

MT217493

Reg. ISP N° F-14618/10



LABORATORIOS ANDROMACO S.A.

FOLLETO PARA INFORMACIÓN AL PROFESIONAL

**NEOLARMAX JARABE 2,5 mg/5 mL
DES LorATADINA**

INSTITUTO DE SALUD PUBLICA DE CHILE DEPARTAMENTO CONTROL NACIONAL SUBDEPTO REGISTRO UNIDAD PRODUCTOS FARMACEUTICOS NUEVOS	
01 AGO 2011	
N° Ref.	MT 217493/10
N° Registro	F-14618/10
Firma Profesional.	

COMPOSICIÓN:

Cada 5 mL de jarabe contiene:

Desloratadina 2,5 mg

Excipientes: según última fórmula aprobada en el registro sanitario, c.s.

CLASIFICACIÓN FARMACOLÓGICA Y/O TERAPÉUTICA:

Antihistamínico. Antialérgico.

FARMACOLOGÍA:

La Desloratadina pertenece al grupo terapéutico de los antihistamínicos-antagonistas H1.

Desloratadina es un antagonista selectivo de los receptores H1 de la histamina periféricos, la cual tiene acción prolongada y efecto no sedante.

Desloratadina es el principal metabolito de la Loratadina con una actividad farmacodinámica similar a ésta y una potencia mayor que Loratadina (10 a 20 veces más potente *in vitro* y en animales 2.5 a 4 veces).

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.

Los antihistamínicos usados en el tratamiento de la alergia actúan compitiendo con la histamina por los sitios del receptor H1 sobre las células efectoras. Así, previenen, pero no revierten, las respuestas mediadas por la histamina. Los antihistamínicos antagonizan, de gran manera, la mayoría de los efectos farmacológicos de la histamina, incluyendo la urticaria y prurito.

Como antihistamínico de forma indirecta suprime la liberación de diversas citocinas (IL-3, 4, 6, 8 y 13, así como el TNF alfa) en la cascada alérgica y así es capaz de reducir la quimiotaxis de los eosinófilos inducida por PAF.

El mecanismo de acción del antihistamínico Desloratadina que posibilitan el control de los síntomas de la rinitis alérgica (Scadding, 2002) es:

**FOLLETO DE INFORMACION
AL PROFESIONAL**

MT217493

Reg. ISP N° F-14618/10



LABORATORIOS ANDROMACO S.A.

Mecanismo	Mediadores	Síntomas que mejoran
Antihistamínico	Histamina, Recaptación triptasa, PGD2 y LTC4 IL3, 4, 6, 13 IL8, TNFalfa, GM-CSF, RANTES, ICAM1, P-selectin	Estornudos, picor, rinorrea acuosa, congestión (vasodilatación) Rinorrea mucosa

Obstrucción nasal

PGD2: prostaglandina D2; LTC4: leucotrieno C4; IL3, 4, 6, 13 IL8: interleucinas; TNFalfa: factor de necrosis tumoral alfa; GM-CSF: factor estimulador del crecimiento de colonias de macrófagos, RANTES: regulación en la activación de la expresión y secreción de las células T; ICAM1: adhesión intercelular molécula 1.

La seguridad de Desloratadina a la forma de jarabe ha sido demostrada en tres estudios clínicos en pacientes de entre 6 meses y 11 años de edad, de los cuales se puede concluir que el tratamiento fue bien tolerado y cuando se administra a las dosis recomendadas, la actividad farmacocinética de la Desloratadina es comparable tanto en la población adulta como en la población pediátrica. Por lo tanto, conociendo que la rinitis alérgica estacional y perenne y la urticaria idiopática crónica son similares en los adultos y en los niños, la eficacia de la desloratadina en adultos se puede extrapolar a la población pediátrica.

En un ensayo clínico con dosis múltiple, 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.

A la dosis recomendada de 5 mg al día, no hubo incidencia de exceso de somnolencia en comparación con placebo.

En ensayos clínicos, la administración de una dosis diaria única de 7,5 mg en adultos y adolescentes no afectó a la actividad psicomotriz.

Datos preclínicos sobre seguridad

Desloratadina es el metabolito activo primario de loratadina. Los estudios preclínicos 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.

En base a los estudios farmacológicos convencionales de seguridad, toxicidad de dosis repetidas, genotoxicidad y toxicidad sobre la reproducción, los datos preclínicos con Desloratadina, no revelan daño especial sobre los humanos. Se demostró la ausencia de potencial carcinogénico en estudios llevados a cabo con loratadina.

**FOLLETO DE INFORMACION
** AL PROFESIONAL**

**DESTINO EN EL ORGANISMO (farmacocinética):****Absorción:**

Las concentraciones plasmáticas de desloratadina se pueden detectar antes de transcurridos 30 minutos de su administración. Desloratadina se absorbe bien lográndose concentraciones máximas al cabo de aproximadamente 3 horas; la vida media de eliminación es de aproximadamente 27 horas. La concentración de equilibrio se alcanza aproximadamente en 7 días. El grado de acumulación de Desloratadina se correlaciona con su vida media y con una frecuencia de dosificación de una vez al día. La biodisponibilidad de la Desloratadina es proporcional a la dosis entre 5 mg y 20 mg.

Distribución:

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

Metabolismo y excreción:

Desloratadina se metaboliza intensamente, su principal metabolito es 3-OH desloratadina y sólo una pequeña cantidad se detecta en orina (<2%) y heces (<7%).

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 fármacos. No inhibe el CYP3A4, CYP2D6 y que no es un sustrato ni un inhibidor de la P-glicoproteína.

Los alimentos no afectan la biodisponibilidad de Desloratadina.

No se dispone de estudios farmacocinéticos de la Desloratadina en personas de edad avanzada y en pacientes con disfunción renal. Sin embargo, se ha reportado la seguridad y eficacia en uso de pacientes de hasta 75 años de edad, sugiriendo que no es necesario el ajuste de dosis en los pacientes ancianos.

Según datos disponibles, la vida media de eliminación de Desloratadina puede aumentar en pacientes con insuficiencia renal crónica. Probablemente no sea necesaria la reducción de dosis en pacientes con disfunción renal suave a moderada. Datos farmacocinéticos limitados sugieren que la administración de 5 mg diarios de Desloratadina es probablemente segura en pacientes con disfunción hepática.

INDICACIONES Y USO CLÍNICO

~~Para el alivio de los síntomas asociados con: rinitis alérgica estacional y urticaria crónica idiopática.~~

~~Esta indicado en pacientes mayores de 2 años para el:~~

FOLLETO DE INFORMACION
AL PROFESIONAL

MT217493

Reg. ISP N° F-14618/10



LABORATORIOS ANDROMACO S.A.

- ~~Alivio de los síntomas nasales y no nasales asociados con la rinitis alérgica estacional o perenne.~~
- ~~Alivio de los síntomas de la urticaria idiopática crónica, tales como el alivio del prurito y del tamaño y número de ronchas.~~

- Rinitis alérgica estacional: Indicado para el alivio de los síntomas nasales y no nasales de la rinitis alérgica estacional en pacientes de 2 años de edad y mayores.

- Rinitis alérgica perenne: Indicado para el alivio de los síntomas nasales y no nasales de la rinitis alérgica perenne en pacientes de 6 meses de edad y mayores.

- Urticaria idiopática crónica: Indicado para el alivio del prurito, reducción del número y tamaño de las ronchas en pacientes con urticaria idiopática crónica de 6 meses de edad y mayores.

CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad al principio activo, o a alguno de los excipientes o a Loratadina. Está contraindicado en menores de **2 años 6 meses**.

ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES DE EMPLEO

No se ha establecido la eficacia y seguridad del jarabe en niños menores de **2 años 6 meses** de edad.

En caso de insuficiencia renal severa, deberá utilizarse con precaución.

No requiere ajuste de dosis en insuficiencia hepática ni en ancianos.

No se ha observado efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas.

Embarazo y lactancia:

Desloratadina no fue teratogénica en estudios disponibles realizados con animales. No se ha establecido el uso seguro del fármaco durante el embarazo. Por lo tanto, no se recomienda la administración durante el embarazo.

La Desloratadina se excreta en la leche materna, por lo que el uso en mujeres en período de lactancia no está recomendado.

INTERACCIONES

En estudios clínicos realizados con Desloratadina a la forma de jarabe no se observaron interacciones clínicamente relevantes.

Aunque no se ha identificado la enzima responsable de la metabolización de Desloratadina, el potencial de interacción con el citocromo P450 parece bajo. Tampoco es sustrato o inhibidor de P-glicoproteína.

Según estudios clínicos, la administración conjunta de Desloratadina y alcohol, no potenció los efectos nocivos del alcohol sobre el comportamiento.

**FOLLETO DE INFORMACION
AL PROFESIONAL**



REACCIONES ADVERSAS

En estudios clínicos realizados en población pediátrica, la administración de Desloratadina a la forma de jarabe a 445 246 niños con edades entre 2 6 meses y 11 años, concluyeron que la incidencia general de efectos adversos en niños de 6 a 11 años fue similar entre el grupo que recibió Desloratadina como jarabe a los que recibieron placebo. En niños de 2 a 5 años los efectos adversos reportados en al menos un 2% de pacientes que recibió Desloratadina y a una mayor frecuencia que placebo fueron fiebre, infección urinaria y varicela. En niños de 12 a 23 meses de edad los eventos adversos más frecuentes en al menos un 2% de pacientes que recibió Desloratadina, fueron fiebre, diarrea, infecciones respiratorias, tos, aumento del apetito, epistaxis, faringitis y rash. En niños de 6 a 11 meses de edad los eventos adversos reportados en al menos un 2% de pacientes que recibió Desloratadina y con una mayor frecuencia que placebo fueron infecciones respiratorias, diarrea, fiebre.

En estudios clínicos con adultos y adolescentes, a la dosis recomendada para rinitis alérgica y urticaria idiopática crónica, se comunicaron reacciones adversas con Desloratadina en un 3% de pacientes más que en los tratados con placebo.

Los acontecimientos adversos más frecuentes comunicados por encima del grupo placebo son:

Fatiga (1,2%), sequedad de boca (0,8%) y cefalea (0,6%).

SOBREDOSIFICACIÓN

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.

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.

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

FOLLETO DE INFORMACION
AL PROFESIONAL

DOSIFICACIÓN Y MODO DE EMPLEO

La vía de administración es oral.

Niños de 6 meses a 11 meses: la dosis recomendada es 2 mL (1 mg) de jarabe una vez al día, con o sin comidas.

Niños de 2 1 a 5 años: la dosis recomendada es ~~Toma~~ 2,5 mL (1,25 mg) de jarabe una vez al día, con o sin comidas.

MT217493

Reg. ISP N° F-14618/10



LABORATORIOS ANDROMACO S.A.

Niños de 6 a 11 años: la dosis recomendada es Tomar 5 mL (2,5 mg) de jarabe una vez al día, con o sin comidas.

Adultos y adolescentes mayores de 12 años: la dosis recomendada es Tomar 10 mL (5 mg) de jarabe una vez al día, con o sin comidas.

BIBLIOGRAFIA

- 1 http://www.accessdata.fda.gov/drugsatfda_docs/label/2004/213001bl.pdf
- 2 <http://www.drugs.com>

FOLLETO DE INFORMACION
AL PROFESIONAL