

DELORAT®

DES LorATADINA

Comprimidos recubiertos 5 mg

Jarabe 5 mg / 10 ml

Industria Argentina

Venta bajo receta

Fórmula Cualitativa:

Cada comprimido recubierto contiene:

Desloratadina	5,00 mg
Celulosa microcristalina	89,00 mg
Almidón glicolato sódico	3,00 mg
Talco	2,00 mg
Estearato de magnesio	1,00 mg
Hidroxipropilmetilcelulosa E15	1,50 mg
Poli(etilenglicol) 6000	0,25 mg
Dióxido de titanio	0,75 mg
Talco	0,50 mg

Cada 100 ml de jarabe contiene:

Desloratadina micronizada	50,00 mg
Acido cítrico anhidro	50,00 mg
Benzoato de sodio	100,00 mg
Citrato de sodio deshidratado	126,00 mg
Edetato disódico	25,00 mg
Propilenglicol	10,00 g
Esencia tutifrutí	75,00 mg
Sacarosa	49,00 g
Solución de sorbitol al 70%	15,00 g
Agua purificada c.s.p.	100,00 ml

Acción Terapéutica:

Antihistamínico.

Indicaciones:

DELORAT® está indicado en:

- Rinitis alérgica estacional: para el alivio de los síntomas nasales y extranasales, en pacientes desde los 2 años de edad.
- Rinitis alérgica perenne: para el alivio de los síntomas nasales y extranasales, en pacientes desde los 6 meses de edad.
- Urticaria idiopática crónica : para el alivio sintomático del prurito y disminución del número y tamaño de las pápulas urticarianas, en pacientes desde los 6 meses de edad.

Acción Farmacológica:

La desloratadina es un antihistamínico no sedante, de acción prolongada, con actividad antagonista selectiva de los receptores periféricos H₁. La droga ha demostrado actividad antialérgica, antihistamínica y antiinflamatoria. Después de la administración oral, la desloratadina bloquea selectivamente los receptores periféricos de la histamina H₁, debido a que la droga está excluida de ingresar al sistema nervioso central (SNC). Además de la actividad antihistamínica, la desloratadina ha demostrado propiedades antialérgicas y antiinflamatorias en diversos estudios *in vitro* (llevados a cabo principalmente en células de origen humano) e *in vivo*. Los mismos han evidenciado que la desloratadina inhibe la liberación de citoquinas proinflamatorias, tales como IL-4, IL-6, IL-8 e IL-13 a partir de los mastocitos / basófilos humanos, como así también la expresión de la molécula de adhesión P-selectina en las células endoteliales. La importancia clínica de estas observaciones debe ser confirmada.

Farmacocinética:

Es posible detectar concentraciones plasmáticas de desloratadina a los 30 minutos de su administración. La droga es bien absorbida, alcanzándose las concentraciones máximas al cabo de aproximadamente 3 horas; la vida media de la fase terminal es de alrededor de 27 horas. El grado de acumulación de la desloratadina fue consistente con su vida media (aproximadamente 27 horas) y la frecuencia de administración de una vez por día. La biodisponibilidad de la desloratadina fue proporcional a la dosis en el rango de 5 a 20 mg.

La desloratadina se une en forma moderada (83% a 87%) a las proteínas plasmáticas. No hay evidencias clínicamente significativas de acumulación del fármaco con posterioridad a la administración de una toma diaria (5 a 20 mg) durante 14 días. Todavía no se ha identificado la enzima responsable del metabolismo de la desloratadina, por lo que algunas interacciones con otras drogas no pueden excluirse por completo. Estudios *in vivo* en los que se utilizaron inhibidores específicos de CYP3A4 y CYP2D6 han demostrado que estas enzimas no son importantes en el metabolismo de la desloratadina. La desloratadina no inhibe CYP3A4 o CYP2D6 y no es un sustrato ni un inhibidor de la P-glucoproteína .

En un estudio de administración de dosis únicas, en el que se utilizó una dosis de 7,5 mg de desloratadina, los alimentos (desayuno rico en grasas, alto en calorías) no evidenciaron efectos sobre la disposición del fármaco. En otro estudio, el jugo de pomelo no tuvo efecto sobre la absorción de la desloratadina. En un estudio cruzado en el que se administraron dosis únicas de desloratadina, las formulaciones comprimidos y jarabe resultaron bioequivalentes y no fueron afectadas por la presencia de alimentos (desayuno rico en grasas, alto en calorías). En otros estudios con dosis únicas, a la posología recomendada, los pacientes pediátricos presentaron valores de área bajo la curva (AUC) y concentración máxima (C_{máx}) de desloratadina comparables a los encontrados en los adultos que recibieron una dosis de 5 mg de jarabe de desloratadina.

Posología:

• Comprimidos:

Adultos y niños (> 12 años de edad): Un comprimido de 5 mg, una vez por día, con o sin alimentos.

• Jarabe:

Adultos y niños (> 12 años de edad): 10 ml (5 mg), una vez por día, con o sin alimentos.

Niños de 6 a 11 años de edad: 5 ml (2,5 mg), una vez por día, con o sin alimentos.

Niños de 12 meses a 5 años de edad: 2,5 ml (1,25 mg), una vez por día, con o sin alimentos.

Niños de 6 a 11 meses de edad: 2 ml (1 mg), una vez por día.

Contraindicaciones:

DELORAT® está contraindicado en los pacientes con hipersensibilidad conocida a la sustancia activa, a cualquiera de los excipientes o a la loratadina. Embarazo.

Precauciones y Advertencias:

No se ha establecido la seguridad y eficacia de DELORAT® comprimidos recubiertos en niños menores de 12 años. No se ha establecido la seguridad de la desloratadina jarabe en niños menores de 6 meses. En caso de insuficiencia renal grave se recomienda administrar la droga con precaución.

Efectos sobre la capacidad para conducir vehículos y utilizar maquinarias:

La desloratadina ha evidenciado muy escasa o ninguna influencia sobre la capacidad para conducir vehículos y usar maquinarias (ver Acción Farmacológica).

Interacciones farmacológicas:

No se detectaron interacciones farmacológicas clínicamente pertinentes en los estudios clínicos efectuados con desloratadina en los que se administró concomitantemente eritromicina o ketoconazol (ver Acción Farmacológica). No se observaron efectos de los alimentos o el jugo de pomelo sobre la absorción de la desloratadina. En un ensayo clínico farmacológico, la administración de desloratadina concomitantemente con alcohol no potenció los efectos de menoscabo del desempeño producidos por este último (ver Acción Farmacológica).

Cimetidina: se observó un aumento en las concentraciones plasmáticas de desloratadina y 3-hidroxidesloratadina.

Carcinogénesis, mutagénesis, fertilidad y teratogénesis:

La desloratadina es el principal metabolito activo de la loratadina. Los estudios preclínicos conducidos con desloratadina y loratadina demostraron que no existen diferencias cualitativas ni cuantitativas en el perfil de toxicidad de la desloratadina y la loratadina, a niveles similares de exposición a la desloratadina. Los datos preclínicos con desloratadina no revelan un riesgo especial para el hombre, en base a los ensayos convencionales de seguridad farmacológica, toxicidad de dosis repetidas, genotoxicidad y toxicidad reproductiva. La falta de potencial carcinogénico fue demostrada en estudios conducidos con loratadina.

Uso durante el embarazo:

No se observaron efectos teratogénicos o mutagénicos en los ensayos clínicos realizados en animales con desloratadina. Dado que no se dispone de datos clínicos de exposición a la droga durante la gestación, no se ha establecido la seguridad del empleo de desloratadina en mujeres embarazadas. Por lo tanto, **DELORAT[®]** no debe utilizarse durante el embarazo a menos que los potenciales beneficios superen los riesgos.

Uso durante la lactancia:

La desloratadina se excreta en la leche materna. Por lo tanto, no se recomienda su uso durante la lactancia a menos que los potenciales beneficios superen los riesgos.

Uso en pediatría:

No se ha establecido la seguridad y eficacia de **DELORAT[®]** comprimidos recubiertos en niños menores de 12 años.

Reacciones Adversas:

Con el uso de desloratadina se pueden dar las siguientes reacciones adversas, a nivel:

Sistema Nervioso Autónomo: Alteración de la lagrimación, alteración de la salivación, flushing, hipoestesias, impotencia, aumento de la transpiración.

Psicofísico: Edema angioneurótico, fiebre, malestar general, aumento de peso, astenia, dolor de espalda, síndrome simil gripe, linfadenopatía.

Ocular: Visión borrosa, conjuntivitis, dolor ocular, fotofobia.

Otíco: Dolor de oído, infección, tinitus.

Aparato cardiovascular: Hipertensión, hipotensión, palpitaciones, síncope, taquicardia, extrasístoles ventriculares, taquicardia supraventricular.

Sistema nervioso central y periférico: Blefaroespasma, transpiración, disfonía, aumento del apetito, hiperquinesia, hipertonia, migraña, parestesias, temblor y vértigo.

Aparato gastrointestinal: Distensión abdominal, dolor abdominal, constipación, diarrea, eructos, meteorismo, gastritis, hipo, alteraciones a nivel gingival, hemorroides, aumento del apetito, estomatitis, vómitos, disminución del gusto, decoloración de la lengua y dolor de muelas. También puede producir alteraciones de la función hepática.

Osteomuscular: Artralgia, mialgia, tortícolis.

Psiquiátrico: Reacciones de agresividad, agitación, ansiedad, apatía, confusión, disminución de la libido, depresión, labilidad emocional, euforia, irritabilidad y paranoia.

Aparato reproductor: Mastalgia, dismenorrea, menorragia, vaginitis, impotencia, sangrado intermenstrual.

Aparato respiratorio: Bronquitis, broncoespasmo, tos, disnea, epistaxis, hemoptisis, laringitis, goteo nasal, sinusitis, halitosis, congestión nasal, irritación nasal, infección respiratoria.

Piel y anexos: Acné, infección bacteriana, piel seca, eczema, edema, necrolisis epidérmica, eritema, hematoma, prurito, rash, urticaria y púrpura.

Aparato urinario: Alteraciones miccionales, alteraciones en la coloración de la orina, incontinencia urinaria y retención urinaria.

Sobredosis:

Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al Hospital más cercano o comunicarse con los Centros de Toxicología:

Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez:
(011) 4962-6666 / 2247
Hospital A. Posadas: (011) 4654-6648 / 4658-7777

En caso de sobredosis, luego de la cuidadosa evaluación clínica del paciente, de la valoración del tiempo transcurrido desde la ingesta o administración, de la cantidad de tóxicos ingeridos y de haber descartado ciertos procedimientos contraindicados, el profesional decidirá la realización o no del tratamiento general de rescate: vómito provocado o lavado gástrico, carbón activado, purgante salino (45 a 60 minutos después del carbón activado). Se recomienda el tratamiento sintomático y de sostén. En un ensayo de dosis múltiples, en el que se administraron hasta 45 mg de desloratadina (9 veces la dosis clínica), no se observaron efectos clínicamente pertinentes. La desloratadina no se elimina por hemodíalisis; se desconoce si la droga se elimina por diálisis peritoneal.

Presentaciones:

Comprimidos recubiertos: Envases conteniendo 14 comprimidos recubiertos.

Jarabe: Envase conteniendo 50 ml

Conservación:

Conservar a una temperatura entre 15 y 30 °C. Proteger del exceso de humedad. Conservar en el envase original.

MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS

Especialidad Medicinal Autorizada por el
Ministerio de Salud. Certificado N° 38.677



Dr. LAZAR y Cía. S.A.Q. e I.
Av. Vélez Sársfield 5853/5855
B1605EPI Munro, Pcia. de Buenos Aires
Directora Técnica: Daniela A. Casas
Farmacéutica y Bioquímica.

Fecha de última revisión del prospecto: 28/10/2008

36642/5
P138