Ebastel 10 mg
Comprimidos recubiertos con película
Ebastina

Composición por comprimido:
Ebastina (DCI) ..... 10 mg
Excipientes: celulosa microcristalina, almidón de maíz pregelatinizado, lactosa monohidrato, croscarmelosa de sodio, estearato magnésico, hipromelosa, macrogol y dióxido de titanio.

Forma farmacéutica y contenido del envase
Comprimidos recubiertos con película, circulares, de color blanco y con una cara marcada con E10. Envases de 10 (1x10), 20 (2x10) y 30 (3x10) comprimidos.
No todas las presentaciones están disponibles en todos los mercados.

Propiedades farmacológicas
Ebastina, el componente activo de Ebastel, induce un potente y prolongado bloqueo selectivo de los receptores H1 para histamina libre de efectos anticolinérgicos y sedantes ya que ni la ebastina ni sus metabolitos atraviesan la barrera hematoencefálica. Ebastel tampoco potencia los efectos sedativos del alcohol. Su duración de acción hace posible administrar Ebastel una vez al día.

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, >97%.

No se observan diferencias estadísticamente significativas en el perfil farmacocinético de pacientes de edad avanzada 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 taquifilaxis. 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, consecuente 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
Ebastel está indicado en el tratamiento de los síntomas de procesos alérgicos tales como rinitis alérgica estacional o perenne asociada o no a conjuntivitis alérgica (como goteo nasal, picor de nariz, picor de ojos, lagrimeo, ganas de estornudar), urticaria crónica y dermatitis alérgica.

Contraindicaciones
- Hipersensibilidad conocida al principio activo o alguno de los excipientes.
- Esta presentación no está indicada en niños menores de 12 años. En este grupo de pacientes se recomienda la solución oral.

Precauciones de empleo
Administrar Ebastina con precaución en pacientes con riesgo cardíaco conocido tales como prolongación del intervalo QT, en pacientes con niveles alterados de potasio en sangre, tratamiento concomitante con fármacos que incrementen el intervalo QT o que inhiban el enzima CYP3A4, tales como antifúngicos azólicos y antibióticos macrólidos. Ebastina debe emplearse con precaución en pacientes con insuficiencia hepática severa. 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
Fertilidad, embarazo y lactancia
Fertilidad
No se dispone de datos de fertilidad con ebastina en humanos.

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

Lactancia
Se desconoce si ebastina se excreta en la leche materna. El alto grado de unión a proteínas (> 97%) de la ebastina y su metabolito principal, carebastina, sugiere que no se produce excreción del medicamento en la leche materna. Como medida de precaución, este medicamento no debe utilizarse durante la lactancia.

Advertencias sobre excipientes
Este medicamento contiene lactosa. Los pacientes con intolerancia hereditaria a galactosa, insuficiencia de lactasa de Lapp (insuficiencia observada en ciertas poblaciones de Laponia) o malabsorción de glucosa o galactosa no deben tomar este medicamento.

Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas
La función psicomotora ha sido ampliamente estudiada en el ser humano, sin que se haya observado ningún efecto. A las dosis terapéuticas recomendadas ebastina no afecta a la capacidad para conducir o utilizar máquinas.

No obstante, en individuos sensibles que reaccionan de forma inusual a la ebastina, se recomienda conocer las reacciones individuales antes de que el paciente conduzca o realice actividades complejas: puede aparecer somnolencia o mareo.

Niños
Se recomienda el uso de la solución oral ya que la forma farmacéutica de comprimidos no es adecuada para la administración de dosis inferiores a 10 mg.

Interacciones
- La administración de Ebastina en combinación con fármacos inhibidores del enzima CYP3A4 (ketoconazol, itraconazol o eritromicina) da lugar a interacciones farmacocinéticas y farmacodinámicas. Como resultado, incrementan los niveles plasmáticos de Ebastina. Se recomienda administrar Ebastel con precaución a aquellos pacientes que realicen tratamiento concomitante con ketoconazol, itraconazol o eritromicina.
- Interacciones farmacocinéticas han sido observadas al administrar ebastina con rifampicina. Estas interacciones pueden dar lugar a una disminución de las concentraciones plasmáticas y a una reducción de los efectos antihistamínicos.
- No se han descrito interacciones entre ebastina y teofilina, warfarina, cimetidine, diazepam y alcohol.
- 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 y forma de administración
Adultos y niños mayores de 12 años
La dosis habitual es 1 comprimido (10 mg de ebastina) una vez al día.

Niños menores de 12 años
En este grupo de pacientes se recomienda el uso de la forma farmacéutica solución.

Pacientes de edad avanzada: No es necesario ajustar la dosis.
Insuficiencia renal: No es necesario ajustar la dosis en pacientes con insuficiencia renal leve, moderada o severa.

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

Forma de administración
Vía oral. Puede tomarse con o sin alimentos. Tomar los comprimidos con ayuda de un vaso de agua.

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
En los ensayos clínicos y en la experiencia postcomercialización se han observado los siguientes efectos adversos:

Muy frecuentes (pueden afectar a más de 1 de cada 10 personas):
- Dolor de cabeza

Frecuentes (pueden afectar hasta 1 de cada 10 personas):
- Somnolencia
- Sequedad de boca

Raros (pueden afectar hasta 1 de cada 1.000 personas):
- Reacciones de hipersensibilidad (como anafilaxis y angioedema)
- Nerviosismo, insomnio
- Mareo, disminución de la sensación del tacto o la sensibilidad, disminución o alteración del gusto
- Palpitaciones, taquicardia
- Dolor abdominal, vómitos, náuseas, problemas digestivos
- Inflamación del hígado (hepatitis), colestasis, pruebas analíticas de función hepática anómalas (aumento de transaminasas, gamma-GT, fosfatasa alcalina y bilirrubina)
- Urticaria, erupción cutánea, dermatitis
- Trastornos menstruales
- Edema, fatiga

Frecuencia no conocida (la frecuencia no puede estimarse a partir de los datos disponibles).
- Aumento de peso
- Aumento del apetito

Si se observa cualquier reacción adversa, incluso si no está 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
No conservar a temperatura superior a 30ºC

Venta bajo receta médica
Mantener fuera del alcance y de la vista de los niños

Responsable de la fabricación
Industrias Farmacéuticas Almirall, S.A.
Ctra. de Martorell, 41-61
08740 Sant Andreu de la Barca, Barcelona (España)

Titular de la autorización de comercialización
Almirall, S.A. 08022 Barcelona (España)

Fecha de la última revisión de este prospecto: 05/2019

Ebastel 10 mg
Film-coated tablets
Ebastine

Composition per tablet:
Ebastine (INN) ..... 10 mg
Excipients: microcrystalline cellulose, pregelatinised maize starch, lactose monohydrate, croscarmellose sodium, magnesium stearate, hypromellose, macrogol and titanium dioxide.

Pharmaceutical form and content of package
Round, white film-coated tablets with one side marked E10. Packages of 10 (1x10), 20 (2x10) and 30 (3x10) tablets.
Not all the presentations are available in all markets.

Pharmacological properties
Ebastine, the active ingredient of Ebastel, induces a potent and prolonged selective blockade of the H1 histamine receptors. It is free of anticholinergic and sedative effects, since ebastine and its metabolites do not cross the blood-brain barrier. Ebastel does not increase the sedative effects of alcohol. Its duration of action means Ebastel can be administered once daily.

Pharmacokinetic properties
Ebastine is rapidly absorbed after oral administration, undergoing a notable first pass hepatic metabolism effect which gives rise to its acid metabolite, carebastine.

After a single oral dose of 10 mg, maximum plasma levels of the metabolite are obtained between 2.6 and 4 hours and reach values of 80 to 100 ng/ml. The half-life of the acid metabolite is between 15 and 19 hours, with 66% of the drug 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.

Ebastine is metabolised to carebastine via enzyme CYP3A4. Concomitant administration of ebastine with CYP3A4 inhibitors to healthy volunteers is associated with significantly raised plasma concentrations of ebastine and carebastine, especially with ketoconazole. Both Ebastine and carebastine present high protein binding: > 97%.

No statistically significant differences are observed in the pharmacokinetic profile of elderly patients when compared with young adults.

Ebastine and carebastine plasma concentrations in patients with mild, moderate or severe renal impairment (daily doses of 20 mg/day) and in those with mild, moderate (both with doses of 20 mg/day) or severe (dose of 10 mg/day) hepatic impairment were similar to those reached in healthy volunteers, indicating that the pharmacokinetic profile of Ebastine and its metabolite does not change significantly in patients with various degrees of hepatic or renal impairment.

Pharmacodynamic properties
The studies carried out have demonstrated a clinically and statistically significant effect, initiating after 1 hour and lasting more than 48 hours. After suspending administration in a 5-day treatment with Ebastine, the antihistamine effect was apparent for more than 72 hours. This activity ran parallel to plasma levels of the main active acid metabolite, carebastine.
The inhibition of peripheral receptors remained constant after repeated administration. There was no tachyphylaxis. These results suggest that a dose of at least 10 mg of Ebastine causes rapid, intense and lasting inhibition of the peripheral histamine H1 receptors, consistent with a single daily administration.

No significant increase in sedation was observed at the recommended dose. These results are in line with those obtained in double-blind clinical trials: the incidence of sedation is comparable between placebo and Ebastine. The cardiac effects of Ebastine have been examined in clinical trials. No significant cardiac effects were observed in detailed analyses at daily doses of up to 100 mg (ten times the recommended daily dose).

Indications
Ebastel is indicated in the symptomatic treatment of allergic processes such as seasonal or perennial allergic rhinitis associated or not with allergic conjunctivitis (such as runny nose, itchy nose, itchy eyes, tears, sneezing), chronic urticaria and allergic dermatitis.

Contraindications
- Known hypersensitivity to the active ingredient or any of the excipients.
- This presentation is not indicated for children under 12 years of age. Oral solution is recommended for this group of patients.

Special warnings and precautions in use
Administer Ebastine with caution in patients with known cardiac risk, such as prolonged QT interval, in patients with altered blood potassium levels, concomitant treatment with drugs increasing the QT interval or those inhibiting the CYP3A4 enzyme, such as azole antifungals and macrolide antibiotics.

Ebastine should be used with caution in patients with severe hepatic impairment.

Since Ebastine reaches its therapeutic effect from 1 to 3 hours after administration, it should not be used in acute emergency allergy situations.

Warnings
Fertility, pregnancy and lactation
Fertility
There are no fertility data regarding ebastine in humans.

Pregnancy
Given that the risk of teratogenicity cannot be entirely excluded with absolute certainty, this medication should not be used during pregnancy, except when clearly necessary.

Breastfeeding
It is not known whether ebastine is excreted in mother's milk. The high degree of protein binding (> 97%) of ebastine and its main metabolite, carebastine, would suggest that excretion of the medication in mother's milk does not occur. As a precautionary measure this medication should not be used when breastfeeding.

Warning concerning excipients
This medication contains lactose. Patients with hereditary intolerance to galactose, Lapp lactase deficiency (a deficiency observed in some populations in Lapland) or poor glucose or galactose absorption should not take this medication.

Effects on ability to drive and use machinery
The psychomotor function has been widely studied in humans, with no observed effects. Ebastine does not affect the ability to drive or to use machinery at the recommended therapeutic doses.

However, in sensitive individuals who react unusually to ebastine, knowledge of their individual reactions is recommended before the patient drives or carries out complex activities: drowsiness or dizziness could occur.

Children
Use of the oral solution is recommended in children since the pharmaceutical form as tablets is not suitable for administration of doses below 10 mg.

Interactions
- The administration of Ebastine in combination with drugs inhibiting enzyme CYP3A4 (ketoconazole, itraconazole or erythromycin) causes pharmacokinetic and pharmacodynamic interactions. Ebastine plasma levels increase as a result. Caution is recommended when administering Ebastel to those patients in concomitant treatment with ketoconazole, itraconazole or erythromycin.
- Pharmacokinetic interactions have been observed when administering ebastine with rifampicin. These interactions could lead to a decrease in plasma concentrations and to a reduction of the antihistamine effects.
- No interactions have been described between ebastine and theophylline, warfarin, cimetidine, diazepam and alcohol.
- The administration of Ebastine with food does not modify its clinical effect.
- Ebastine could interfere with the results of skin prick tests for allergies, so it is advised not to have them until 5-7 days after suspension of treatment.
- It could increase the effects of other antihistamines.

Incompatibilities
None described to date.

Posology and administration route
Adults and children above 12 years of age
The usual dose is 1 tablet (10 mg of ebastine) once daily.

Children under 12 years of age
The use of the oral solution is recommended in this group of patients.

Elderly patients: It is not necessary to adjust the dose in elderly patients.

Renal impairment: It is not necessary to adjust the dose in patients with mild, moderate or severe renal impairment.

Hepatic impairment: It is not necessary to adjust the dose in patients with mild or moderate hepatic impairment. The maximum recommended daily dose (10 mg/day) should not be exceeded in cases of severe hepatic impairment.

Administration route
Oral route. It can be taken with or without food. Take the tablets with a glass of water.

Overdose
No clinically significant signs or symptoms were observed with doses of up to 100 mg once daily in studies carried out with high doses. There is no specific antidote for Ebastine. Gastric lavage should be considered, together with monitoring of vital constants, including ECG and symptomatic treatment.

Adverse reactions
The following adverse effects have been observed in clinical trials and in post-marketing experience:
Very frequent (they could affect more than 1 in every 10 persons):
- Headache

Frequent (they could affect up to 1 in every 10 persons):
- Drowsiness
- Dry mouth

Rare (they could affect up to 1 in every 1,000 persons):
- Hypersensitivity reactions (like anaphylaxis and angioedema)
- Restlessness, insomnia
- Dizziness, decreased sensation of touch or sensitivity, decreased or altered taste
- Palpitations, tachycardia
- Abdominal pain, vomiting, nausea, digestive problems
- Liver inflammation (hepatitis), cholestasis, anomalies in hepatic function analytic tests (raised transaminases, gamma-GT, alkaline phosphatase and bilirubin)
- Urticaria, rash, dermatitis
- Menstrual irregularities
- Oedema, fatigue

Not known (frecuency cannot be estimated from the available data):
- Weight increased
- Increased appetite

Consult your doctor or pharmacist if you observe any adverse reaction, even if it is not described in this patient information leaflet.

Shelf-life
This medication should not be used after the expiry date shown on the container.

Storage conditions
Do not store above 30°C.

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 the experts in medicines, their benefits and risks.
- Do not by yourself interrupt the period of treatment prescribed.
- Do not repeat the same prescription without consulting your doctor.
- Keep all medicaments out of reach of children.

Council of Arab Health Ministers,
Union of Arab Pharmacists.

Prescription medication
Keep out of the reach and sight of children

Manufacturer
Industrias Farmacéuticas Almirall, S.A.
Ctra. de Martorell, 41-61
08740 Sant Andreu de la Barca
Barcelona (Spain)

Marketing Authorisation Holder
Almirall, S.A. 08022 Barcelona (Spain)

Date of revision of text: 05/2019

80019750

80019750

80019750

Ebastel 10 mg
Comprimés pelliculés
Ébastine

Composition par comprimé
Ébastine (DCI) .....10 mg
Excipients : cellulose microcristalline, amidon de maïs prégélatinisé, lactose monohydraté, croscarmellose sodique, stéarate de magnésium, hypromellose, macrogol et dioxyde de titane.

Forme pharmaceutique et contenu de l'emballage
Comprimés pelliculés ronds, blancs, à face supérieure gravée avec E10. Boîtes de 10 (1x10), 20 (2x10) et 30 (3x10) comprimés.

Toutes les présentations ne sont pas disponibles pour tous les marchés.

Propriétés pharmacologiques
L'Ébastine, composant actif d'Ebastel, induit un blocage sélectif puissant et durable au niveau des récepteurs H1 de l'histamine. Le médicament ne possède pas d'effets anticholinergiques ni sédatifs car ni l'ébastine, ni ses métabolites ne traversent la barrière hématoencéphalique. Ebastel n'induit pas non plus de potentialisation des effets de l'alcool. Sa durée d'action permet d'administrer Ebastel une fois par jour.

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 carébastine.

Après administration d'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 réitérée de 10 mg une fois par jour, l´état stationnaire est atteint en 3 á 5 jours avec des concentrations plasmatiques maximales comprises entre 130 et 160 ng/ml.

L´ébastine est métabolisée en carébastine 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 carébastine. L'ébastine et la carébastine présentent une forte liaison aux protéines plasmatiques (> 97 %).

On n´observe pas de différences statistiquement significatives entre le profil pharmacocinétique des sujets âgés et celui des adultes jeunes.

Les concentrations plasmatiques de l´ébastine et de la carébastine chez des patients ayant une insuffisance rénale légère, modérée ou sévère (20 mg par jour), et chez des patientes ayant une insuffisance hépatique légère, modérée (20 mg par jour) ou sévère (10 mg par jour) ont été similaires à celles atteintes chez des volontaires sains, ce qui indique 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´une 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 carébastine.

Après administration réitérée, 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 d'histamine H1, conséquente avec une seule administration quotidienne.

À la dose recommandée, on n'observe aucune augmentation significative de la sédation. Ces résultats coïncident avec ceux obtenus lors 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).

Indications thérapeutiques
Ebastel est indiqué dans le traitement symptomatique des processus allergiques tels que la rhinite allergique saisonnière ou perannuelle associée ou non à une conjonctivite allergique (écoulement nasal, picotements du nez, picotements des yeux, larmoiement, envies d'éternuer, etc.), l'urticaire chronique et la dermatite allergique.

Contre-indications
- Hypersensibilité connue au principe actif ou à l´un des excipients.
- Cette présentation n'est pas indiquée chez les enfants de moins de 12 ans. La solution orale est recommandée pour ce groupe de patients.

Précautions d'emploi
Administrer l'ébastine avec précaution chez les patients ayant un risque cardiaque connu tel que l'allongement de l´intervalle QT, chez les patients dont le taux de potassium sanguin est altéré, un traitement concomitant avec des médicaments qui allongent l´intervalle QT ou qui inhibent l'enzyme CYP3A4, tels que les antifongiques azolés et les antibiotiques macrolides.
L'ébastine doit être administrée avec précaution chez les patients souffrant d'insuffisance hépatique sévère.

Étant donné que l'ébastine atteint son effet thérapeutique au bout d'1 à 3 heures après son administration, elle ne doit pas être utilisée en cas de crise allergique aiguë.

Mises en garde
Fertilité, grossesse et allaitement
Fertilité
Il n'existe aucune donnée concernant les effets de l'ébastine sur la fertilité chez l'être humain.

Grossesse
Dans la mesure où le risque de tératogenèse 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.

Allaitement
On ignore si l'ébastine est excrétée dans le lait maternel. Le taux élevé de liaison (> 97 %) de l'ébastine et de son principal métabolite, la carébastine, suggèrent l'absence d'excrétion du médicament dans le lait maternel. Par mesure de précaution, ce médicament ne doit pas être utilisé pendant l'allaitement.

Mises en garde sur les excipients
Ce médicament contient du lactose. Les patients présentant une intolérance héréditaire au galactose, un déficit en lactase de Lapp (insuffisance observée chez certaines populations lapones) ou un syndrome de malabsorption du glucose ou du galactose ne peuvent pas prendre ce médicament.

Conduite et utilisation de machines
La fonction psychomotrice a été largement étudiée chez l'être humain sans que l'on ait observé d'effets. Aux doses thérapeutiques recommandées, l'ébastine n'a aucun effet sur l'aptitude à conduire ou utiliser des machines.
Cependant, chez les sujets sensibles qui présentent une réponse inhabituelle à l'ébastine, il est recommandé que le patient connaisse ses réactions individuelles à ce médicament avant de conduire ou d'effectuer des tâches complexes : de la somnolence ou des étourdissements peuvent apparaître.

Enfants
L'administration de la solution orale est recommandée car la forme pharmaceutique comprimé n'est pas adaptée aux doses inferieures à 10 mg.

Interactions
- L'administration concomitante de l'ébastine avec des médicaments inhibiteurs de l'enzyme CYP3A4 (kétoconazole, itraconazole ou érythromycine) produit des interactions pharmacocinétiques et pharmacodynamiques. Par conséquent, ces médicaments augmentent les niveaux plasmatiques d'ébastine. Il est recommandé d'administrer Ebastel avec précaution chez des patients sous traitement concomitant avec le kétoconazole, l'itraconazole ou l'érythromycine.
- Des interactions pharmacocinétiques ont été observées lors de l'administration de l'ébastine avec de la rifampicine. Ces interactions peuvent produire une diminution des concentrations plasmatiques et une réduction des effets antihistaminiques.
- Aucune interaction entre l'ébastine et la théophylline, la warfarine, la cimétidine, le diazépam ou l'alcool n'a été décrite.
- L'administration de l'ébastine avec une prise alimentaire ne modifie pas son effet clinique.
- L'ébastine peut interférer avec les résultats des tests allergiques cutanés, il est donc conseillé de ne pas les réaliser jusqu´à 5 à 7 jours après l´arrêt du traitement.
- Elle peut potentialiser les effets d´autres antihistaminiques.

Incompatibilités
Elles n´ont pas été décrites à ce jour.

Posologie et mode d'administration
Adultes et enfants de plus de 12 ans
1 comprimé (soit 10 mg d'ébastine) une fois par jour.
Enfants de moins de douze ans
L'utilisation de la forme pharmaceutique solution est recommandée chez ce groupe de patients.

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

Insuffisance rénale : chez les patients atteints d'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).

Mode d'administration
Administration orale. Ce médicament peut être pris avec ou sans nourriture. Prendre les comprimés avec un verre d'eau.

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

Effets indésirables
Lors des essais cliniques et de l'expérience post-mise sur le marché, les effets indésirables suivants ont été observés :
Très fréquents (pouvant affecter plus de 1 personne sur 10) :
- Maux de tête

Fréquents (pouvant affecter jusqu'à 1 personne sur 10) :
- Somnolence
- Bouche sèche

Rares (pouvant affecter jusqu'à 1 personne sur 1 000) :
- Réactions d'hypersensibilité (telles qu'anaphylaxie et œdème de Quincke)
- Nervosité, insomnie
- Nausées, diminution du toucher ou de la sensibilité, diminution ou altération du goût
- Palpitations, tachycardie
- Douleurs abdominales, vomissements, nausées, problèmes digestifs
- Inflammation hépatique (hépatite), cholestase, tests de la fonction hépatique anormaux (augmentation des transaminases, des gamma-GT, de la phosphatase alcaline et de la bilirubine)
- Urticaire, éruptions cutanées, dermatite
- Troubles menstruels
- Œdème, fatigue

Fréquence indéterminée (la fréquence ne peut être estimée sur la base des données disponibles).
- Prise de poids
- Augmentation de l'appétit

Si des effets indésirables apparaissent, y compris des effets qui ne seraient pas mentionnés dans cette notice, parlez-en à votre médecin ou à votre pharmacien.

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

Conditions de conservation
Ne pas conserver à des températures supérieures à 30 ºC.

Vente sur ordonnance medicale
Tenir hors de la portée et de la vue des enfants

Fabricant
Industrias Farmacéuticas Almirall, S.A.
Ctra. de Martorell, 41-61
08740 Sant Andreu de la Barca, Barcelone (Espagne)

Titulaire de l'autorisation de mise sur le marché
Almirall, S.A. 08022 Barcelone (Espagne)

La dernière date à laquelle cette notice a été révisée est : 05/2019

إباستيل 10 ملجم
أقراص مغلفة
إباستين

مكونات كل قرص:
إباستين (الاسم الدولي غير التجاري).....10 ملجم
المواد المضافة: سليولوز دقيق البلورة، نشا الذرة المعدل، لاكتوز أحادي الهيدرات، كروسكارميللوز صوديوم، ستيرات المغنيسيوم، هيبروميللوز، ماكروغول وثاني أكسيد التيتانيوم.

الشكل الصيدلاني ومحتويات العبوة
أقراص مغلفة بيضاء اللون، دائرية الشكل على أحد الوجهين علامة E10 معبأة في في عبوات تحوي على 10(1x10)، 20(2x10) و 30(3x10) قرص.
ليس كل العبوات متوفرة في كل الأسواق.

الخصائص الدوائية
إباستين، المادة الفعالة لإباستيل، يحدث إعاقة انتقائية قوية وطويلة الأمد لمستقبلات الهيستامين اتش1. يفتقر هذا الدواء الى أي تأثيرات مهدئة ومضادة للكولين، حيث انه ونواتجه الأيضيه لا تعبر من خلال الحائل الدماغي الدموي. كما أنه لا يحدث زيادة في تأثيرات الكحول المهدئة. بسبب فترة مفعوله الطويلة فإنه يعطى مرة واحدة في اليوم.

خصائص الحركيات الدوائية
يتم امتصاص إباستين بسرعة بعد تناوله عن طريق الفم. وهو يخضع لعملية الأيض الكبدي الأولي بشكل كبير مما يؤدي الى ظهور ناتجه الأيضي الحمضي، كارباستين.
بعد تناول جرعة مفردة تركيزها 10 ملجم، تصل مستويات ناتج إباستين الأيضي في البلازما الى الحد الأعلى بعد مرور 2.6 الى 4 ساعات وتصل قيمته الى ما بين 80-100 نانوجرام/مل. العمر النصفي للناتج الأيضي الحمضي ما بين 15 و19 ساعة، و66% من المركب يخرج في البول، وبصورة رئيسية كنواتج أيضية مقترنة. بعد التناول المتكرر لجرعة 10 ملجم مرة واحدة في اليوم، تحصل حالة الثبات في غضون 3 الى 5 أيام وتصل الى أقصى مستويات في البلازما ما بين 130 و160 نانوجرام/مل.
يعمل انزيم سي واي پي3 ايه4 كوسيط لتأيض الإباستين الى كارباستين. يسبب التناول المتزامن لإباستين ومثبطات انزيم سي واي پي3 ايه4 من قبل متطوعين أصحاء زيادة كبيرة لتراكيز الإباستين والكارباستين في البلازما، وخصوصاً مع الكيتوكونازول. ويظهر كل من إباستين وكارباستين ألفة عالية للارتباط البروتيني، أكثر من 97%.
لم يلاحظ وجود فرق احصائي كبير في الحركية الدوائية بين كبار السن وصغار البالغين.
تراكيز الإباستين والكارباستين في البلازما لدى المرضى الذين يعانون من قصور كلوي خفيف، متوسط او شديد (بجرعات يومية 20 ملجم/اليوم) ولدى المرضى الذين يعانون من قصور كبدي خفيف، متوسط (كلاهما بجرعات 20 ملجم/اليوم) أو شديد (بجرعة 10 ملجم/اليوم) كانت مشابهة لتلك التي حصلت لدى المتطوعين الأصحاء، ما يبين أن الحركية الدوائية لإباستين وناتجه الايضي لا تخضع الى تغير كبير في المرضى الذين يعانون من درجات مختلفة من القصور الكلوي أو الكبدي.

خصائص الديناميكية الدوائية
أظهرت الدراسات السريرية والاحصائية التي اجريت مفعول كبير، يبدأ بعد مرور ساعة وينتهي بعد مرور أكثر من 48 ساعة. بعد التوقف عن العلاج بإباستين لمدة 5 أيام، ظل تأثيره المضاد للهيستامين ظاهرا لمدة تزيد عن 72 ساعة. وكان هذا النشاط متوازيا مع مستويات الناتج الأيضي الحمضي الأساسي، كارباستين. ظل تثبيط للمستقبلات الطرفية ثابتا بعد الاعطاء المتكرر في ظل غياب تسرع المناعة. هذه النتائج تبين ان جرعة إباستين 10 ملجم على الاقل تحدث تثبيط سريع، شديد وثابت لمستقبلات الهيستامين اتش1 بعد تناوله اليومي المفرد.
لم تلاحظ زيادة في المفعول المهدئ عند تناوله بالجرعة الموصى بها. هذه النتائج تبعا لما تم التوصل اليه من التجارب السريرية ذات نظام التعمية المزدوجة: حدوث المفعول المهدئ؛ تمت دراسته بالمقارنة بين مادة خاملة المفعول والإباستين.
تمت دراسة تأثيرات الإباستين القلبية في التجارب السريرية. لم يلاحظ تأثيرات قلبية شديدة في التحاليل المفصلة للجرعات حتى 100 ملجم في اليوم (عشر مرات أكبر من الجرعة اليومية الموصى بها).

دواعي الاستعمال
يستعمل إباستيل لمعالجة أعراض حالات الحساسية كالتهاب الأنف التحسسي الموسمي أو الدائم المتلازم مع التهاب الملتحمة التحسسي (سيلان الأنف، حكة الانف، حكة العين، سيلان الدموع، عطس)، الشرى المزمن، التهاب الجلد التحسسي.

موانع الاستعمال
- فرط الحساسية من المادة الفعالة أو أي من المواد المضافة.
- هذا المنتج لا يوصف للأطفال دون سن 12 سنة من العمر.
  يوصى بالمحلول السائل عن طريق الفم لهذه الفئة العمريه من المرضى.

احتياطات وتحذيرات خاصة
يعطى إباستين بحذر للمرضى الذين يعانون من مشاكل قلبية مثل المرضى الذين عندهم فترة الكيو تي مطولة، في ي المرضى الذين يعانون من تغيير مستويات البوتاسيوم في الدم الاعطاء المتزامن مع أدوية تزيد من فترة الكيو تي او التي تثبط من انزيم سي واي پي3ايه4، مثل أدوية الأزول المضادة للفطريات والمضادات الحيوية الماكروليدية.
يجب استعمال إباستين بحذر في حالة المرضى المصابين بقصور كبدي شديد.
حيث ان مفعول إباستين يبدأ بعد تناوله بساعة إلى ثلاث ساعات فانه لا يجب استعماله في حالات الحساسية الحادة الطارئة.

تحذيرات
الخصوبة، الحمل والإرضاع
الخصوبة
لا توجد معلومات تخص الخصوبة عند استعمال إباستين في الإنسان.
الحمل
حيث انه لايمكن اهمال تأثير التشويه الخلقي بشكل كامل، فانه يجب عدم استعمال هذا الدواء أثناء الحمل، الا اذا كان استعماله ضروريا جدا.
الإرضاع
ليس معروفاً ما إن كان إباستين ينفذ إلى حليب الأم. درجة الارتباط البروتيني العالية (أكثر من 97%) لإباستين وناتجه الأيضي الأساسي، كارباستين، من شأنه أن يبين عدم إمكانية نفوذ الدواء إلى حليب الأم. وكإجراء احتياطي، يجب عدم استعمال هذا الدواء عند الإرضاع.

تحذيرات تتعلق بالمكونات المضافة
اللاكتوز أحد مكونات هذا الدواء. يجب ألا يتناول هذا الدواء المرضى الذين لديهم عدم تحمل وراثي من الجالاكتوز، عوز لاب لاكتوز (عوز لوحظ في بعض سكان لابلاند) أو سوء امتصاص الجلوكوز أو الجالاكتوز.

القيادة وتشغيل المكائن
تمت دراسة الوظيفة الحركية النفسية بشكل موسع في الإنسان، ولم يلاحظ تأثرها. لا يؤثر إباستين على القدرة على القيادة أو استعمال المكائن عند تناول
الجرعة العلاجية الموصى بها.
ومع ذلك، في الأفراد الحساسين الذين يحدث لديهم ردود فعل من الإباستين، ينصح بمعرفة ردود الفعل الفردية لديهم قبل القيادة أو القيام بأعمال
معقدة: فمن الممكن أن يحدث نعاس أو دوار.

الأطفال
ينصح باستعمال المحلول الفموي للأطفال حيث إن الشكل الصيدلاني كأقراص لا يتناسب مع إعطائهم جرعات أقل من 10 ملجم.

التداخلات الدوائية
- التناول المتزامن لإباستين مع مثبطات انزيم سي واي پي3ايه4 (كيتوكونازول،إتراكونازول أو إريثرومايسين) يؤدي الى تداخلات في الحركيات الدوائية
والديناميكية الدوائية. وفيما بعد، تزيد مستويات إباستين في البلازما. لذلك يجب اعطاء إباستين بحذر للمرضى الذين يتناولون كيتوكونازولن،
إتراكونازول أو إريثرومايسين.
- لوحظ حدوث تداخلات في الحركية الدوائية عند إعطاء إباستين مع ريفامبيسين. وقد تؤي هذه التداخلات إلى نقص التراكيز البلازمية وإلى نقص
التأثيرات المضادة للهيستامين.
- لم توصف تداخلات ما بين الإباستين والثيوفيللين، الوارفارين، السيميتيدين، الديازيبام والكحول.
- لا يغير تناول إباستين مع الطعام تأثيراته السريرية.
- قد يؤثر إباستين على نتائج فحوصات الحساسية الجلدية، وبالتالي ينصح بعدم انجاز هذه الاختبارات الا بعد 5-7 أيام من وقف العلاج.
- قد يزيد من تأثيرات أدوية أخرى مضادة للهيستامين.

اللاتوافقية الدوائية
لم يوصف أي شيء حتى هذا التاريخ.

الجرعة وطريقة الاستعمال
البالغين والأطفال الأكبر من 12 سنة من العمر
الجرعة المعتادة هي 1 قرص (10 ملجم إباستين) مرة واحدة في اليوم.

الأطفال الأصغر من 12 سنة من العمر
ينصح باستعمال محلول فموي لهذه الفئة العمرية.

كبار السن: لا حاجة الى تعديل الجرعة للمرضى المسنين.

القصور الكلوي:
لا حاجة الى تعديل الجرعة للمرضى المصابين بقصور كلوي بسيط، متوسط أو شديد.

القصور الكبدي:
لا حاجة الى تعديل الجرعة للمرضى الذين يعانون من قصور كبدي بسيط أو متوسط. ويجب عدم تجاوز الجرعة اليومية القصوى (10 ملجم/اليوم) في
حالات القصور الكبدي الشديد.

طريقة الاستعمال
للاستعمال عن طريق الفم. ويمكن تناوله مع أو بدون طعام. تناول الأقراص مع كوب من الماء.

فرط الجرعة
لم تشر الدراسات التي أجريت على الجرعات العالية الى علامات أو أعراض سريرية شديدة حتى على جرعات تصل الى 100 ملجم مرة واحدة في اليوم.
لا يوجد ترياق لإباستين. يجب عمل إجراء غسل المعدة، مع مراقبة الثوابت الحيوية بما في ذلك تخطيط القلب الكهربائي ومعالجة الأعراض.

الآثار السلبية
لوحظ حدوث الآثار السلبية التالية في التجارب السريرية وفي المعلومات المجمعة من ما بعد التسويق:

متكررة جداً (قد تؤثر على أكثر من 1 شخص من ضمن 10 أشخاص):
- صداع

متكررة (قد تؤثر على 1 شخص كحد أقصى من ضمن 10 أشخاص):
- نعاس
- جفاف الفم

نادرة (قد تؤثر على 1 شخص كحد أقصى من ضمن 1000 أشخاص):
- ردود فعل فرط الحساسية (كالإعوار والوذمة الوعائية)
- عدم الارتياح، الأرق
- دوار، نقص الإحساس باللمس أو التحسس، نقص أو تغير المذاق
- خفقان، تسارع القلب
- ألم بطني، تقيؤ، غثيان، مشاكل هضمية
- التهاب (التهاب الكبد)، ركود صفراوي ظهور خلل في نتائج الفحص الكبدي (زيادة الإنزيمات الناقلة للأمين، جاما-جي تي، الفوسفاتيز القلوي والبيليروبين)
- أورتيكاريا، طفح، التهاب الجلد
- اضطرابات طمثية
- وذمة، تعب

(غير معروف (لا يمكن تقدير التركرار من البيانات المتوفرة
- زيادة الوزن
- زيادة الشهية

اذا لاحظت أي آثار جانبية سواءاً مذكورة أو غير مذكورة في هذه النشرة الخاصة بالمريض، استشر طبيبك أو الصيدلي.

عمر الدواء
لا تستعمل هذا الدواء بعد تاريخ الانتهاء المذكور على العبوة.

تعليمات التخزين:
لا يحفظ عند درجة حرارة أعلى من 30°م.

(ان هذا الدواء)
- **الدواء مستحضر يؤثر على صحتك واستهلاكه خلافا للتعليمات يعرضك للخطر**
- **اتبع بدقه وصفه الطبيب وطريقة الاستعمال المنصوص عليها وتعليمات الصيدلاني الذى صرفها لك**
- **الطبيب والصيدلاني هما الخبيران بالدواء وبنفعه وضرره**
- **لاتقطع مدة العلاج المحددة لك من تلقاء نفسك**
- **لاتكرر صرف الدواء بدون وصف طبيب**
- **لاتترك الادوية في متناول أيدى الاطفال**

مجلس وزراء الصحة العرب
واتحاد الصيدلة العرب

يصرف بوصفة طبية
يحفظ في مكان بعيد عن متناول الأطفال

المصنع
اندستریاس فارماسیوتیکاس ألمیرال، اس.إیه.
شارع مارتوريل 41-61
08740 سانت أندريو دي لا بارسا
برشلونة (اسبانيا)

ألميرال
مالك حق التسويق
ألميرال، إس.إيه. 08022 برشلونة (اسبانيا)

تاريخ تعديل النص: 2019/05

almirall

80019750