

## **Ebastel**

ebastina

## **Oral**

## **Xarope**

**USO PEDIÁTRICO (ACIMA DE 2 ANOS)**

## **Comprimido**

**USO PEDIÁTRICO (ACIMA DE 12 ANOS) E ADULTO**

## **FORMAS FARMACÊUTICAS E APRESENTAÇÕES: - EBASTEL**

Comprimidos revestidos contendo 10 mg de ebastina.

Embalagem com 10 comprimidos.

Xarope de ebastina a 1 mg/mL.

Frasco de 60 mL.

## **COMPOSIÇÃO: - EBASTEL**

**Ebastel** comprimidos

Cada comprimido contém:

ebastina .....10 mg

Excipientes q.s.p .....1 comprimido

*Excipientes: celulose microcristalina, amido pré-gelatinizado, lactose monohidratada, croscarmelose sódica, estearato de magnésio, hipromelose, macrogol, dióxido de titânio.*

**Ebastel** xarope

Cada ml contém:

ebastina .....1,0 mg

Excipientes q.s.p .....1,0 mL

*Excipientes: ácido láctico 85%, glicerina polietilenoglicol oxiestearato, neohesperidina dihidrochalcone, anetol, metil p-hidroxibenzoato de sódio, propil p-hidroxibenzoato de sódio, glicerina, sorbitol 70%, dimetilpolixiloxana, hidróxido de sódio, água.*

## **INFORMAÇÕES AO PACIENTE: - EBASTEL**

### **Ação esperada do medicamento**

**Ebastel** (ebastina) é um anti-alérgico potente, que não apresenta efeitos sobre o Sistema Nervoso Central (SNC).

### **Cuidados de armazenamento**

**Ebastel** (ebastina) deve ser mantido em sua embalagem original, sendo que **Ebastel** (ebastina) comprimidos deve ser conservado em temperatura ambiente (entre 15°C e 30°C), protegido da luz e umidade; enquanto **Ebastel** (ebastina) xarope deve ser conservado em temperatura ambiente (entre 15°C e 30°C) e protegido da luz.

### **Prazo de validade**

Desde que observados os devidos cuidados de conservação, o prazo de validade do produto é de 24 meses, contados a partir da data de fabricação impressa em sua embalagem externa.

**NÃO USE MEDICAMENTOS COM O PRAZO DE VALIDADE VENCIDO.**

### **Gravidez e lactação**

**Ebastel** (ebastina) não deve ser utilizado por mulheres que estejam amamentando.

Informe ao seu médico a ocorrência de gravidez na vigência do tratamento ou após o seu término.

Informe ao seu médico se está amamentando.

**ESTE MEDICAMENTO NÃO DEVE SER UTILIZADO POR MULHERES GRÁVIDAS SEM ORIENTAÇÃO MÉDICA.**

### **Cuidados de administração**

**Ebastel** xarope (ebastina) vem acompanhado de uma seringa graduada (numerada) e de um adaptador. Deve-se encaixar este adaptador à boca do frasco antes de administrar o produto. A função deste adaptador é permitir que o paciente consiga retirar, com o auxílio da seringa graduada, a quantidade exata de xarope a ser administrada mesmo quando o conteúdo do frasco estiver no final.

**Ebastel** xarope (ebastina) deve ser administrado, por via oral, com o auxílio da seringa graduada que acompanha o medicamento.

Siga a orientação do seu médico, respeitando sempre os horários, as doses e a duração do tratamento.

### **Interrupção do tratamento**

Não interromper o tratamento sem o conhecimento do seu médico.

### **Reações adversas**

Durante o tratamento com **Ebastel** (ebastina) podem ocorrer: dor de cabeça, sensação de boca seca, sonolência, faringite, dor no abdome, azia, cansaço, sangramento nasal, rinite, sinusite, náusea, insônia.

Informe seu médico o aparecimento de reações desagradáveis.

**TODO MEDICAMENTO DEVE SER MANTIDO FORA DO ALCANCE DAS CRIANÇAS.**

### **Ingestão concomitante com outras substâncias**

A administração de **Ebastel** (ebastina) com alimentos promove um aumento dos níveis sanguíneos da carebastina de 1,5 a 2 vezes, sem alterar a concentração máxima. A administração de **Ebastel** (ebastina) com alimentos não modifica os seus efeitos.

A ebastina não apresenta interação com o álcool.

### **Contra-indicações e Precauções**

**Ebastel** (ebastina) não deve ser administrado em crianças menores de 2 anos de idade.

Deve-se ter cautela na administração de **Ebastel** (ebastina) em pacientes com problemas nos rins ou fígado de intensidade leve a moderada, problemas cardíacos ou potássio baixo no sangue.

O uso deste medicamento é contra-indicado em casos de hipersensibilidade (reação alérgica) aos componentes da formulação.

Informe ao seu médico sobre qualquer medicamento que esteja usando, antes do início ou durante o tratamento.

**NÃO TOME REMÉDIO SEM O CONHECIMENTO DO SEU MÉDICO. PODE SER PERIGOSO PARA SUA SAÚDE.**

## **INFORMAÇÕES TÉCNICAS: - EBASTEL**

### **Características**

#### **Modo de ação**

A ebastina mostrou produzir inibição rápida e de longa duração dos efeitos induzidos pela histamina, além de possuir forte afinidade por receptores H1.

A ebastina e seus metabólitos não atravessam a barreira hematoencefálica após administração por via oral, o que explica o pequeno efeito sedativo encontrado nos resultados dos estudos que avaliaram os efeitos da ebastina sobre o sistema nervoso central. Dados "in vitro" e "in vivo" demonstram que ebastina exerce potente antagonismo dos receptores H1, de longa duração e altamente seletivo, não apresentando efeitos sobre o SNC ou efeitos anticolinérgicos.

Estudos relatados de indução de pápula por histamina mostraram que a ebastina apresenta efeito anti-histamínico estatística e clinicamente significativa, com início de ação após uma hora da administração por via oral e com duração de 48 horas. Observou-se também que, com a interrupção da administração de ebastina após tratamento durante 5 dias, a atividade anti-histamínica persiste por mais do que 72 horas. Esta atividade é devida aos níveis plasmáticos do principal metabólito ácido ativo, a carebastina.

Após administrações repetidas, a inibição dos receptores periféricos permanece num nível constante, sem taquifilaxia. Estes resultados sugerem que a administração de dose diária mínima de 10 mg de ebastina produz inibição rápida, intensa e de longa duração dos receptores histamínicos H1 periféricos.

Há relatos onde estudou-se a sedação através de fármacoeletoencefalograma, desempenho cognitivo, testes de coordenação visual-motora e estimativas subjetivas. Não houve aumento significativo da sedação na dose recomendada. Estes dados são compatíveis com os resultados dos estudos clínicos duplo-cegos realizados, onde a incidência de sedação mostrou-se comparável entre placebo e ebastina.

Nos relatos de estudos clínicos realizados em adultos e crianças não se observaram efeitos cardíacos causados pela administração de ebastina nas doses recomendadas, incluindo prolongamento do intervalo QT.

Com a administração da dose de 60 mg/dia de ebastina não se observou efeito sobre o intervalo QT. Com a administração da dose de 100 mg/dia observou-se um aumento estatisticamente significativo de 10 mseg (2,7%), que não foi contudo, clinicamente significativo.

Após a administração de dose diária de 15 mg de ebastina em crianças com idade entre 6 e 11 anos durante 6 dias, não foram observadas diferenças no intervalo QT médio entre os grupos tratados com ebastina ou placebo, no primeiro e sexto dias do tratamento.

### **Farmacocinética**

Após administração por via oral, a ebastina é rapidamente absorvida, sofrendo extenso metabolismo de primeira passagem. A ebastina é quase completamente convertida ao seu metabólito ácido farmacologicamente ativo, a carebastina.

Após a administração de dose única de 10 mg de ebastina, os níveis plasmáticos máximos de 80 a 100 ng/ml do metabólito ocorrem dentro de 2,6 a 4 horas. A meia-vida do metabólito ácido é de 15-19 horas, sendo que 66% da droga é excretada na urina, principalmente na forma de metabólito conjugado. Após administrações repetidas de 10 mg de ebastina, uma vez ao dia, o estado de equilíbrio é atingido em 3 a 5 dias, com níveis plasmáticos máximos variando entre 130 a 160 ng/ml.

Os parâmetros farmacocinéticos da carebastina se mostraram linear e dose independentes após a administração de 5 e 10 mg de ebastina na forma de xarope, com obtenção de níveis plasmáticos máximos de 108 e 209 ng/ml de carebastina dentro de 2,8 e 3,4 horas, respectivamente. A meia-vida de eliminação da carebastina variou entre 10 e 14 horas.

Os relatos de estudos "in vitro" com microsomas hepáticos humanos mostraram que a ebastina é metabolizada à carebastina principalmente via CYP3A4. A administração simultânea de ebastina com cetoconazol ou eritromicina (ambos inibidores CYP3A4) em voluntários sadios foi associada ao aumento significativo das concentrações plasmáticas de ebastina e carebastina (vide "INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS").

A ligação às proteínas plasmáticas tanto da ebastina quanto da carebastina é alta, > 95%.

Não foram observadas alterações estatisticamente significantes da farmacocinética de ebastina em idosos, em comparação à farmacocinética em voluntários adultos jovens.

A meia-vida de eliminação da carebastina aumentou para 23 - 26 horas e 27 horas, respectivamente, em pacientes com insuficiência renal e em pacientes com insuficiência hepática.

#### **- INDICAÇÕES:**

É indicado para o tratamento sintomático de:

- rinite alérgica (sazonal ou perene) associada ou não à conjuntivite alérgica.
- urticária idiopática crônica.

#### **CONTRA-INDICAÇÕES: - EBASTEL**

- HIPERSENSIBILIDADE À EBASTINA OU A QUALQUER OUTRO COMPONENTE DO PRODUTO.
- PACIENTES COM INSUFICIÊNCIA HEPÁTICA SEVERA.

#### **PRECAUÇÕES E ADVERTÊNCIAS: - EBASTEL**

**EBASTEL (EBASTINA) NÃO DEVE SER ADMINISTRADO EM CASO DE DOENÇA ALÉRGICA AGUDA QUE NECESSITE DE ATENÇÃO URGENTE (POR EXEMPLO: ANAFILAXIA), JÁ QUE O EFEITO TERAPÊUTICO APARECE 1 A 3 HORAS APÓS A ADMINISTRAÇÃO.**

**EBASTEL (EBASTINA) NÃO DEVE SER ADMINISTRADO EM CRIANÇAS MENORES DE 2 ANOS DE IDADE, POIS OS PARÂMETROS DE SEGURANÇA NÃO FORAM ESTABELECIDOS PARA ESTA FAIXA ETÁRIA.**

COMO ACONTECE COM OUTROS ANTI-HISTAMÍNICOS, DEVE-SE TER CAUTELA QUANDO DO USO DE **EBASTEL (EBASTINA)** EM PACIENTES COM: SÍNDROME DE PROLONGAMENTO DO INTERVALO QT, HIPOCALEMIA, TRATAMENTO COM QUALQUER MEDICAMENTO QUE PROVOQUE AUMENTO DO INTERVALO QT OU INIBIÇÃO DOS SISTEMAS ENZIMÁTICOS CYP3A4 TAIS COMO ANTIFÚNGICOS AZÓIS E ANTIBIÓTICOS MACROLÍDEOS (VIDE "INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS").

**EBASTEL (EBASTINA) DEVE SER UTILIZADO COM CAUTELA EM PACIENTES COM INSUFICIÊNCIA RENAL OU HEPÁTICA DE INTENSIDADE LEVE A MODERADA (VIDE "POSOLOGIA" E "PROPRIEDADES FARMACOCINÉTICAS").**

**EFEITOS SOBRE A HABILIDADE PARA DIRIGIR E OPERAR MÁQUINAS:** A FUNÇÃO PSICOMOTORA TEM SIDO ESTUDADA EXTENSIVAMENTE EM HUMANOS, SENDO QUE NÃO FORAM ENCONTRADOS EFEITOS NAS DOSES TERAPÊUTICAS RECOMENDADAS. OS RELATOS DE UM ESTUDO DIRECIONADO SOBRE HABILIDADE PARA DIRIGIR INDICOU QUE A EBASTINA NÃO PROVOCA PREJUÍZO DA CAPACIDADE PARA DIRIGIR MESMO COM A ADMINISTRAÇÃO DE 30 MG. COM BASE NESTES RESULTADOS, A ADMINISTRAÇÃO DE EBASTINA NAS DOSES TERAPÊUTICAS RECOMENDADAS NÃO AFETA A HABILIDADE PARA DIRIGIR OU OPERAR MÁQUINAS.

#### **GRAVIDEZ**

A SEGURANÇA DA ADMINISTRAÇÃO DE EBASTINA DURANTE A GRAVIDEZ HUMANA AINDA NÃO FOI ESTABELECIDO. RELATOS DE ESTUDOS EM RATOS E CAMUNDONGOS NÃO INDICARAM QUALQUER EFEITO NOCIVO DIRETO OU INDIRETO SOBRE O DESENVOLVIMENTO EMBRIONÁRIO OU FETAL, DURANTE A GESTAÇÃO OU DESENVOLVIMENTO PERI E PÓS-NATAL. NÃO FORAM IDENTIFICADOS EFEITOS TERATOGÊNICOS EM ANIMAIS; PORÉM NÃO EXISTEM ESTUDOS BEM-CONTROLADOS EM MULHERES GRÁVIDAS E ESTUDOS REPRODUTIVOS NEM SEMPRE SÃO DEMONSTRATIVOS DA RESPOSTA HUMANA. PORTANTO, A EBASTINA SÓ DEVE SER UTILIZADA DURANTE A GRAVIDEZ EM CASO DE NECESSIDADE EVIDENTE.

**ESTE MEDICAMENTO NÃO DEVE SER UTILIZADO POR MULHERES GRÁVIDAS SEM ORIENTAÇÃO MÉDICA.**

#### **LACTAÇÃO**

NÃO SE CONHECE A RESPEITO DA EXCREÇÃO DA EBASTINA NO LEITE MATERNO, PORTANTO EBASTEL® (EBASTINA) NÃO DEVE SER UTILIZADO POR MULHERES QUE ESTEJAM AMAMENTANDO.

#### **INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS: - EBASTEL**

A EBASTINA PODE INTERFERIR NO RESULTADO DE TESTE ALÉRGICO CUTÂNEO, SENDO PRUDENTE NÃO REALIZÁ-LO NO PERÍODO DE 5 A 7 DIAS APÓS A SUSPENSÃO DO TRATAMENTO.

A EBASTINA PODE POTENCIALIZAR O EFEITO DE OUTROS ANTIHISTAMÍNICOS.

FORAM OBSERVADAS INTERAÇÕES FARMACOCINÉTICA E FARMACODINÂMICA COM AS ASSOCIAÇÕES EBASTINA E CETOCONAZOL OU ERITROMICINA (AMBOS CONHECIDOS POR PROLONGAR O INTERVALO QT), RELATANDO-SE UM AUMENTO DE 18-19 MSEG (4,7 - 5%) NO INTERVALO QT.

A EBASTINA NÃO APRESENTA INTERAÇÃO COM TEOFILINA, VARFARINA, CIMETIDINA, DIAZEPAM OU ÁLCOOL.

#### **REAÇÕES ADVERSAS: - EBASTEL**

AS REAÇÕES ADVERSAS MAIS FREQUENTES NOS RELATOS DE ESTUDOS CLÍNICOS COM EBASTEL (EBASTINA) FORAM: CEFALÉIA, BOCA SECA E SONOLÊNCIA; COMPARÁVEIS AO PLACEBO.

OUTRAS REAÇÕES ADVERSAS RELATADAS COM MENOR FREQUÊNCIA FORAM: FARINGITE, DOR ABDOMINAL, DISPEPSIA, ASTENIA, EPISTAXE, RINITE, SINUSITE, NÁUSEA E INSÔNIA.

## **POSOLOGIA: - EBASTEL**

### **Comprimido**

#### Adultos e crianças maiores de 12 anos:

Rinite alérgica: doses de 10 mg, uma vez ao dia, são eficazes no alívio dos sintomas da rinite alérgica.

Em pacientes com sintomas mais intensos, incluindo rinite alérgica sazonal, doses de 20 mg promovem maior alívio.

Urticária Idiopática Crônica: 10 mg, uma vez ao dia.

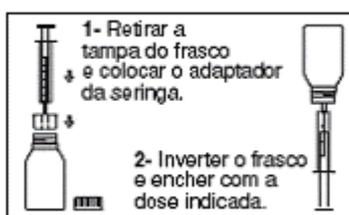
### **Xarope**

Crianças com idade entre 6 a 11 anos: 5 mL de xarope, uma vez ao dia.

Crianças com idade entre 2 e 5 anos: 2,5 mL de xarope, uma vez ao dia.

#### Populações especiais:

Em pacientes com insuficiência hepática leve a moderada não se deve exceder a dose de 10 mg.



**Ebastel** xarope (ebastina) vem acompanhado de uma seringa graduada e de um adaptador. Deve-se acoplar este adaptador à boca do frasco antes de administrar o produto. A função deste adaptador é permitir que o paciente consiga retirar, com o auxílio da seringa graduada, a quantidade exata de xarope a ser administrada mesmo quando o conteúdo do frasco estiver no final.

**Ebastel** xarope (ebastina) deve ser administrado, por via oral, com o auxílio da seringa graduada que acompanha o medicamento.

#### **- SUPERDOSAGEM:**

Em relatos de estudos realizados com a administração diária de doses < 100 mg, não foram observados sinais ou sintomas significantes. Não existe antídoto específico para a ebastina. Em caso de superdosagem, deve-se realizar lavagem gástrica, monitorização das funções vitais incluindo eletrocardiograma, e tratamento dos sintomas observados.

**ATENÇÃO: ESTE PRODUTO É UM NOVO MEDICAMENTO E EMBORA AS PESQUISAS REALIZADAS TENHAM INDICADO EFICÁCIA E SEGURANÇA QUANDO CORRETAMENTE INDICADO, PODEM OCORRER REAÇÕES ADVERSAS IMPREVISÍVEIS AINDA NÃO DESCRITAS OU CONHECIDAS. EM CASO DE SUSPEITA DE REAÇÃO ADVERSA, O MÉDICO RESPONSÁVEL DEVE SER NOTIFICADO.**

**VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA.**

N.º de lote, data de fabricação e prazo de validade: VIDE CARTUCHO.

Para sua segurança, mantenha esta embalagem até o uso total do medicamento.

MS - 1.0043.0760