

**NOVEDADES 2005 EN ANTIHISTAMÍNICOS**  
**Ebastina Flas: nueva presentación galénica**  
**bioequivalente**

---

Dr José M<sup>a</sup> Negro Alvarez  
H.U. "Virgen de la Arrixaca". Murcia (España).  
Profesor Asociado de Alergología. Facultad de Medicina.  
Universidad de Murcia. España

• Febrero 2005

[www.alergomurcia.com](http://www.alergomurcia.com)

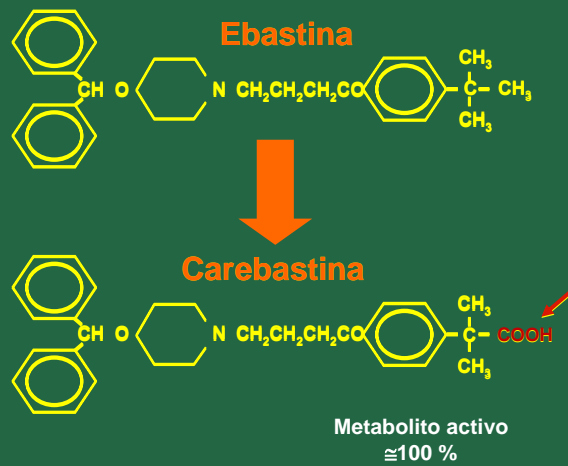
**EBASTINA FLAS**

---

**Primer Antihistamínicos del mercado**  
**con formas galénicas Flas de**  
**presentación:**

- Ebastel<sup>®</sup> Flas
- Ebastel<sup>®</sup> Forte Flas

## Molécula



## Ebastina - Farmacocinética

- Absorción: 85%
- Rápida conversión a su metabolito activo (CAREBASTINA)
- Tan sólo 4 horas después de la administración del fármaco se logra la  $C_{max}$  Carebastina
- Tiempo de vida media: 15-19 horas
- No se altera en dosis repetidas – no efecto acumulativo

## Ebastina - Interacciones

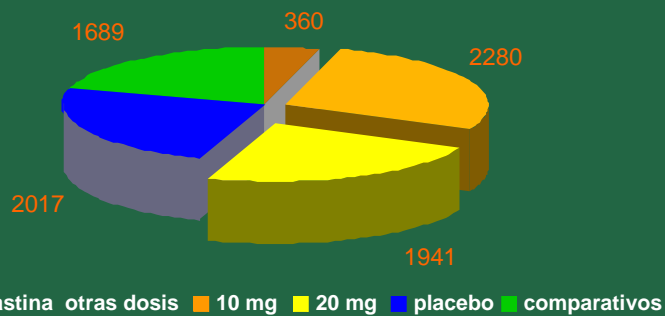
- No interacción con:
  - Teofilina
  - Warfarina
  - Cimetidina
  - Diazepam
  - Alcohol
- Interacción con la alimentación sin relevancia clínica
- Interacción con ketoconazol y eritromicina

## Ebastina - Indicaciones

- Rinitis alérgica (intermitente / persistente)
- Urticaria crónica idiopática
- Dermatitis atópica
- Otras aplicaciones:
  - Picadura de mosquito

## Ebastina – Estudios de eficacia

- 30 estudios en Rinitis Alérgica Estacional (RAE):  
25 en adultos / 5 en niños
- 12 ensayos en Rinitis Alérgica Perenne (RAP):
- 6 ensayos en Urticaria Crónica



## Ebastina en RAE:

### ■ Conclusiones

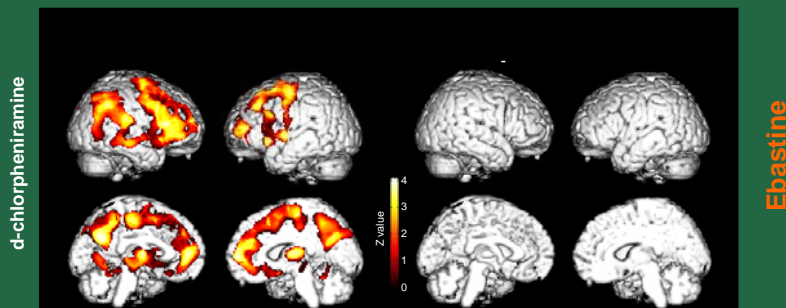
- Ebastina 10mg, ebastina 20mg y loratadina 10mg, administradas 1 vez al día, han demostrado ser efectivas.
- Ebastina 10mg es al menos tan efectiva como loratadina y cetirizina.
- Mientras que **Ebastina 20 mg añade un plus de eficacia** y puede usarse en aquellos pacientes más severos.
- Todos los tratamientos son seguros.

## Ebastina: seguridad

- No efectos sedantes, ni alteración psicomotora
- No actividad anticolinérgica
- Seguridad cardíaca similar placebo
- Efectos adversos similares a placebo
- Excelente dossier de farmacovigilancia tras 15 años de práctica clínica y más de 1.500 millones de dosis diaria usadas

## Ausencia efectos psicomotricidad

***“Poca ocupación de los receptores a nivel cerebral”***



Statistically analysis comparing the parametric images of binding potential of doxepin between ebastine and *d*-chlorpheniramine treatments was conducted by SPM96 (statistical parametric mapping);  $p < 0.05$ , uncorrected paired *t*-test

M Tagawa. *C Bri J Clin Pharmacol*, 2001; 52: 501

Comparison of  $H_1$ -receptor occupancy of antihistamines (ebastine 10mg vs *d*-chlorpheniramine 2mg)

## Resumen de Ebastina

### ■ Principales Propiedades

- Antihistamínico Anti-H1 selectivo
- Altamente selectivo
- Acción de larga duración
- Efectiva en:
  - Rinitis alérgica estacional y perenne
  - Urticaria idiopática crónica
  - Dermatitis
- Bien tolerada: segura y sin efectos sedantes

## Formas Flas (Desintegración inmediata en la boca)

- Ebastel® Flas / Ebastel® Forte Flas son un liofilizado oral que se desintegran instantáneamente en la boca en contacto con la saliva
- Sus excipientes y sofisticado proceso de fabricación permiten obtener una estructura porosa de inmediata disolución en contacto con la saliva.



Visión microscópica de la estructura del liofilizado oral de Ebastel Forte Flas



Liofilizado oral de Ebastel Forte Flas

## Proceso de fabricación de Ebastel Flas



Mezcla de los componentes del liofilizado oral y el agua



Dosificación en los blísters del liofilizados



Proceso de congelación ultrarápida de los blísters

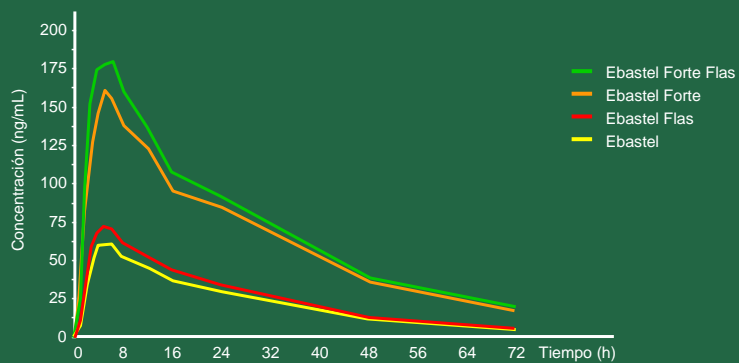


Sublimación: secado del agua congelada en los liofilizados. Obtención de la estructura porosa.

Fin de la fabricación con el sellado de los blísters, (total estanqueidad)

## Propiedades farmacocinéticas - Bioequivalencia

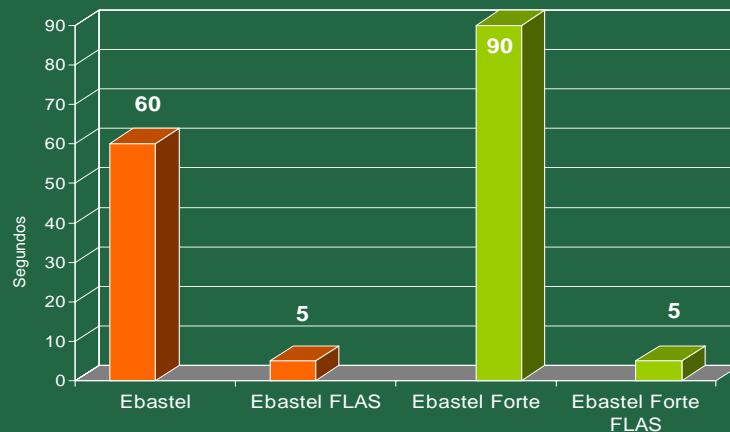
Concentración media en plasma de Carebastina  
Comprimidos vs Liofilizados oralres (Flas)



Salvá et al, 2004

## Ebastina comprimidos vs Flas: Test desintegración

Tiempo medio de desintegración de las diferentes galénicas de Ebastel



Salvá et al, 2004

## Preferencia de los pacientes por formas de rápida disolución (Flas)

**377** pacientes fueron reclutados en este estudio: **187** pacientes recibieron ranitidina efervescente y **190** recibieron famotidina de rápida disolución oral (Flas)

*“El objetivo de este estudio era medir la eficacia de 150 mg ranitidina comprimido efervescente comparado con 20 mg famotidina de rápida disolución oral en el tratamiento de pacientes que se presentan a la consulta de A. Primaria con síntomas de Enfermedad por Reflujo Gastroesofágico (ERGE). Un mayor nº de pacientes prefirieron la famotidina de rápida disolución oral que el comprimido efervescente de la ranitidina.”*

Ref: Engzelius JM et al. Scand J Gastroenterol 1997 Jun;32(6):513-8

## Preferencia de los pacientes por formas de rápida disolución (Flas)

**450** sujetos , **21- 83** años, 40 mg famotidina Liofilizada oral (Flas) vs 40 mg famotidina comprimidos

*“La preferencia por el liofilizado oral vs los comprimidos en el 75% de los pacientes analizados. Los resultados se confirmaron tanto en el grupo de pacientes más jóvenes (<60 años) como los de más edad (>60 años)”*

Ref: Schwartz et al. J Clin Pharmacol 1995; 35: 362-367

## Preferencia de los pacientes por formas de rápida disolución (Flas)

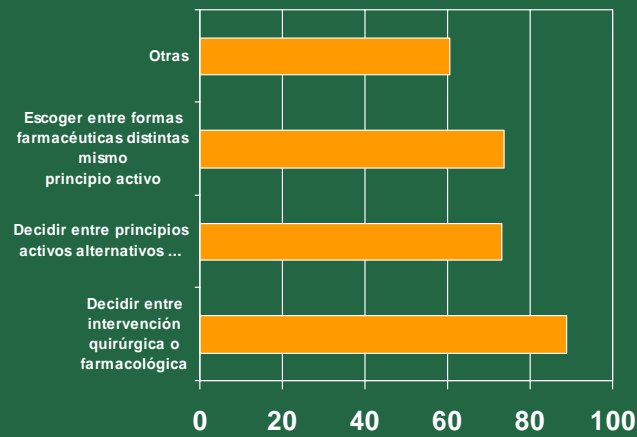
**74** pacientes, **18 - 50** años, admitidos para proceso ginecológicos menores. De forma randomizada de les administran 30mg de oxazepam de rápida disolución oral (Flas) vs comprimidos de placebo, en un estudio cruzado a doble ciego.

*“El Oxazepam de disolución rápida 30 mg provocó una mejor calidad del sueño que el placebo. Es importante destacar que la mayor parte de los pacientes analizados prefirieron la forma de disolución rápida (80,9%) que los comprimidos (9,1%) ( $p \leq 0,01$ )”*

Ref: WJ Brampton and OM Plaotevio J Int Med Res (1985) 13, 469

## Preferencia de los pacientes por formas de rápida disolución (Flas)

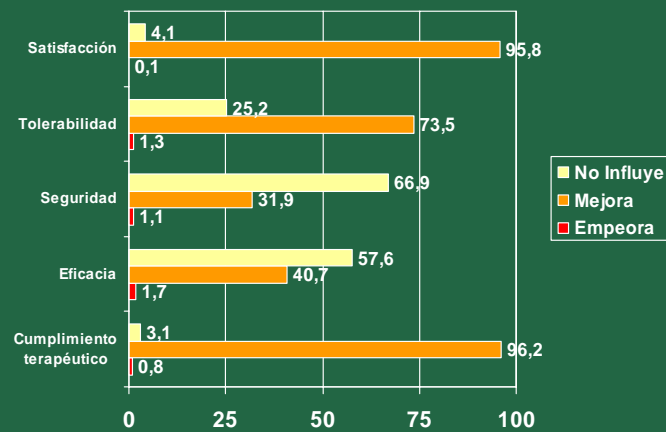
¿En qué tipo de decisiones médicas usted cree que debe ser tomada en cuenta la opinión o preferencia del paciente?



"Estudio sobre la influencia de la opinión y preferencia del paciente sobre la prescripción médica". Data on file

## Preferencia de los pacientes por formas de rápida disolución (Flas)

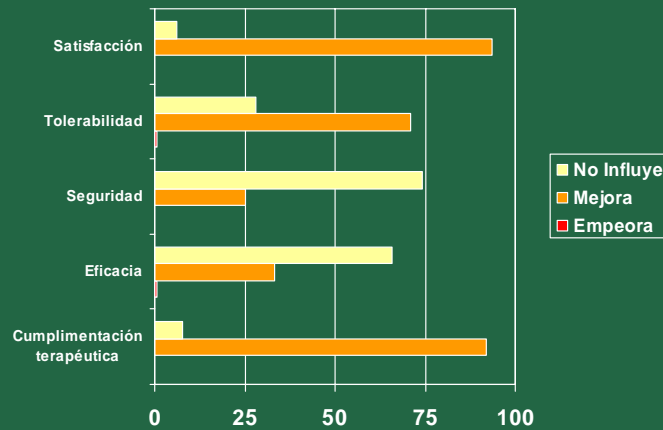
¿Cree que tener en cuenta las preferencias del paciente en la prescripción médica influye alguno de los siguientes aspectos?



"Estudio sobre la influencia de la opinión y preferencia del paciente sobre la prescripción médica". Data on file

## Preferencia de los pacientes por formas de rápida disolución (Flas)

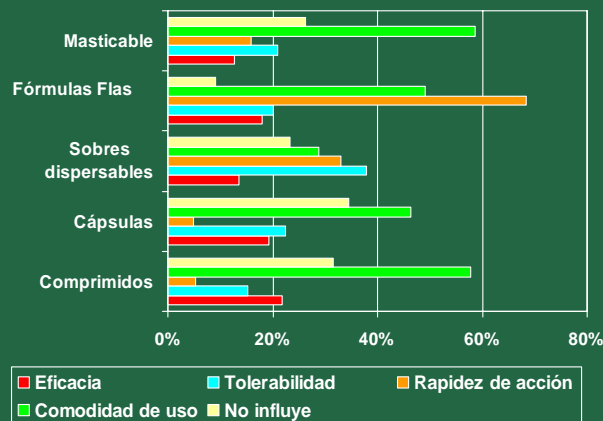
Ante formas farmacéuticas bioequivalentes ¿cree que tener en cuenta las preferencias del paciente en la elección de la forma farmacéutica influye alguno de los siguientes aspectos?



"Estudio sobre la influencia de la opinión y preferencia del paciente sobre la prescripción médica". Data on file

## Preferencia de los pacientes por formas de rápida disolución (Flas)

Ante distintas formas farmacéuticas orales de un mismo principio activo ¿Cómo valora los siguientes atributos?



"Estudio sobre la influencia de la opinión y preferencia del paciente sobre la prescripción médica". Data on file

## Preferencia de los pacientes por formas de rápida disolución (Flas)

### Conclusiones

- El 58% de los profesionales sanitarios afirman que siempre debe tenerse en cuenta las opiniones y preferencias del paciente y un 41% en determinadas ocasiones
- Los profesionales piensan que tener en cuenta las preferencias del paciente en las decisiones de prescripción mejora el cumplimiento terapéutico (96%), la satisfacción con el tratamiento (96%) y la tolerabilidad (73%).

"Estudio sobre la influencia de la opinión y preferencia del paciente sobre la prescripción médica". Data on file

### Conclusiones

- El médico asocia:
  - Las fórmulas flas con rapidez de acción y comodidad de uso
  - Las fórmulas masticables y comprimidos con comodidad de uso
  - Los sobres dispersables con tolerabilidad.

"Estudio sobre la influencia de la opinión y preferencia del paciente sobre la prescripción médica". Data on file

## Otras ventajas Ebastel Flas / Ebastel Forte Flas

- Desintegración **inmediata** en la boca (<5 seg.) → No problemas de deglución
- **Sin necesidad de agua** para deglución
- **Mayor comodidad para el paciente**, 1 dosis al día en cualquier lugar y momento. **Mejora del cumplimiento**
- Pacientes polimedificados
- Para pacientes con intolerancia a la lactosa – **ÚNICO ANTIHISTAMÍNICO SÓLIDO SIN LACTOSA**
- **Igual eficacia Ebastina comprimidos. - Igual seguridad Ebastel comprimidos**

## Ebastina Flas

### Instrucciones correcta manipulación

- **SEPARAR** la lámina superior de aluminio y sacar **CUIDADOSAMENTE** el liofilizado oral de Ebastel Forte Flas.
- **NO** intentar sacar el liofilizado rompiendo la lámina superior de aluminio ya que es frágil y se rompería dentro
- Colocar el liofilizado oral de Ebastel Forte Flas en la parte superior de la lengua. Desaparecerá muy rápidamente.

