

Ebastin Apofri

EF

Apofri

Munsönderfallande tablett 10 mg

(Vita till benvita, runda munsönderfallande tabletter med fasade kanter och en diameter på ungefär 8,5 mm och en tjocklek på 2,2 mm samt märkta "10" på den ena sidan.

Mintsmak.)

Antihistamin H1-antagonist

Aktiv substans:

Ebastin

ATC-kod:

R06AX22

Läkemedel från Apofri omfattas av Läkemedelsförsäkringen.

FASS-text: *Denna text är avsedd för vårdpersonal.*

Texten är baserad på produktresumé: 2019-06-10

Indikationer

Allergisk rinit och allergisk konjunktivit. Urtikaria och histamininducerad klåda, exempelvis myggbett.

Kontraindikationer

Överkänslighet mot den aktiva substansen eller mot något hjälpämne som anges i avsnittet Innehåll.

Dosering

Vuxna och barn över 12 år: 1 munsönderfallande tablett à 10 mg en gång dagligen i samband med frukost.

Vid svårare symtom kan dosen ökas till 20 mg dagligen (2 munsönderfallande tabletter à 10 mg).

Erfarenhet av långtidsanvändning är begränsad.

Särskilda patientgrupper:

Hos patienter med lätt, måttligt eller kraftigt nedsatt njurfunktion eller lätt till måttligt nedsatt leverfunktion är det inte nödvändigt att justera dosen. Det finns ingen erfarenhet med doser över 10 mg till patienter med kraftigt nedsatt leverfunktion, varför dosen till dessa patienter inte bör överstiga 10 mg dagligen. Behandlingen kan förlängas tills symtomen försvinner.

Administreringsätt

Den munsönderfallande tablettens placeras på tungan, där den omedelbart löses upp. Vatten eller annan vätska behöver inte användas. Den munsönderfallande tablettens ska med torra händer försiktigt tas ut ur blistret, detta för att den inte ska krossas. Tablettens ska sedan intas så snart som möjligt.

Varningar och försiktighet

Långtidsbehandling med Ebastin Apofri kan leda till ökad kariesrisk hos vissa patienter som följd av muntorrhet. Patienterna bör därför instrueras om vikten av noggrann munhygien.

Försiktighet bör iakttas vid användning av ebastin till patienter som även behandlas med antimykotika av imidazoltyp t ex ketokonazol och itrakonazol eller makrolidantibiotika som erytromycin och läkemedel mot tuberkulos som rifampicin då dessa interagerar farmakokinetiskt (se avsnitt Interaktioner).

Ebastin bör användas med försiktighet till patienter med kraftigt nedsatt leverfunktion (se avsnitt Dosering).

Interaktioner

En farmakokinetisk interaktion av ebastin i kombination med ketokonazol, itrakonazol eller erytromycin har observerats. Dessa interaktioner resulterade i en förhöjd plasmakoncentration av ebastin och en minskad andel av karebastin som dock inte gav någon kliniskt signifikant farmakodynamisk konsekvens.

Farmakokinetiska interaktioner har observerats när ebastin ges tillsammans med rifampicin. Dessa interaktioner kan resultera i lägre plasmakoncentrationer och minskad antihistamineffekt.

Inga interaktioner har rapporterats mellan ebastin och teofyllin, warfarin, cimetidin, diazepam och alkohol.

Administrering av ebastin tillsammans med mat påverkar inte den kliniska effekten.

Graviditet

Kategori B:1.

Graviditet: Det finns begränsad mängd data från användning av ebastin hos gravida kvinnor. Djurstudier tyder inte på direkta eller indirekta skadliga effekter avseende reproduktionstoxicitet. Som en försiktighetsåtgärd bör ebastin inte användas under graviditet.

Amning

Grupp IVa.

Amning: Det är inte känt om ebastin utsöndras i modersmjölk. Ebastin och dess huvudmetabolit, karebastin, har hög proteinbindning (> 97%) vilket tyder på att de inte utsöndras i bröstmjölk. Som en försiktighetsåtgärd bör ebastin inte användas under amning.

Fertilitet

Fertilitet: Det finns inga fertilitetsdata på ebastin i människa.

Trafik

Hos människa har psykomotorisk funktion studerats utförligt och ingen effekt hittades. Vid rekommenderade terapeutiska doser påverkar inte ebastin förmågan att framföra fordon eller använda maskiner. För känsliga personer som reagerar ovanligt på ebastin är det dock rekommenderat att känna till individuella reaktioner innan en patient kör eller utför komplicerade aktiviteter: sömnhet eller yrsel kan inträffa (se avsnitt Biverkningar).

Biverkningar

I en poolad analys av placebokontrollerade kliniska prövningar med 5 708 patienter som fick ebastin var de vanligast rapporterade biverkningarna muntorrhet och somnolens.

Biverkningar som rapporterats i kliniska prövningar på barn (n = 460) var liknande de som observerats hos vuxna.

Tabellen nedan listar biverkningar rapporterade från kliniska prövningar och efter godkännandet enligt följande konvention: mycket vanliga ($\geq 1/10$), vanliga ($\geq 1/100$, $< 1/10$), mindre vanliga ($\geq 1/1\ 000$, $< 1/100$), sällsynta ($\geq 1/10\ 000$, $< 1/1\ 000$) och mycket sällsynta ($< 1/10\ 000$), ingen känd frekvens (kan inte beräknas från tillgängliga data).

Klassificering av organsystem	Mycket vanliga	Vanliga	Sällsynta	Ingen känd frekvens
Immunsystemet			överkänslighetsreaktioner (som anafylaxi och angioödem)	
Metabolism och nutrition				Ökad aptit
Psykiska störningar			nervositet, sömnlöshet	
Centrala och perifera nervsystemet	huvudvärk	somnolens	yrsel, hypestesi, smakförändringar	
Hjärtat			hjärtklappning, takykardi	
Magtarmkanalen		muntorrhet	buksmärta, kräkningar, illamående, dyspepsi	
Lever och gallvägar			hepatit, kolestas, onormala leverfunktionsvärden (förhöjda transaminaser, gamma-GT, alkaliska fosfataser och bilirubin)	
Hud och subkutan vävnad			urtikaria, utslag, dermatit	
Reproduktionsorgan och bröstkörtel			menstruationsrubbnningar	
Allmänna symtom och/eller symtom vid			ödem, asteni	

administreringsställe				
Undersökningar				Viktökning

Rapportering av misstänkta biverkningar

Det är viktigt att rapportera misstänkta biverkningar efter att läkemedlet godkänts. Det gör det möjligt att kontinuerligt övervaka läkemedlets nytta-riskförhållande. Hälso- och sjukvårdspersonal uppmanas att rapportera varje misstänkt biverkning till Läkemedelsverket, www.lakemedelsverket.se. Postadress

Läkemedelsverket
Box 26
751 03 Uppsala

Överdoser

Toxicitet

30 mg till 2-åring gav efter koltillförelse ej några symtom. 400 mg till 18-åring gav lindrig intoxikation, 600 mg till 14-åring samt 900 mg till vuxen gav lindrig till måttlig intoxikation.

Symtom

Vid studier gjorda med höga doser, observerades inga kliniskt relevanta tecken eller symtom upp till 100 mg givet en gång dagligen. Trötthet, torr mun och ackommodationsstörningar observerades vid doser på 300-500 mg. Eventuell kardiovaskulär påverkan vid höga doser.

Behandling

Då det inte finns någon specifik antidot för ebastin, bör en överdosering behandlas symtomatiskt. Magsköljning och monitorering av vitala funktioner inkluderande EKG bör pågå till fullständig återhämtning och i minst 48 timmar.

Farmakodynamik

Den aktiva substansen i Ebastin Apofri, ebastin, är en H_1 -antagonist utan antikolinerga effekter. Den hämmande effekten på histaminutlösta kvaddlar kan förväntas efter 1 timme och är maximal efter ca 6-8 timmar. Effekten kvarstår mer än 24 timmar. Vid klåda orsakad av myggbett får man bästa effekt om Ebastin Apofri tas innan personen blivit myggbiten. I en liten klinisk studie på speciellt myggekänsliga individer har ebastin visat en begränsad effekt på förmåga att minska myggbettets storlek, men god effekt mot klåda 15 minuter till 2 timmar efter myggbettet. Ebastin hade ingen effekt på den senare fasen av klåda efter myggbett.

Ebastin har i kliniska prövningar ej givit upphov till sedering och potentierar ej effekten av alkohol eller diazepam.

Ebastin har inte visat sig ha någon påverkan på QT-tiden vid rekommenderade doser. Vid upprepad dosering upp till 100 mg per dag eller 500 mg som en engångsdos sågs en liten ökning i hjärtfrekvens med några få slag per minut som resulterade i en förkortning av QT-tiden, dock utan någon signifikant effekt på den korrigerade QT-tiden (QTc).

Farmakokinetik

Ebastin absorberas snabbt och omvandlas genom första-passage-metabolism, huvudsakligen via CYP3A4 systemet, till den aktiva metaboliten karebastin. Efter en oral singeldos om 10 mg ebastin erhålls maximala plasmakoncentrationer av karebastin på 80-100 ng/ml efter 4-6 timmar. Efter upprepad dosering av 10 mg ebastin en gång dagligen, uppnås steady state-nivåer av karebastin inom 3-5 dagar med maximala plasmanivåer mellan 130 och 160 ng/ml. Karebastin elimineras i huvudsak i metaboliserad form. Halveringstiden är 14 ± 2 timmar, clearance $1,8 \pm 0,3$ l/h och distributionsvolymen för karebastin vid steady state är 33 ± 6 l.

Efter en oral dos ebastin utsöndras mindre än 1% i urinen som karebastin. Mer än 70% av dosen utsöndras i urinen som konjugerade metaboliter.

Både ebastin och karebastin är höggradigt proteinbundna, > 97%.

När Ebastin Apofri filmdragerad tablett tas samtidigt med föda ses en dubbling av C_{max} samt en 50%-ig ökning av AUC för karebastin. T_{max} förändras ej av födointag. Hur födointag påverkar farmakokinetiken för Ebastin Apofri munsönderfallande tablett har inte studerats.

Hos patienter med mild, måttlig eller svår njurinsufficiens som behandlats med dagliga doser av 20 mg ebastin, likväl hos patienter med mild till måttlig leverinsufficiens som behandlats med 20 mg ebastin, eller hos patienter med svår leverinsufficiens behandlade med 10 mg ebastin, var de uppnådda plasmakoncentrationerna av ebastin och karebastin på första och femte behandlingsdagen liknande dem som uppnåtts hos friska frivilliga.

Prekliniska uppgifter

Det finns inga prekliniska data av relevans för säkerhetsbedömningen utöver vad som redan beaktas i produktresumén.

Innehåll

En munsönderfallande tablett innehåller 10 mg respektive 20 mg ebastin.

Övriga innehållsämnen: Hypromellos (E464), povidon (E1201), poloxamer, gelatin, karmelloskalcium, krospovidon, mannitol (E421), mikrokristallin cellulosa (E460), karmellosnatrium (E468), kiseldioxid (E551), trusil pepparmint special*, neotam (E961), magnesiumstearat (E470)

*komposition: naturliga smakämnen, gummi arabicum (E414), maltodextrin, natriumbensoat (E211) och butylhydroxianisol (E320)

Blandbarhet

Ej relevant.

Hållbarhet, förvaring och hantering

3 år.

Förvaras i originalförpackningen. Ljuskänsligt.

Egenskaper hos läkemedelsformen

Vita till benvita, runda munsönderfallande tabletter med fasade kanter och en diameter på ungefär 8,5 mm och en tjocklek på 2,2 mm samt märkta "10" på den ena sidan.

Förpackningsinformation

Munsönderfallande tablett 10 mg Vita till benvita, runda munsönderfallande tabletter med fasade kanter och en diameter på ungefär 8,5 mm och en tjocklek på 2,2 mm samt märkta "10" på den ena sidan. Mintsmaak.

30 tablett(er) blister, receptfri (fri prissättning), EF, Övriga förskrivare: sjuksköterska