ALERFEDINE ®

FEXOFENADINA ClH 30 mg / 5 ml

Suspensión oral
Venta bajo receta
Industria Argentina

FÓRMULA: Cada 5 ml se suspensión oral contiene:
Fexofenadina clorhidrato (equivalente a 28 mg de fexofenadina): 30,00 mg; Propilenglicol: 175,00 mg; EDTA disódico: 7,50 mg; Propilparabeno: 1 , 5 0 mg; Metilparabeno: 5,00 mg; Goma Xántica: 13,00 mg; Poloxámero 407: 2,50 mg; Dióxido de titanio: 5,00 mg; Fosfato monobásico monohidrato: 37,50 mg; Fosfato dibásico dihidrato: 41,50 mg; Esencia banana líquida: 20,00 mg; Sacarosa: 1000,00 mg; Agua purificada c.s.p: 5, 00 ml.

ACCIÓN TERAPÉUTICA:
Antagonista de los receptores H1 de la histamina.

INDICACIONES:
Rinitis Alérgica Estacional: La suspensión oral está indicada para el alivio de los síntomas asociados con la rinitis alérgica estacional en niños de 2 a 11 años de edad. Los síntomas tratados efectivamente fueron estornudos; rinorrea; picazón de nariz, paladar y garganta; picazón, lagrimeo y enrojecimiento ocular.
Urticaria Idiopática Crónica: La suspensión oral se indica para el tratamiento de las manifestaciones cutáneas, sin complicaciones, de la urticaria idiopática crónica en niños de 6 meses a 11 años de edad. La fexofenadina ClH reduce significativamente el prurito y la cantidad de ronchas.

ACCIÓN FARMACOLÓGICA:
La Fexofenadina es un antihistamínico con actividad antagonista periférica selectiva de los receptores H1 de histamina. La Fexofenadina inhibe el broncoespasmo antígeno-inducido en cobayos sensibilizados y la liberación de histamina de los mastocitos peritoneales en la rata. En animales de laboratorio no fueron observados efectos bloqueadores de los receptores anticolinérgicos o α1 adrenérgicos. Además no se observaron efectos sedantes u otros efectos del SNC. La Fexofenadina no atraviesa la barrera hematoencefálica.

FARMACOCINÉTICA:
Absorción: Después de la administración oral de una dosis de 30 mg de suspensión oral a adultos sanos, la Cmax media fue de 118 ng/ml y se produjo a aproximadamente 1,0 hora. La administración de la suspensión con una comida de alto contenido graso disminuyó el AUC y la Cmax media en aproximadamente 30 y 47%, respectivamente, en adultos sanos.
Distribución: El 60% a 70% de fexofenadina está ligado a las proteínas plasmáticas principalmente albúmina y α1 - glicoproteína.
Metabolismo: Aproximadamente el 5% de la dosis total de fexofenadina clorhidrato se eliminó por medio del metabolismo hepático.
Eliminación: La vida media de eliminación de fexofenadina fue de 14,4 horas después de la administración de 60 mg dos veces por día en adultos sanos. Estudios de balance de masa en humanos mostraron una recuperación aproximada de 80% y 11% de la dosis de Fexofenadina (^{14}C) en heces y orina, respectivamente. Aproximadamente el 5% de la dosis total fue metabolizada. Como la biodisponibilidad absoluta de la Fexofenadina no ha sido establecida, se desconoce si el componente fecal representa la droga no absorbida o el resultado de la excreción biliar.
Poblaciones especiales: Las farmacocinéticas en pacientes con insuficiencia renal y en pacientes geriátricos, obtenidas después de una dosis única de 80 mg de fexofenadina clorhidrato fueron comparadas con las de voluntarios sanos en un estudio separado de diseño similar.
Pacientes con insuficiencia renal: En pacientes con insuficiencia renal leve a moderada (clearance de creatinina de 41-80 ml/min) y severa (clearance de creatinina 11-40 ml/min), las concentraciones plasmáticas pico de fexofenadina fueron 87% y 111% mayores, respectivamente y la media de las vidas medias de eliminación fueron 59% y 72% más prolongadas, respectivamente, que las observadas en los voluntarios sanos. Las concentraciones plasmáticas pico en pacientes con diálisis (clearance de creatinina ≤ 10 ml/min) fueron 82% mayores y la vida media fue 31% más prolongada que la observada en voluntarios sanos. Sobre la base de los aumentos registrados en la biodisponibilidad y la vida media, se recomienda para los pacientes pediátricos con disminución de la función renal, una dosis de inicio de fexofenadina de 30 mg (5 ml) una vez al día para pacientes de 2 a 11 años y 15 mg (2,5 ml) una vez al día para pacientes de 6 meses a 2 años.
Pacientes geriátricos: En pacientes ancianos (≥ 65 años de edad), los niveles plasmáticos pico de Fexofenadina fueron 99% mayores que los observados en voluntarios menores de 65 años. La media de las vidas media de eliminación fue similar en ambos grupos.

POSOLOGÍA Y FORMA DE ADMINISTRACIÓN:
AGÍTESE ANTES DE USAR
Rinitis Alérgica Estacional
Niños de 2 a 11 años: La dosis recomendada es de 30 mg (5 ml) dos veces al día. En el caso de insuficiencia renal se recomienda comenzar con 30 mg (5 ml) una vez al día.
Urticaria Idiopática Crónica
Niños de 6 meses a 11 años: La dosis recomendada es de 30 mg (5 ml) dos veces al día para pacientes de 2 a 11 años y 15 mg (2,5 ml) dos veces al día para pacientes de 6 meses a 2 años. En el caso de insuficiencia renal se recomienda comenzar con 30 mg (5 ml) una vez al día para pacientes de 2 a 11 años y 15 mg (2,5 ml) una vez al día para pacientes de 6 meses a 2 años.

CONTRAINDICACIONES:
Hipersensibilidad a la Fexofenadina.

PRECAUCIONES:
Interacción con Eritromicina y Ketoconazol: En dos estudios separados la Fexofenadina 120 mg dos veces por día (dos veces la dosis recomendada) fue co-administrada con Eritromicina 500 mg cada 8 horas o Ketoconazol 400 mg una vez por día bajo condiciones de equilibrio dinámico en voluntarios sanos (n=24, cada estudio). No fueron observadas diferencias en los efectos adversos o en el intervalo QTc cuando se administró Fexofenadina sóla o en combinación con Eritromicina o Ketoconazol. Los resultados de estos estudios figuran en la siguiente tabla:

Droga concomitante	Cmáx ss (concentración plasmática pico)	ABCss (0-12h) (extensión de exposición sistémica)
Eritromicina (500 mg cada 8 h)	+ 82%	+109%
Ketoconazol (400 mg una vez por día)	+135%	+164%

Los mecanismos de estas interacciones son desconocidos, y el potencial de interacción con otros agentes antifúngicos imidazólicos o macrólidos no han sido estudiados. Estos cambios en los niveles plasmáticos estaban dentro del rango de los niveles plasmáticos alcanzados en estudios clínicos adecuados y bien controlados. La Fexofenadina no ha tenido efecto sobre la farmacocinética de la Eritromicina o el Ketoconazol.
Interacción con antiácidos: La administración de 120 mg de fexofenadina dentro de los 15 minutos de administración de un antiácido que contenga aluminio y magnesio redujo el AUC de fexofenadina en 41% y la Cmax en un 43%.
Interacción con jugos de frutas: Los jugos de fruta como el de pomelo, naranja y manzana pueden reducir la biodisponibilidad y la exposición de fexofenadina.
Carcinogénesis, mutagénesis, fertilidad: El potencial carcinogénico y la toxicidad reproductiva de la Fexofenadina fueron determinados empleando estudios con Terfenadina que lograron una adecuada exposición de Fexofenadina (basados en valores plasmáticos del área bajo la curva ABC). No fue observada evidencia de carcinogenicidad en ratones y ratas cuando se les administró dosis orales diarias de 50 y 150 mg/kg de Terfenadina durante 18 y 24 meses, respectivamente; estas dosis resultaron en valores plasmáticos (ABC) de Fexofenadina que fueron hasta cuatro veces el valor terapéutico humano (basados en una dosis de 60 mg 2 veces al día de Fexofenadina clorhidrato). Estudios en animales in vivo e in vitro de Fexofenadina no revelaron evidencia de mutagenicidad. En estudios de fertilidad en ratas, se observaron reducciones relacionadas con la dosis en el número de implantes, e incrementos en la pérdida postimplantación a dosis orales iguales o mayores que 150 mg/kg de Terfenadina; estas dosis produjeron valores plasmáticos de ABC de Fexofenadina que fueron iguales o mayores a tres veces el valor terapéutico humano (basado sobre una dosis de 60 mg de Fexofenadina dos veces por día).
Embarazo: Categoría C. No hay estudios bien controlados en mujeres embarazadas. Debido a que los estudios en animales no siempre son predictivos de la respuesta en humanos, esta droga será usada durante el embarazo sólo en casos donde el médico determine que el beneficio supera al riesgo para el feto.
Lactancia: Se desconoce si la Fexofenadina o sus metabolitos son excretados por la leche humana. Por lo tanto no es aconsejable recomendar su uso en mujeres que se encuentren en el período de lactancia.

Uso pediátrico: La seguridad y efectividad de la Fexofenadina no ha sido establecida en menores de 6 meses.

EFECTOS ADVERSOS:
Rinitis Alérgica Estacional
Adultos: En estudios clínicos controlados con placebo que incluyeron 2.461 pacientes con rinitis alérgica estacional que recibieron Fexofenadina clorhidrato a dosis de 20 mg a 240 mg dos veces por día, los efectos adversos fueron similares en pacientes tratados con Fexofenadina clorhidrato y placebo. La incidencia de efectos adversos, incluyendo somnolencia, no fue dosis dependiente y fue similar a través de los subgrupos definidos por edad, sexo y raza. El porcentaje de pacientes que abandonaron prematuramente el tratamiento debido a los efectos adversos fue del 2,2% con Fexofenadina clorhidrato y 3,3% con placebo.
• Efectos adversos reportados por más del 1% de los pacientes que recibieron la dosis diaria recomendada de Fexofenadina (60 mg dos veces por día), y que fueron más comunes con la Fexofenadina que con el placebo:

Efecto adverso	Fexofenadina 60 mg Dos veces por día n=679	Placebo Dos veces por día n=671
Infección viral (resfrío, gripe)	2,5%	1,5%
Náuseas	1,6%	1,5%
Dismenorrea	1,5%	0,3%
Somnolencia	1,3%	0,9%
Dispepsia	1,3%	0,6%
Fatiga	1,3%	0,9%

• Efectos adversos reportados por más del 1% de los pacientes que recibieron la dosis diaria recomendada de Fexofenadina (60 mg dos veces por día), y que fueron más comunes con el placebo que con Fexofenadina: Cefalea, dolor de espalda e irritación de garganta.
Pediátricos: La siguiente tabla incluye los eventos adversos en pacientes de 6 a 11 años de edad que fueron informados por más del 2% de los pacientes tratados con comprimidos de fexofenadina clorhidrato a una dosis de 30 mg dos veces por día en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo, que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Efecto adverso	Fexofenadina 30 mg Dos veces por día n=209	Placebo Dos veces por día n=229
Cefalea	7.2%	6.6%
Lesión accidental	2.9%	1.3%
Tos	3.8%	1.3%
Fiebre	2.4%	0.9%
Dolor	2.4%	0.4%
Otitis media	2.4%	0.0%
Infección del tracto respiratorio superior	4.3%	1.7%

En la siguiente tabla se incluyen los eventos adversos, con una incidencia superior al 2%, informados en pacientes de 6 meses a 5 años de edad en 3 estudios abiertos farmacocinéticas de dosis única y dosis múltiples y 3 estudios de seguridad con control de placebo con cápsulas de fexofenadina clorhidrato (484 pacientes) y suspensión (50 pacientes) a dosis de 15 mg (108 pacientes) y 30 mg (426 pacientes) administrados dos veces por día.

Efecto adverso	Fexofenadina 15 mg Dos veces por día n=108	Fexofenadina 30 mg Dos veces por día n=426	Total n=534	Placebo Dos veces por día n=430
Vómitos	12.0%	4.2%	5.8%	8.6%
Pirexia	1.9%	4.5%	3.9%	7.0%
Tos	1.9%	4.0%	3.6%	3.3%
Otitis media	2.8%	3.8%	3.6%	3.3%
Diarrea	3.7%	2.8%	3.0%	2.6%
Rinorrea	0.9%	2.1%	1.9%	0.9%
Infección del tracto respi-ratorio superior	0.9%	2.1%	1.9%	4.0%
Somnolencia	2.8%	0.7%	1.1%	0.2%

Urticaria Idiopática Crónica: Los eventos adversos informados por pacientes mayores de 12 años en estudios de urticaria idiopática crónica, controlados con placebo, fueron similares a los informados en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo. En ensayos clínicos de urticaria idiopática crónica controlados con placebo, que incluyeron a 726 pacientes mayores de 12 años de edad que recibieron comprimidos de fexofenadina clorhidrato a dosis de 20 a 240 mg dos veces por día, los eventos adversos fueron similares en los pacientes tratados con fexofenadina clorhidrato y con placebo. La siguiente tabla incluye los eventos adversos en pacientes mayores de 12 años que fueron informadas por más del 2% de los pacientes tratados con comprimidos de fexofenadina clorhidrato 60 mg dos veces por día en estudios clínicos controlados y que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Efecto adverso	Fexofenadina 60 mg Dos veces por día n=191	Placebo Dos veces por día n=183
Dispepsia	4.7%	4.4%
Mialgia	2.6%	2.2%
Dolor de espalda	2.1%	1.1%
Vértigo	2.1%	1.1%
Dolor en las extremidades	2.1%	0.0%

En un estudio clínico controlado con placebo que incluyó 167 pacientes mayores de 12 años que recibieron comprimidos de fexofenadina clorhidrato 180 mg, los eventos adversos fueron similares en los pacientes tratados con fexofenadina clorhidrato y placebo. La siguiente tabla también incluye los eventos adversos que fueron informados por más del 2% de los pacientes tratados con comprimidos de fexofenadina clorhidrato a dosis de 180 mg una vez por día y que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Efecto adverso	Fexofenadina 180 mg Dos veces por día n=167	Placebo Dos veces por día n=92
Cefalea	4.8%	3.3%
Nasofaringitis	2.4%	2.2%
Infección del tracto respiratorio superior	2.4%	2.2%

La seguridad de fexofenadina clorhidrato en el tratamiento de la urticaria idiopática crónica en los pacientes pediátricos de 6 meses a 11 años de edad se basa en el perfil de seguridad de fexofenadina clorhidrato en los pacientes adultos y pediátricos a dosis iguales o superiores a la dosis recomendada.

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

Hospital de Niños R. Gutiérrez:(011) 4962-6666 / 2247
Hospital A. Posadas: (011) 4654-6648 / 4658-7777
Hospital de Pediatría Dr. Garrahan: (011) 4941-8650
Hospital de Clínicas Gral. San Martín: (011)4961-6001

El tratamiento es esencialmente sintomático y de soporte.
Luego de una cuidadosa evaluación clínica del paciente, de la valoración del tiempo transcurrido desde la ingesta y de la cantidad ingerida, el profesional decidirá la realización o no del tratamiento general de rescate: Vómito provocado o lavado gástrico. Carbón activado. Purgante salino.
La hemodiálisis no elimina efectivamente la Fexofenadina de la sangre.

PRESENTACIÓN:
ALERFEDINE® suspensión oral: Envases conteniendo 100 y 150 mL

CONSERVACIÓN:
Mantener lejos del calor y la luz solar directa. Conservar a una temperatura entre 15º C y 30º C.

MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS

E.M.A.M.S. Certificado N° 47.419

LAZAR
Dr. LAZAR y Cía. S.A.Q. e I.
Av. Vélez Sarsfield 5853/5855
B1605EPI Munro, Pcia. de Buenos Aires
D.T.: Daniela A. Casas,Farm. y Bioq.
En Ecuador: RS N° 2100-MEE-0516

Ultima revisión del prospecto: 24/08/2009

36499/2
P241