

DESALEX® 5 mg TABLETAS RECUBIERTAS

(Desloratadina)

DESALEX® 5 mg TABLETAS ORODISPERSABLES

(Desloratadina)

DESALEX® 0,5 mg/mL JARABE

(Desloratadina)

DESALEX® 0,25 mg/ 0,5 mL SOLUCIÓN GOTAS

(Desloratadina)

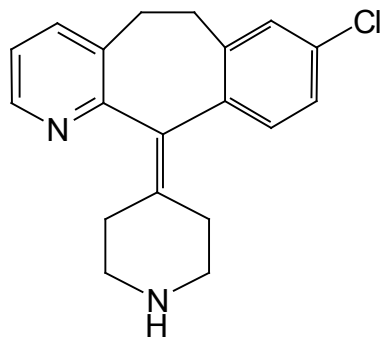
1 DESCRIPCIÓN DEL PRODUCTO

Desalex 5 mg tabletas recubiertas, Desalex 0,5 mg/mL jarabe, Desalex 0,25 mg/0,5 mL solución gotas y Desalex 5 mg tabletas orodispersables contienen desloratadina (SCH 34117; Figura), un antihistamínico no sedante con actividad selectiva antagonista de los receptores H₁ periféricos. Desloratadina se usa actualmente o está en desarrollo para el alivio de los síntomas asociados con la rinitis alérgica estacional y perenne, urticaria y otros trastornos dermatológicos

1.1 SUSTANCIA ACTIVA

Desloratadina es un polvo blanco a blancuzco ligeramente soluble en agua, pero muy soluble en etanol, propilenglicol, cloruro de metileno, metanol y octanol. Tiene una fórmula empírica: C₁₉H₁₉ClN₂ y peso molecular de 310,8. El nombre químico es 8-cloro-6,11-dihidro-11-(4-piperidiniliden)-5H-benzo-[5,6]ciclohepta [1,2-b]piridina y tiene la siguiente fórmula estructural:

FIGURA: DESLORATADINA (SCH 34117)



1.2 PRODUCTO FARMACÉUTICO

1.2.1 Desalex 5 mg tabletas recubiertas

1.2.1.1 Composición

Desalex tabletas recubiertas contiene 5 mg de desloratadina.

1.2.2 Desalex 0,5 mg/mL jarabe

1.2.2.1 Composición

Desalex jarabe contiene 0,5 mg de desloratadina, 100 mg de propilenglicol, sacarosa 490 mg, solución de sorbitol al 70% 150 mg.

1.2.3 Desalex 0,25 mg/ 0,5 mL solución gotas

1.2.3.1 Composición

Desalex solución gotas contiene 0,5 mg de desloratadina; 100 mg de propilenglicol; 150 mg de solución de sorbitol; 0,50 mg de sucralosa.

1.2.4 Desalex 5 mg tabletas orodispersables

1.2.4.1 Composición

Desalex tabletas orodispersables contiene 5 mg de desloratadina; 86,46 mg de manitol; 5,10 mg de aspartame.

2 INFORMACIÓN PRECLÍNICA

2.1 PROPIEDADES FARMACODINÁMICAS

Desloratadina, el ingrediente activo en Desalex tabletas recubiertas, jarabe, solución gotas y tabletas orodispersables, es un antihistamínico con actividad antagonista selectiva de los receptores H₁ periféricos.

Además de la actividad antihistamínica, desloratadina ha exhibido actividad antialérgica en estudios *in vitro* (efectuados en células humanas) y *en estudios in vivo*. Estos estudios han demostrado que desloratadina puede inhibir eventos en la cascada de inflamación alérgica, incluyendo:

- liberación de citoquinas inflamatorias en particular IL-4, IL-6, IL-8, IL-13 de mastocitos/basófilos humanos
- expresión de moléculas de adhesión, como la P-selectina

- inhibición de la tos alérgica en modelos animales

2.2 ESTUDIOS PRECLÍNICOS

Desloratadina es el metabolito activo primario de loratadina. Los datos preclínicos con desloratadina no revelan riesgos especiales para los humanos según los estudios de genotoxicidad, potencial carcinogénico y toxicidad para la reproducción.

No se observó un efecto irritante local significativo cuando se examinó Desalex tabletas orodispersables en el ensayo de irritación bucal en la bolsa de la mejilla de hámster.

3 FARMACOLOGÍA CLÍNICA

3.1 PROPIEDADES FARMACOCINÉTICAS

Desloratadina es bien absorbida, alcanzando la concentración máxima después de aproximadamente 3 horas; la vida media de eliminación terminal es de aproximadamente 27 horas. El grado de acumulación de desloratadina es consistente con su vida media y una frecuencia de dosificación una vez al día. La biodisponibilidad de desloratadina es proporcional a la dosis en el rango de 5 mg a 20 mg.

Desloratadina se une moderadamente (82-88%) a las proteínas plasmáticas.

Desloratadina es metabolizada ampliamente a 3-hidroxi desloratadina, un metabolito activo, que es glucuronizado subsecuentemente. Un estudio de balance de masa en humanos documentó una recuperación de aproximadamente 87% de la dosis de ¹⁴C-desloratadina, que se distribuyó por igual en la orina y las heces como productos metabólicos.

El perfil farmacocinético de desloratadina es similar en voluntarios adultos sanos y en voluntarios geriátricos sanos y no se requiere ajuste de la dosis.

En ensayos de dosis única de desloratadina tabletas (7,5 mg), jarabe (5 mg) o tabletas orodispersables (5 mg), no hubo efecto de los alimentos sobre la disposición de desloratadina. En otro estudio, el jugo de toronja no afectó la disponibilidad de desloratadina.

A dosis única, estudios cruzados de desloratadina, encontraron que las formulaciones en tabletas, jarabe y tabletas orodispersables son bioequivalentes.

3.2 PROPIEDADES FARMACODINÁMICAS

En un programa clínico, desloratadina exhibió seguridad y eficacia en el tratamiento de los síntomas asociados con la rinitis alérgica. Además, la seguridad y la eficacia de desloratadina también se demostraron en el tratamiento de los síntomas de la urticaria crónica idiopática y otros trastornos dermatológicos.

En un estudio en el cual la desloratadina se administró a una dosis de 45 mg al día (nueve veces la dosis clínica) por diez días, no se observó prolongación del intervalo QTc.

Desloratadina no penetra rápidamente en el sistema nervioso central. A la dosis recomendada de 5 mg diarios para adultos y adolescentes, no hubo exceso de incidencia de somnolencia en comparación con placebo. Desloratadina administrada a una dosis diaria única de 7,5 mg a adultos y adolescentes no afectó el desempeño psicomotor en los estudios clínicos, ni una dosis única diaria de 5 mg en adultos afectó las mediciones estándares del desempeño del vuelo en condiciones de vuelo simulado. La influencia de desloratadina sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas es nula o insignificante.

No se observaron cambios clínicamente relevantes en las concentraciones plasmáticas de desloratadina en ensayos de dosis múltiples de interacción con azitromicina, ketoconazol, eritromicina, fluoxetina o cimetidina.

4 INDICACIONES Y USO

4.1 INDICACIONES TERAPÉUTICAS

Desalex tabletas recubiertas, jarabe, solución gotas y tabletas orodispersables están indicados para el tratamiento de los síntomas asociados con rinitis alérgica estacional con asma concomitante y rinitis alérgica perenne, urticaria, urticaria idiopática crónica y otros trastornos dermatológicos alérgicos tales como dermatitis atópica.

5 INFORMACIÓN BÁSICA CORPORATIVA DE SEGURIDAD

5.1 CONTRAINDICACIONES

Desloratadina está contraindicada en pacientes con hipersensibilidad a este medicamento o a alguno de sus ingredientes o a loratadina, glaucoma, estenosis pilórica, retención urinaria, enfermedades cardíacas congénitas, hipertensión arterial, insuficiencia hepática, hipertiroidismo y diabetes mellitus.

No administrar en niños menores de 6 meses de edad.

5.2 ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

No se observaron efectos teratogénicos en estudios en animales con desloratadina (ver Sección 2.2). Dado que no hay datos clínicos disponibles sobre la exposición durante el embarazo con desloratadina, no se ha establecido el uso seguro de desloratadina durante el embarazo. Desalex no se debe usar durante el embarazo a menos que los beneficios potenciales superen los riesgos. Desloratadina se excreta en la leche materna; por lo tanto, desloratadina no se debe usar durante la lactancia a menos que los beneficios potenciales superen los riesgos.

Desloratadina no mostró efectos mutagénicos *in vitro* y en estudios de mutagenicidad *in vivo*.

La desloratadina debe administrarse con precaución en pacientes con antecedentes médicos o familiares de convulsiones. En particular, los niños pueden ser más susceptibles a desarrollar nuevas convulsiones bajo tratamiento con desloratadina. Los prescriptores pueden considerar el abandono de la desloratadina en pacientes que experimentan una convulsión durante el tratamiento.

Pacientes con trastornos del funcionalismo hepático y/o renal.

Pacientes que reciben terapia concomitante con antibióticos macrólidos y/o derivados de imidazol.

Desalex solución gotas y jarabe:

Estos productos contienen propilenglicol en sus excipientes, el cual en dosis altas y por tiempo prolongado tiene efectos depresores del sistema nervioso central, cardiovascular y hemolítico.

Desalex solución gotas, jarabe y tabletas orodispersables:

Estos productos contienen sacarosa, sucralosa, sorbitol y manitol adminístrese con precaución en pacientes diabéticos.

Estos productos no deben administrarse en pacientes con intolerancia a la sacarosa, sucralosa, sorbitol y manitol.

Desalex tabletas orodispersables:

Este producto contiene aspartame, adminístrese con precaución en pacientes fenilcetonúricos.

5.3

EFFECTOS ADVERSOS

A la dosis recomendada de 5 mg, los eventos adversos reportados con una incidencia mayor que con placebo fueron boca seca, fatiga y cefalea.

Se han reportado casos muy raros de reacciones de hipersensibilidad, incluyendo anafilaxia y erupción, durante la comercialización de desloratadina. Adicionalmente, también se han reportado muy raramente casos de taquicardia, palpitaciones, convulsiones, hiperactividad psicomotora, somnolencia, elevación de enzimas hepáticas y de bilirrubina, hepatitis e incremento del apetito han sido reportados.

También se reportaron mareos, astenia, incoordinación, visión borrosa, euforia, temblores, estreñimiento, diarrea, vómitos, náuseas, anorexia, insomnio, xeroftalmia, tinnitus e hipotensión.

5.4

ABUSO Y DEPENDENCIA DE DROGAS

No hay información que indique la ocurrencia de abuso o dependencia con desloratadina tabletas.

5.5 SOBREDOSIS

En caso de sobredosis, considere las medidas estándares para remover el principio activo no absorbido. Se recomienda tratamiento sintomático y de soporte. Desloratadina no se elimina por hemodiálisis.

5.6 INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS

No se observaron interacciones relevantes con desloratadina en ensayos clínicos en los que azitromicina, eritromicina, ketoconazol, fluoxetina o cimetidina se administraron concomitantemente. No hubo efecto de los alimentos o el jugo de toronja en la disponibilidad de desloratadina (Ver Sección 3.2).

Alcohol etílico, antidepresivos tricíclicos, barbitúricos y otros depresores del sistema nervioso central.

5.7 INTERFERENCIA CON LAS PRUEBAS DE LABORATORIO

Ninguna identificada.

5.8 OTRA INFORMACIÓN RELEVANTE DE SEGURIDAD

Ninguna.

6 POSOLOGÍA Y ADMINISTRACIÓN

Adultos y niños mayores de 12 años de edad: una tableta recubierta de Desalex 5 mg, o 5 mg de Desalex Tabletas orodispersables, o 10 mL (5 mg) de jarabe o solución gotas una vez al día, con o sin alimentos.

Las tabletas orodispersables se deben colocar en la lengua. La desintegración de la tableta ocurre rápidamente. Administrar con o sin agua

Niños de 6 a 11 años de edad: 5 mL (2,5 mg) de desloratadina jarabe o solución gotas una vez al día con o sin alimentos.

Niños de 2 a 5 años de edad: 2,5 mL (1,25 mg) de desloratadina jarabe o solución gotas una vez al día con o sin alimentos.

Niños de 6 meses a 1 año de edad: 2 mL (1 mg) de desloratadina jarabe o solución gotas una vez al día con o sin alimentos.

7 INFORMACIÓN LOCAL

Desalex 5 mg Tabletas Recubiertas E.F.31.310/17

Desalex 5 mg Tabletas Orodispersables E.F.39.546/12

Desalex 0,5 mg/mL Jarabe E.F.32.938/11

Desalex 0,25 mg/ 0,5 mL Solución Gotas E.F.37.490/15



RIF. J-30623432-2