studies carried out with high doses did not evidence clinically significant signs or symptoms at doses up to 100 mg once daily. There is no specific antidote for Ebastine. The following measures should be considered: gastric lavage, monitoring of vital constants including ECG, and symptomatic treatment.

Undesirable effects

The adverse reactions were slight or moderate and transitory and resolved spontaneously without specific treatment. The undesirable effects most frequently described were headache, mouth dryness and somnolence. If you notice any side effects not mentioned in this leaflet, please inform your doctor or pharmacist.

Shelf life

Do not use this drug after the expiry date given on the package.

Storage instructions

Store below 25°C.

Other pharmaceutical forms

Ebastel 10 mg Film-coated tablets: Blister packs of 10, 20 or 30 tablets. Neither all presentations nor all pharmaceutical forms are available in all markets.

THIS IS A MEDICAMENT

- Medicament is a product which affects your health and its consumption contrary to instructions is dangerous for you.
- Follow strictly the doctor's prescription, the method of use and the instructions of the pharmacist who sold the medicament.
- The doctor and the pharmacist are experts in medicine, its benefits and risks.
- Do not repeat the same prescription without consulting your doctor.
- Keep medication out of the reach of children.

Under medical prescription.

Keep out of the reach of children.

QT ou qui inhibent l'enzyme CYP3A4, tels que les antifongiques azolés et les antibiotiques macrolides. Étant donné que l'ebastine atteint son effet thérapeutique au bout d'1 à 3 heures après son administration, il est recommandé de ne pas l'utiliser dans des signes allergiques aigus d'urgence.

Mises en garde

Grossesse et allaitement

Dans la mesure où le risque de tératogénèse ne peut pas être exclu avec une certitude absolue, ce médicament ne doit pas être utilisé pendant la grossesse, sauf en cas de nécessité impérative. Il ne doit pas être administré non plus pendant l'allaitement.

Effets sur l'aptitude à conduire des véhicules et à utiliser des machines

Aux doses thérapeutiques recommandées, l'ebastine n'entraîne pas une altération des capacités de conduite ou d'utilisation de machines.

Interactions

- L'administration concomitante de l'ebastine avec ketoconazole ou l'érythromycine produit des interactions pharmacocinétiques et pharmacodynamiques. Comme résultat, ils augmentent les concentrations plasmatiques de l'ebastine. Il est recommandé d'administrer Ebastel avec précaution chez les patients sous traitement concomitant avec le ketoconazole, l'érythromycine et les médicaments inhibiteurs de l'enzyme CYP3A4.
- L'administration de l'ebastine avec une prise alimentaire ne modifie pas son effet clinique.
- L'ebastine peut interférer avec les résultats des tests allergiques cutanés, il est donc conseillé de ne pas les réaliser jusqu'à 5-7 jours après l'arrêt du traitement.
- Il peut potentialiser les effets d'autres antihistaminiques.

Incompatibilités

Elles n'ont pas été décrites à ce jour.

Posologie

Adultes et enfants de plus de 12 ans: 2 doses de 5 ml (soit 10 mg) une fois par jour.

Enfants entre 6 et 11 ans: 1 dose de 5 ml (soit 5 mg) une fois par jour.

Enfants entre 2 et 5 ans: ½ dose de 5 ml (soit 2,5 mg) une fois par jour.

Enfants de moins de 2 ans: La sécurité d'Ebastel n'a pas été établie pour cet âge.

Sujets âgés: Il n'est pas nécessaire d'adapter la posologie.

Insuffisance rénale: Il n'est pas nécessaire d'adapter la posologie.

Insuffisance hépatique: Il n'est pas nécessaire d'adapter la posologie. Uniquement dans les cas d'insuffisance hépatique sévère, il est conseillé de ne pas dépasser la dose maximale recommandée (10 mg/jour).

Instructions pour l'administration correcte de la préparation

La préparation peut être administrée directement ou mélangée avec de l'eau. Introduire la seringue doseuse dans le flacon contenant la solution, le piston poussé à fond. Aspirer jusqu'à obtenir la dose prescrite.



Surdosage

Dans des études réalisées avec des doses élevées, aucun signe ou symptôme cliniquement significatif n'ont été observés à une dose atteignant 100 mg une fois par jour. Il n'existe aucun antidote spécifique pour l'ebastine. Il faudra tenir compte de la nécessité de réaliser un lavage gastrique, une surveillance des constantes vitales, incluant un ECG, et un traitement symptomatique.

Effets indésirables

Les effets indésirables ont été légers ou modérés, transitoires et ils disparaissent spontanément sans traitement spécifique. Les effets indésirables décrits le plus fréquemment ont été des céphalées, sécheresse buccale et somnolence. Si vous observez une autre réaction non décrite dans cette notice, consultez votre médecin ou votre pharmacien.

Durée de conservation

Ce médicament ne doit pas être utilisé après la date de péremption indiquée sur la boîte.

Condiciones de conservación

A conservar a temperatura no desaxando pas 25°C.

Autres présentations

Ebastel Comprimés pelliculés: Boîtes de 10, 20 et 30 comprimés. Toutes les présentations et toutes les formes pharmaceutiques ne sont pas disponibles sur tous les marchés.

Vente sur ordonnance médicale.

Les médicaments doivent être conservés hors de la portée des enfants.



Laboratorios Almirall, S.A.
08022 Barcelona España/Spain/Espagne

Council of Arab Health Ministers - Union of Arab Pharmacists