

Erostin

Tablet 10 mg / 20 mg
Suspension 5 mg / 5 ml
ANTI-HISTAMINE

COMPOSITION:

Each tablet contains : Ebastine..... BP 10 mg / BP 20 mg
Each 5 ml suspension contains : Ebastine BP..... 5 mg

PHARMACODYNAMIC PROPERTIES :

In vitro and in vivo data demonstrate that Ebastine is a potent, long-lasting and highly selective histamine H₁-receptor antagonist devoid of untoward CNS actions and anticholinergic effects.

Clinical : Histamine skin wheal studies have shown a statistically and clinically significant anti-histamine effect beginning at 1 hour and lasting in excess of 48 hours. After the discontinuation of the administration of a 5 day-course treatment with Ebastine, the antihistamine activity remained apparent for more than 72 hours. This activity parallels the plasma levels of the main active acid metabolite, carebastine.

After repeated administration, inhibition of the peripheral receptors remained at a constant level, without tachyphylaxis. These results suggest that Ebastine at a dose of at least 10 mg produces a rapid, intense and long-lasting inhibition of peripheral H₁ histamine receptors, consistent with a once-a-day administration.

Sedation was studied through pharmaco-EEG, cognitive performance, visual-motor coordination tests and subjective estimates. There was no significant increase of sedation at the recommended dose. These results are consistent with those from double blind clinical trials. The incidence of sedation is comparable between placebo and Ebastine.

PHARMACOKINETIC PROPERTIES:

Ebastine is rapidly absorbed and undergoes extensive first pass metabolism following oral administration. Ebastine is almost totally converted to the pharmacologically active acid metabolite, carebastine.

After a single 10 mg oral dose, peak plasma levels of the metabolite occur at 2.6 to 4 hours and achieve levels of 80 to 100 ng/ml. The half-life of the acid metabolite is between 15 and 19 hours with 66% of the drug being excreted in the urine mainly as conjugated metabolites. Following the repeated administration of 10 mg once-daily, steady state was achieved in 3 to 5 days with peak plasma levels ranging from 130 to 160 ng/ml. Both ebastine and carebastine are highly protein bound, 95%. In elderly subjects, no statistically significant changes were observed in the pharmacokinetics compared to those of young adult volunteers. In patients with renal insufficiency the elimination half-life of carebastine was increased to 23-26 hours. Similarly, in patients with hepatic insufficiency, the half-life is increased to 27 hours.

INDICATIONS:

Ebastine is indicated for the treatment of seasonal/ perennial allergic rhinitis and chronic urticaria.

CONTRA-INDICATIONS:

Patients with a known hypersensitivity to Ebastine or any of the tablet ingredients. Patients with severe liver insufficiency.

UNDESIRABLE EFFECTS:

In clinical trials, the most commonly reported side effects with Ebastine were headache, dry mouth and drowsiness, which were comparable to placebo.

Other less commonly reported adverse events include: pharyngitis, abdominal pain, dyspepsia, asthenia, epistaxis, rhinitis, sinusitis, nausea and insomnia.

WARNINGS AND PRECAUTIONS FOR USE:

Caution must be exercised when using Ebastine in patients known to be at cardiac risk such as those with long QT syndrome, hypokalemia, treatment with any drug known to produce an increase in QT interval or inhibit CYP3A4 enzyme systems such as azole antifungals and macrolide antibiotics.

INTERACTION WITH OTHER MEDICINAL PRODUCTS AND OTHER FORMS OF INTERACTION:

The interaction of Ebastine in combination with either ketoconazole or erythromycin (both known to prolong the QTc interval) has been evaluated. Interaction has been observed with these combinations, resulting in higher ebastine plasma levels but only in about a 10 msec increase in QTc greater than the increase seen with ketoconazole or erythromycin alone.

When Ebastine is administered with food, there is a 1.5 to 2.0-fold increase in the plasma levels and the AUC of the main active acid metabolite of ebastine. This increase does not alter the T_{max}. The administration of Ebastine with food does not cause a modification in its clinical effect.

USE DURING PREGNANCY AND LACTATION:

The safety of ebastine during human pregnancy has not been established. Studies in rats and rabbits do not indicate any direct or indirect harmful effects with respect to the development of the embryo or fetus, or the course of gestation and peri- and post-natal development. No teratogenic effects have been identified in animals. However, there are no well-controlled studies in pregnant women and reproductive studies are not always predictive of human response. Therefore, Ebastine should be used during pregnancy only if clearly needed. It is not known whether Ebastine is excreted in human milk, therefore, Ebastine should not be used during lactation.

DOSAGE AND ADMINISTRATION:

Tablet: Allergic rhinitis

Ebastine at a dose of 10 mg once a day is efficacious in the relief of the symptoms of allergic rhinitis; in patients with more severe symptoms including perennial allergic rhinitis, 20 mg once a day provides additional benefit.

Idiopathic chronic urticaria

The adult dose is 10 mg tablet once daily.

Special populations

A dosage of 10 mg daily should not be exceeded in patients with mild to moderate hepatic insufficiency. Ebastine 10 mg tablets are reserved for adults and children over 12 years of age.

Suspension: Children 6-12 years of age: 5 ml once daily. For more severe symptoms, 10 ml once daily provides additional benefit or as prescribed by the physician.

Children from 2 to 5 years old: One 2.5 ml dose (equivalent to Ebastine 2.5 mg) once daily.

OVERDOSE:

In studies conducted at a high dosage; no clinically meaningful signs or symptoms were observed up to 100 mg given once daily. There is no specific antidote for Ebastine. Gastric lavage, monitoring of vital functions including ECG and symptomatic treatment should be carried out.

STORAGE CONDITIONS:


Store below 30°C. Protect from light.

Keep out from the reach of the children.

DATE OF PUBLICATION:

August 2017

Manufactured by :

 **MICRO LABS LIMITED**
INDIA.

KNMLLa-026/A

at **KNM PHARMA PVT. LTD.**

No 13 , Mahagujrat Industrial Estate,
Opp. Nova Petrochem, Sanand Bavla Road,
Changodar, Dist: Ahmedabad Gujarat, India.

Erostin

Comprimés 10 mg / 20 mg

Suspension 5 mg / 5 ml

ANTI-HISTAMINIQUE

COMPOSITION:

Chaque comprimé contient: Ebastine BP 10 mg / 20 mg
Chaque 5 ml de suspension contient: Ebastine BP..... 5 mg

PHARMACOLOGIE:

Pharmacodynamie : L'ébastine est un antihistaminique de seconde génération qui se métabolise en un métabolite actif, la carebastine. Ses effets antihistaminiques et antiallergiques ont été démontrés in vivo et in vitro. L'ébastine est un antagoniste des récepteurs histaminergiques H1 dénué d'effets secondaires sédatifs et anticholinergiques aux doses préconisées, qui se lie préférentiellement aux récepteurs périphériques H1 in vivo. L'ébastine a mis en évidence une activité antihistaminique et antiallergique chez des volontaires et chez des patients allergiques. L'ébastine a également mis en évidence une protection contre l'histamine ayant provoqué une bronchoconstriction chez les patients asthmatiques. Il a été noté une amélioration significative des symptômes chez les patients souffrant de rhinite allergique perannuelle et d'urticaire idiopathique chronique.

La plupart des antagonistes H1 ne s'accumulent pas dans les tissus après des administrations répétées et ont une action résiduelle pendant un peu moins de 3 jours.

Il n'a pas été noté d'effets de tachyphylaxie ou de perte de l'activité antagoniste H1 pendant une utilisation régulière avec l'ébastine.

Pharmacocinétique : L'ébastine est bien absorbée et intensément distribué dans tous les tissus de l'organisme. Se lie aux protéines plasmatiques. L'ébastine est intensément et rapidement métabolisée en carebastine, son métabolite actif. La demi-vie de l'ébastine est d'environ 15 heures et sa durée d'action est de 24 heures.

INDICATIONS:

- rhinites allergiques
- urticaire idiopathique chronique
- rhinites allergiques saisonnières et perannuelles

CONTRE-INDICATIONS:

- Antécédents d'hypersensibilité à l'ébastine ou à l'un des excipients.
- Patients avec insuffisance hépatique sévère.

EFFETS SECONDAIRES :

La fréquence des effets secondaires les plus fréquemment reportés (sommolence, maux de tête et sécheresse de la bouche) est comparable à celle observée sous placebo. Certains effets secondaires cardiaques observés avec les autres anti-H1 n'ont pas été reportés avec l'ébastine. Pas de syndrome de QT long observé chez les patients sous traitement avec l'ébastine.

PRECAUTIONS ET MISES EN GARDE :

Une modification de la posologie peut être nécessaire chez les patients âgés ainsi que chez les insuffisants hépatiques et rénaux. La prescription d'ébastine doit être prudente chez les patients présentant un syndrome du QT long, ayant une hypokaliémie, ou recevant un médicament connu pour allonger l'intervalle QT ou pour inhiber le CYP3A4, tels que les antifongiques azolés et les macrolides.

Les effets de somnolence avec l'ébastine pouvant survenir ne relèvent que du fait de la sensibilité individuelle (poids du patient, réponse individuelle, réduction de la clairance, interactions). Personnes conduisant les véhicules et utilisant les machines.

PROPRIETES PHARMACOLOGIQUES:

Antiallergique

INTERACTIONS MEDICAMENTEUSES :

Kétoconazole, itraconazole, érythromycine, clarithromycine, Josamycine : risque majoré de survenue de troubles du rythme ventriculaire chez les sujets prédisposés (syndrome du QT long congénital).

Alcool à fortes doses : dépression cardiaque et respiratoire.

GROSSESSE ET ALLAITEMENT:

Grossesse : Les études sur les fonctions de reproduction réalisées chez l'animal n'ont révélé aucun effet nocif.

Chez la femme enceinte, le retentissement de la prise de ce médicament en cours de grossesse n'est pas connu, l'absence d'étude épidémiologique rétrospective interdisant toute conclusion. En conséquence, l'administration d'ébastine chez la femme enceinte est déconseillée.

Allaitement : Le passage de l'ébastine et de ces métabolites dans le lait maternel n'a pas été étudié. Son administration durant l'allaitement est déconseillée.

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

Aux doses thérapeutiques, l'ébastine n'affecte pas l'aptitude à conduire des véhicules ou à opérer sur des machines. Les effets cardiaques de l'ébastine ont été également étudiés de façon approfondie et aucun effet significatif n'a été observé à des doses de l'ordre de 100 mg, (soit 5 fois la dose quotidienne).

POSOLOGIE ET MODE D'ADMINISTRATION :

Comprimés:

Réservé aux patients au dessus de 12 ans

Prurit : 10 mg par jour

Prurit sévère : 20 mg par jour à administrer au début du traitement et réduire à 10 mg par jour en cas d'amélioration.

Urticaire idiopathique chronique : 10 mg par jour

Rhinites allergiques saisonnières et perannuelles :

10-20 mg par jour

Populations particulières:

En cas d'insuffisance hépatique modérée, ne pas excéder la dose de 10 mg par jour.

Suspension:

Enfants entre 6 et 12 ans :

1 cuillère à café correspondant à 5 ml en une prise par jour.

En cas de sévérité de l'allergie, une dose 10 ml en une prise (2 cuillères à café de 5 ml) procure un bénéfice additionnel.

Enfants de 2 à 5 ans : une dose de 2.5ml (équivalent à 2.5mg d'Ebastine) une fois par jour.

SURDOSAGE :

Aux doses supérieures à la dose recommandée, un effet sédatif et atropinique peut apparaître.

- Conduite à tenir en cas de surdosage massif :

- aucun antidote n'est connu à ce jour,

- lavage gastrique,

- traitement symptomatique, surveillance des fonctions vitales incluant une surveillance ECG

CONSERVATION :

Conserver à une température en dessous de 30°C.

A l'abri de la lumière. Tenir hors de la portée des enfants.

DATE DE PUBLICATION :

Août 2017

Fabriqué par :

 **MICRO LABS LIMITED**
INDIA.

KNMLLa-026/A

at KNM PHARMA PVT. LTD.

No 13 , Mahagujrat Industrial Estate,
Opp. Nova Petrochem, Sanand Bavla Road,
Changodar, Dist: Ahmedabad Gujarat, India.