

FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL

DESPEX JARABE 2,5 mg/5 mL

1. NOMBRE DEL MEDICAMENTO

DESPEX JARABE 2,5 mg/5 mL

2. COMPOSICIÓN CUALITATIVA Y CUANTITATIVA

Cada 5 mL de jarabe contiene:

Principio activo: Desloratadina 2,5 mg.*Excipientes:* ~~Glicerol, Propilenglicol, Sacarina sódica, Benzoato de sodio, Polividona, Sacarosa, Ácido cítrico, Esencia de cerezas, Esencia de plátanos, Agua purificada.~~ De acuerdo a la fórmula aprobada en el registro sanitario.

3. FORMA FARMACÉUTICA

Jarabe.

4. DATOS CLÍNICOS

4.1. Indicaciones terapéuticas

~~DESPEX JARABE 2,5 mg/5 mL está indicado para el alivio de los síntomas asociados con la rinitis alérgica, tales como estornudos, descarga y picazón nasales, congestión/mala ventilación, así como picazón, lagrimeo y enrojecimiento ocular, picazón del paladar y tos.~~~~DESPEX JARABE 2,5 mg/5 mL está también indicado para el alivio de los síntomas asociados con la urticaria idiopática crónica tales como alivio del prurito, y del tamaño y número de ronchas.~~DESPEX está indicado en adultos, adolescentes y niños a partir de 1 año de edad, para el alivio de los síntomas asociados con:

- rinitis alérgica
- urticaria

4.2. Posología y forma de administración

El médico debe tener en cuenta que la mayoría de los casos de rinitis en menores de 2 años de edad son de origen infeccioso y que no hay datos que apoyen el tratamiento de la rinitis infecciosa con DESPEX.

~~Niños de 6 a 11 años de edad: 5 mL (2,5 mg) de DESPEX jarabe una vez al día, con o sin alimentos, para el alivio de los síntomas asociados a la rinitis alérgica (incluyendo rinitis alérgica persistente e intermitente) y urticaria idiopática crónica.~~~~Niños de 1 a 5 años de edad: 2,5 mL (1,25 mg) de DESPEX jarabe una vez al día, con o sin alimentos, para el alivio de los síntomas asociados a rinitis alérgica (incluyendo rinitis alérgica persistente e intermitente) y urticaria idiopática crónica.~~~~Niños de 6 meses a 11 meses de edad: 2 mL (1 mg) de DESPEX jarabe una vez al día, con o sin alimentos, para el alivio de los síntomas asociados a urticaria idiopática crónica.~~~~Adultos y adolescentes (12 años de edad y mayores): 10 mL (5 mg) de DESPEX jarabe una vez al día, con o sin alimento, para el alivio de los síntomas asociados a rinitis alérgica (incluyendo rinitis alérgica persistente e intermitente) y urticaria idiopática crónica.~~~~La rinitis alérgica intermitente, (presencia de síntomas por menos de 4 días por semana o durante menos de 4 semanas) debe manejarse de acuerdo a la evaluación de la historia clínica del paciente y el tratamiento~~INSTITUTO DE SALUD PÚBLICA DE CHILE
AGENCIA NACIONAL DE MEDICAMENTOS
SECCIÓN PRODUCTOS NUEVOS

10 DIC 2018

N° Ref.: MT1045043/18
N° Registro: F-15110/15
Firma Profesional: _____FOLLETO DE INFORMACIÓN
AL PROFESIONAL

FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL**DESPEX JARABE 2,5 mg/5 mL**

~~debe suspenderse después de que los síntomas hayan desaparecido y reiniciarse si estos reaparecen. En aquellos pacientes con rinitis alérgica persistente (presencia de síntomas por más de 4 días o más por semana, o por más de 4 semanas) se puede proponer a los pacientes el tratamiento continuado durante los periodos de exposición al alérgeno.~~

Posología**Adultos y adolescentes (12 años de edad y mayores):****La dosis recomendada de DESPEX es 10 mL (5 mg) de jarabe una vez al día.****Población pediátrica:****El médico debe tener en cuenta que la mayoría de los casos de rinitis en menores de 2 años de edad son de origen infeccioso (ver sección 4.4.) y que no hay datos que apoyen el tratamiento de la rinitis infecciosa con DESPEX.****Niños de 1 a 5 años de edad: 2,5 mL (1,25 mg) de DESPEX jarabe una vez al día.****Niños de 6 a 11 años de edad: 5 mL (2,5 mg) de DESPEX jarabe una vez al día.****No se ha establecido la seguridad y eficacia de DESPEX jarabe en niños menores de 1 año de edad. No se dispone de datos.****Hay limitada eficacia de los ensayos clínicos con el uso de desloratadina en niños de 1 a 11 años de edad y adolescentes de 12 a 17 años de edad (ver secciones 4.8 y 5.1).****La rinitis alérgica intermitente, (presencia de síntomas por menos de 4 días por semana o durante menos de 4 semanas) debe manejarse de acuerdo a la evaluación de la historia clínica del paciente y el tratamiento debe suspenderse después de que los síntomas hayan desaparecido y reiniciarse si estos reaparecen. En aquellos pacientes con rinitis alérgica persistente (presencia de síntomas por más de 4 días o más por semana, o por más de 4 semanas) se puede proponer a los pacientes el tratamiento continuado durante los periodos de exposición al alérgeno.****Forma de administración:****Vía oral.****La dosis puede tomarse con o sin alimentos.****4.3. Contraindicaciones**

Hipersensibilidad al principio activo o a alguno de los excipientes incluidos en la sección 2 o a loratadina.

4.4. Advertencias y precauciones especiales de empleo**Desloratadina se debe administrar con precaución en pacientes con antecedentes personales o familiares de crisis convulsivas y, principalmente en niños pequeños, que son más susceptibles de desarrollar nuevas crisis cuando están en tratamiento con desloratadina. Los profesionales sanitarios pueden considerar la suspensión de desloratadina en pacientes que experimenten una crisis durante el tratamiento.**

~~La eficacia e inocuidad de DESPEX jarabe no han sido establecidas en niños menores de 6 meses.~~

Población pediátrica

En niños menores de 2 años de edad, el diagnóstico de la rinitis alérgica es especialmente difícil de distinguir de otras formas de rinitis. Deben considerarse la ausencia de infección del tracto respiratorio superior o de anomalías estructurales, así como la historia del paciente. Exámenes físicos y pruebas de laboratorio y cutáneas adecuadas.

FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL**DESPEX JARABE 2,5 mg/5 mL**

Aproximadamente el 6% de los adultos y niños entre 2 y 11 años de edad son fenotípicamente metabolizadores lentos de desloratadina y muestran una exposición más alta (ver sección 5.2). La seguridad de desloratadina en niños de 2 a 11 años de edad que son metabolizadores lentos es la misma que en niños que son metabolizadores normales. Los efectos de desloratadina en metabolizadores lentos < 2 años de edad no han sido estudiados.

En caso de insuficiencia renal severa, DESPEX deberá utilizarse con precaución (ver sección 5.2).

Este medicamento contiene 2.5 g de sacarosa por 5 mL, lo que deberá tenerse en cuenta en el tratamiento de pacientes con intolerancia hereditaria a la fructosa, malabsorción de glucosa o galactosa, o insuficiencia de sacarasa-isomaltasa y en pacientes con diabetes mellitus.

4.5. Interacción con otros medicamentos y otras formas de interacción

No se han observado interacciones clínicamente relevantes en ensayos clínicos con desloratadina comprimidos en los que se administraron conjuntamente eritromicina o ketoconazol (ver sección 5.1).

Población pediátrica

Solo se han realizado estudios de interacciones en adultos.

En un ensayo de farmacología clínica, desloratadina comprimidos tomado de forma concomitante con alcohol no potenció los efectos deteriorantes del alcohol sobre el comportamiento (ver sección 5.1). **Sin embargo, se han notificado casos de intolerancia al alcohol e intoxicación durante el uso después de la comercialización. No se recomienda consumir bebidas alcohólicas al usar DESPEX.**

4.6. Fertilidad, embarazo y lactancia**Embarazo**

~~No hay datos o éstos son limitados (datos en menos de 300 embarazos) relativos al uso de desloratadina en mujeres embarazadas. Los estudios en animales no sugieren efectos perjudiciales directos ni indirectos en términos de toxicidad para la reproducción (ver sección 5.3). Como medida de precaución, es preferible evitar el uso de DESPEX durante el embarazo.~~

La gran cantidad de datos en mujeres embarazadas (datos en más de 1.000 embarazos) indican que desloratadina no produce malformaciones ni toxicidad fetal/neonatal. Los estudios en animales no sugieren efectos perjudiciales directos ni indirectos en términos de toxicidad para la reproducción (ver sección 5.3). Como medida de precaución, es preferible evitar el uso de desloratadina durante el embarazo.

Lactancia

Se ha detectado desloratadina en recién nacidos lactantes de madres tratadas. Se desconoce el efecto de desloratadina en recién nacidos/niños. Se debe decidir si es necesario interrumpir la lactancia o interrumpir el tratamiento con DESPEX tras considerar el beneficio de la lactancia para el niño y el beneficio del tratamiento para la madre.

Fertilidad

No hay datos disponibles sobre la fertilidad masculina y femenina.

4.7. Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

La influencia de desloratadina sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas es nula o insignificante en base a los ensayos clínicos. Se debe informar a los pacientes de que la mayoría de las personas no experimentan somnolencia. Sin embargo, como existe variabilidad individual en la respuesta a todos los medicamentos, se recomienda aconsejar a los pacientes que no desempeñen actividades que requieran un

FOLLETO DE INFORMACIÓN
AL PROFESIONAL

FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL**DESPEX JARABE 2,5 mg/5 mL**

estado de alerta mental, como conducir un automóvil o utilizar máquinas, hasta que hayan establecido su propia respuesta al medicamento.

4.8. Reacciones adversasResumen del perfil de seguridad**Población pediátrica**

En ensayos clínicos en población pediátrica, la formulación de desloratadina en jarabe se administró a un total de 246 niños de edades comprendidas entre 6 meses y 11 años. La incidencia global de las reacciones adversas en niños de 2 a 11 años de edad fue similar en los grupos de desloratadina y placebo. En bebés y niños de edades comprendidas entre 6 y 23 meses, las reacciones adversas más frecuentes notificadas por encima del grupo placebo fueron diarrea (3,7%), fiebre (2,3%) e insomnio (2,3%). En un estudio adicional, no se observaron reacciones adversas en pacientes entre 6 y 11 años tras una dosis única de 2,5 mg de desloratadina solución oral.

En un ensayo clínico con 578 pacientes adolescentes, de 12 a 17 años de edad, la reacción adversa más frecuente fue cefalea; ésta se produjo en el 5,9 % de los pacientes tratados con desloratadina y en el 6,9 % de los pacientes que recibieron placebo.

Adultos y adolescentes

A la dosis recomendada, en ensayos clínicos que involucraban a adultos y adolescentes en una serie de indicaciones que incluían rinitis alérgica y urticaria idiopática crónica, se notificaron reacciones adversas con desloratadina en un 3% de pacientes más que en los tratados con placebo. Las reacciones adversas más frecuentes, notificadas con una incidencia superior al grupo placebo, fueron cansancio (1,2%), sequedad de boca (0,8%) y cefalea (0,6%).

Tabla de reacciones adversas

Las reacciones adversas notificadas en ensayos clínicos con frecuencia superior al placebo y otras reacciones adversas notificadas después de la comercialización se enumeran en la siguiente tabla.

Las frecuencias se definen como muy frecuentes ($\geq 1/10$), frecuentes ($\geq 1/100$ a $< 1/10$), poco frecuentes ($\geq 1/1.000$ a $< 1/100$), raras ($\geq 1/10.000$ a $< 1/1.000$), muy raras ($< 1/10.000$) y frecuencia no conocida (no puede estimarse a partir de los datos disponibles).

Sistema de clasificación de órganos	Frecuencia	Reacciones adversas observadas con desloratadina
Trastornos psiquiátricos	Muy rara No conocida	Alucinaciones Comportamiento anormal, agresión
Trastornos del sistema nervioso	Frecuente Frecuente (niños menores de 2 años) Muy rara	Cefalea Insomnio Mareo, somnolencia, insomnio, hiperactividad psicomotora, crisis convulsivas
Trastornos cardíacos	Muy rara No conocida	Taquicardia, palpitaciones QT prolongado
Trastornos gastrointestinales	Frecuente Frecuente (niños menores de 2 años) Muy rara	Boca seca Diarrea Dolor abdominal, náuseas, vómitos, dispepsia, diarrea
Trastornos hepato biliares	Muy rara No conocida	Elevaciones de enzimas hepáticas, aumento de la bilirrubina, hepatitis Ictericia
Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo	No conocida	Fotosensibilidad
Trastornos musculoesqueléticos y del	Muy rara	Mialgia

FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL

DESPEX JARABE 2,5 mg/5 mL

tejido conjuntivo		
Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración	Frecuente Frecuente (niños menores de 2 años) Muy rara No conocida	Fatiga Fiebre Reacciones de hipersensibilidad (tales como anafilaxia, angioedema, disnea, prurito, rash y urticaria) Astenia
<u>Trastornos del metabolismo y la nutrición</u>	<u>No conocida</u>	<u>Aumento del apetito</u>
<u>Exploraciones complementarias</u>	<u>No conocida</u>	<u>Aumento de peso</u>

Población pediátrica

Otras reacciones adversas notificadas en pacientes pediátricos después de la comercialización, con una frecuencia no conocida, incluyeron QT prolongado, arritmia, bradicardia, comportamiento anormal y agresión.

Notificación de sospechas de reacciones adversas

Es importante notificar sospechas de reacciones adversas al medicamento tras su autorización. Ello permite una supervisión continuada de la relación beneficio/riesgo del medicamento.

4.9. Sobredosis

El perfil de reacciones adversas asociado a la sobredosis, observado durante el uso después de la comercialización, es similar al observado a dosis terapéuticas, pero la magnitud de los efectos puede ser mayor.

Tratamiento

En caso de producirse sobredosis, se deberán considerar las medidas habituales para eliminar el principio activo no absorbido. Se recomienda tratamiento sintomático y de soporte.

La desloratadina no se elimina por hemodiálisis; se desconoce si puede ser eliminada por diálisis peritoneal.

Síntomas

Basado en ~~En base a un ensayo clínico en adultos y adolescentes~~ con dosis múltiples, en el que se administraron hasta 45 mg de desloratadina (nueve veces la dosis clínica), no se observaron efectos clínicamente relevantes.

Población pediátrica

El perfil de reacciones adversas asociado a la sobredosis, observado durante el uso después de la comercialización, es similar al observado a dosis terapéuticas, pero la magnitud de los efectos puede ser mayor.

5. PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS**5.1. Propiedades farmacodinámicas**

Grupo farmacoterapéutico: antihistaminicos - antagonista H₁, código ATC: R06A X27

Mecanismo de acción

Desloratadina es un antagonista de la histamina de acción prolongada, no sedante, con una actividad antagonista selectiva en el receptor H₁ periférico. Después de la administración oral, desloratadina bloquea selectivamente los receptores H₁ periféricos de la histamina porque la sustancia no penetra en el sistema nervioso central.

FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL**DESPEX JARABE 2,5 mg/5 mL**

Desloratadina ha demostrado propiedades antialérgicas en estudios in vitro. Estas incluyen la inhibición de la liberación de citoquinas proinflamatorias tales como IL-4, IL-6, IL-8 e IL-13 de las células cebadas/basófilos humanos, así como la inhibición de la expresión de la molécula de adhesión P-selectina en las células endoteliales. Todavía está por confirmar la relevancia clínica de estas observaciones.

Eficacia clínica y seguridad**Población pediátrica**

La eficacia de desloratadina jarabe no se ha investigado en ensayos independientes en pediatría. No obstante, la seguridad de desloratadina en la formulación de jarabe, que contiene la misma concentración de desloratadina solución oral fue demostrada en tres estudios pediátricos. Niños entre 1 y 11 años de edad, que eran candidatos para terapia antihistamínica recibieron una dosis diaria de desloratadina de 1,25 mg (de 1 a 5 años de edad) ó 2,5 mg (de 6 a 11 años de edad). El tratamiento fue bien tolerado según los informes obtenidos de análisis clínicos, signos vitales y datos del intervalo ECG, incluyendo QTc. Cuando se administran las dosis recomendadas, las concentraciones plasmáticas de desloratadina (ver sección 5.2) fueron similares en las poblaciones pediátrica y adulta. Así, ya que el curso de la rinitis alérgica/urticaria idiopática crónica y el perfil de la desloratadina son similares en pacientes adultos y pediátricos, los datos de eficacia de la desloratadina en adultos pueden extrapolarse a la población pediátrica.

La eficacia de desloratadina jarabe no se ha investigado en ensayos pediátricos en niños menores de 12 años de edad.

~~La inocuidad de desloratadina fue demostrada en tres estudios pediátricos. Niños entre 6 meses a 11 años que fueron candidatos para tratamiento antihistamínico, se les administró una dosis diaria de 1 mg (6 a 11 meses de edad), 1,25 mg (1 a 5 años de edad) o una de 2,5 mg (6 a 11 años de edad). El tratamiento se toleró bien según lo documentaron los hallazgos del laboratorio clínico, los signos vitales y los datos de intervalos del ECG, con inclusión del QTc. Cuando la desloratadina se administró a las dosis recomendadas, la concentración plasmática de desloratadina fue similar en las poblaciones pediátricas y de adultos. Por consiguiente, como el curso de la rinitis alérgica/urticaria idiopática crónica y el perfil de la desloratadina son similares en pacientes adultos y pediátricos, los datos de eficacia de la desloratadina pueden extrapolarse a la población pediátrica.~~

Adultos y adolescentes

En un ensayo clínico con dosis múltiple, en adultos y adolescentes, en el cual se administraron hasta 20 mg de desloratadina al día durante 14 días, no se observaron efectos cardiovasculares estadística o clínicamente relevantes. En un ensayo de farmacología clínica, en adultos y adolescentes, en el cual desloratadina se administró en adultos a una dosis de 45 mg al día (nueve veces la dosis clínica) durante diez días, no se observó prolongación del intervalo QTc.

La desloratadina no penetra fácilmente en el sistema nervioso central. En ensayos clínicos controlados, a la dosis recomendada de 5 mg al día, no hubo aumento de la incidencia de somnolencia en comparación con placebo. En ensayos clínicos, desloratadina administrada a una dosis diaria única de 7,5 mg no afectó a la actividad psicomotriz. En un estudio de dosis única realizado en adultos, desloratadina 5 mg no afectó a las medidas estándar relativas a la capacidad de realización del vuelo incluyendo la exacerbación de la somnolencia subjetiva o tareas relacionadas con el vuelo.

En ensayos de farmacología clínica, la coadministración con alcohol no aumentó el deterioro inducido por el alcohol en el comportamiento, ni aumentó la somnolencia. No se hallaron diferencias significativas en los resultados de las pruebas psicomotoras entre los grupos de desloratadina y placebo, tanto si se administraba sola o con alcohol.

En ensayos de interacción con ketoconazol y eritromicina en dosis múltiple, no se observaron cambios clínicamente relevantes en las concentraciones plasmáticas de desloratadina.

FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL**DESPEX JARABE 2,5 mg/5 mL**

En pacientes con rinitis alérgica, desloratadina fue eficaz en el alivio de síntomas tales como estornudos, rinorrea y picor nasal, así como escozor, lagrimeo y enrojecimiento ocular y picor de paladar. Desloratadina controló eficazmente los síntomas durante 24 horas. La eficacia de desloratadina comprimidos no se ha demostrado claramente en ensayos con pacientes adolescentes de 12 a 17 años de edad.

Además de las clasificaciones establecidas de estacional y perenne, la rinitis alérgica se puede clasificar alternativamente como rinitis alérgica intermitente y rinitis alérgica persistente según la duración de los síntomas. La rinitis alérgica intermitente se define como la presencia de síntomas durante menos de 4 días a la semana o durante menos de 4 semanas. La rinitis alérgica persistente se define como la presencia de síntomas durante 4 o más días a la semana y durante más de 4 semanas.

Desloratadina **comprimidos** fue eficaz en aliviar la carga de rinitis alérgica estacional tal y como muestra la puntuación total del cuestionario de calidad de vida en rino-conjuntivitis. La mayor mejora se observó en las áreas de los problemas prácticos y en las actividades diarias limitadas por los síntomas.

Se estudió la urticaria idiopática crónica como modelo clínico de afecciones que cursan con urticaria, ya que la patofisiología subyacente es similar, con independencia de su etiología, y porque se puede reclutar a los pacientes crónicos más fácilmente de forma prospectiva. Como la liberación de histamina es un factor causal en todas las enfermedades con urticaria, se espera que desloratadina sea eficaz en el alivio sintomático de otras afecciones que cursan con urticaria, además de la urticaria idiopática crónica, tal y como se recomienda en las directrices clínicas.

En dos ensayos controlados con placebo de seis semanas de duración en pacientes con urticaria idiopática crónica. Desloratadina fue eficaz en el alivio del prurito y en la disminución del tamaño y número de ronchas cutáneas al final del primer intervalo de dosificación. En cada ensayo, los efectos se mantuvieron durante el intervalo de dosis de 24 horas. Como en el caso de ensayos con otros antihistamínicos en urticaria idiopática crónica, se excluyó a la minoría de pacientes que fueron identificados como no respondedores a los antihistamínicos. Se observó una mejora en el prurito de más del 50% en el 55% de los pacientes tratados con desloratadina en comparación con el 19% de los pacientes tratados con placebo. El tratamiento con desloratadina también redujo significativamente la interferencia con la relación entre el sueño y la vigilia, medida mediante una escala de cuatro valores utilizada para evaluar estas variables.

5.2. Propiedades farmacocinéticas**Absorción**

Las concentraciones plasmáticas de desloratadina se pueden detectar antes de transcurridos ~~30 minutos~~ de la administración de desloratadina en adultos y adolescentes. Desloratadina se absorbe bien alcanzándose la concentración máxima después de aproximadamente 3 horas; la semivida de eliminación es de aproximadamente 27 horas. El grado de acumulación de desloratadina fue coherente con su semivida (aproximadamente 27 horas) y con una frecuencia de dosificación de una vez al día. La biodisponibilidad de la desloratadina fue proporcional a la dosis en el intervalo de 5 mg a 20 mg.

En una serie de ensayos clínicos y farmacocinéticos, el 6% de los sujetos alcanzó una concentración más alta de desloratadina. La prevalencia de este fenotipo metabolizador lento fue similar en adultos (6%) y en sujetos pediátricos de 2 a 11 años de edad (6%), y mayor en raza negra (18% adultos, 16% pediátricos) que en caucásicos (2% adultos, 3% pediátricos) en ambas poblaciones.

En un estudio farmacocinético de dosis múltiple realizado con la formulación en comprimidos en sujetos adultos sanos, cuatro sujetos resultaron ser metabolizadores lentos de desloratadina. Estos sujetos tuvieron una $C_{máx}$ alrededor de 3 veces más alta después de aproximadamente 7 horas con una semivida de eliminación de aproximadamente 89 horas.

Se observaron parámetros farmacocinéticos similares en un estudio farmacocinético de dosis múltiple realizado con la formulación en jarabe en sujetos metabolizadores lentos pediátricos de 2 a 11 años de edad

**FOLLETO DE INFORMACIÓN
AL PROFESIONAL**

FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL**DESPEX JARABE 2,5 mg/5 mL**

diagnosticados con rinitis alérgica. La exposición (AUC) a desloratadina fue alrededor de 6 veces más alta y la C_{máx} fue alrededor de 3 a 4 veces más alta a las 3 - 6 horas con una semivida de eliminación de aproximadamente 120 horas. La exposición fue la misma en adultos y en metabolizadores lentos pediátricos cuando se trataron con dosis adecuadas a la edad. El perfil de seguridad global de estos sujetos no fue diferente del de la población en general. Los efectos de desloratadina en los metabolizadores lentos < 2 años de edad, no ha sido estudiada.

En estudios de dosis única independientes, a las dosis recomendadas, los pacientes pediátricos presentaron valores de AUC y C_{máx} de desloratadina similares a los obtenidos en adultos que recibieron una dosis de 5 mg de desloratadina jarabe.

Distribución

Desloratadina se une moderadamente (83% - 87%) a proteínas plasmáticas. Después de la dosificación una vez al día en adultos y adolescentes de desloratadina (5 mg a 20 mg) durante 14 días, no existe evidencia clínicamente relevante de acumulación del principio activo.

En un ensayo de dosis única, cruzado, de desloratadina, las formulaciones de comprimido y jarabe fueron bioequivalentes.

Metabolización

Todavía no se ha identificado la enzima responsable del metabolismo de la desloratadina, y por lo tanto, no se pueden excluir completamente algunas interacciones con otros medicamentos. *In vivo* desloratadina no inhibe el CYP3A4 y estudios *in vitro* han demostrado que el medicamento no inhibe el CYP2D6 y que no es un sustrato ni un inhibidor de la P-glicoproteína.

Eliminación

En un ensayo de dosis única utilizando una dosis de 7,5 mg de desloratadina, no hubo ningún efecto de los alimentos (desayuno altamente calórico, rico en grasas) sobre la disponibilidad de desloratadina. En otro estudio, el jugo de pomelo no afectó la disponibilidad de la desloratadina.

Pacientes con insuficiencia renal

Se ha comparado la farmacocinética de desloratadina en pacientes con insuficiencia renal crónica (IRC) con la de sujetos sanos en un ensayo de dosis única y en otro de dosis múltiples. En el de dosis única, la exposición a desloratadina fue aproximadamente 2 y 2,5 veces mayor en sujetos con IRC leve a moderada y con IRC grave, respectivamente, en comparación con sujetos sanos. En el ensayo a dosis múltiples, el estado estacionario se alcanzó después del día 11, y en comparación con los sujetos sanos, la exposición a desloratadina fue ~ 1,5 veces mayor en sujetos con IRC leve a moderada y ~ 2,5 veces mayor en sujetos con IRC grave. En ambos estudios, los cambios en la exposición (AUC y C_{máx}) de desloratadina y de 3-hidroxidesloratadina no fueron relevantes desde el punto de vista clínico.

5.3. Datos preclínicos sobre seguridad

Desloratadina es el metabolito activo primario de loratadina. Los estudios no clínicos llevados a cabo con desloratadina y loratadina demostraron que no hay diferencias cualitativas ni cuantitativas en el perfil de toxicidad de desloratadina y loratadina a niveles comparables de exposición a desloratadina.

Los datos de los estudios no clínicos no muestran riesgos especiales para los seres humanos según los estudios convencionales de farmacología de seguridad, toxicidad a dosis repetidas, genotoxicidad, potencial carcinogénico, toxicidad para la reproducción y el desarrollo. Se demostró la ausencia de potencial carcinogénico en estudios llevados a cabo con desloratadina y loratadina.

FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL

DESPEX JARABE 2,5 mg/5 mL

6. DATOS FARMACÉUTICOS

6.1. Incompatibilidades

No procede.

6.2. Precauciones especiales de almacenamiento

Mantener lejos del alcance de los niños; en su envase original, a no más de 30°C.

6.3. Contenido de envase

Estuches que contienen ~~20, 30 ó 120~~ X mL de jarabe.

6.4. Precauciones especiales de eliminación

Ninguna especial.

FOLLETO DE INFORMACIÓN
AL PROFESIONAL

