

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 exhibieron efectos sobre la disposición del fármaco. En otro estudio, el jugo de pomelo no tuvo efecto sobre la disposición de 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 comparables del área bajo la curva (AUC) y la concentración máxima (C) máx de desloratadina a los encontrados en los adultos que recibieron una dosis de 5 mg de jarabe de desloratadina.

Sobredosis

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 hemodiálisis; se desconoce si la droga se elimina por diálisis peritoneal.

Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al Hospital más cercano ó comunicarse con el C.I.A.T. - Tel.: 1722.

Presentaciones

Comprimidos recubiertos:

Envases conteniendo 10 y 30 comprimidos recubiertos.

Solución (Jarabe):

Envase conteniendo 50 mL. Incluye dosificador graduado.

Conservación

Conservar a temperatura ambiente, entre 15°C y 30 °C.



LAZAR S.A.
Blvr. Artigas 1158
Tel.: 2708 8494
MONTEVIDEO

MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS.

27092021

DELORAT®

Desloratadina

Comprimidos recubiertos - Solución (Jarabe)



Composición

Cada comprimido recubierto contiene:

Desloratadina 5,0 mg. Excipientes c.s.p. 1 comprimido recubierto.

Cada 100 mL de jarabe contiene:

Desloratadina 50,0 mg. Excipientes c.s.p. 100 mL.

Acción Terapéutica

Antihistamínico.

Indicaciones

Delorat está indicado para el alivio de los síntomas asociados con:

- Rinitis alérgica.
- Urticaria.

Posología y forma de administración

Vía oral

. Comprimidos:

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

La ranura de los comprimidos no debe ser usada a los efectos de subdividir la dosis sino para facilitar la deglución.

. Jarabe:

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

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

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

Incluye dosificador graduado.

Contraindicaciones

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

Precauciones y Advertencias

No se ha establecido la eficacia y seguridad de Delorat comprimidos en niños menores de 12 años de edad.

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

Convulsiones: 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.

Consideraciones respecto al contenido de sorbitol en Delorat jarabe: Sorbitol por vía oral

puede afectar la biodisponibilidad de otros medicamentos. Pacientes con intolerancia hereditaria a la fructosa no deben tomar este medicamento. Efecto aditivo con otros medicamentos que contienen sorbitol en su formulación.

Efectos sobre la capacidad para conducir vehículos y utilizar maquinarias

En ensayos clínicos que evaluaron la capacidad para conducir, no se produjo disminución de la misma en los pacientes que recibieron desloratadina. No obstante, se deberá informar a los pacientes que muy raramente, algunas personas experimentan somnolencia, que puede afectar a su capacidad para conducir o utilizar máquinas.

Interacciones farmacológicas

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

En un ensayo de farmacología clínica, desloratadina tomado de forma concomitante con alcohol no potenció los efectos deteriorantes del alcohol sobre el comportamiento.

Considerando los reportes post-comercialización, se recomienda precaución si se utiliza en forma concomitante con alcohol.

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.

Reacciones Adversas

En ensayos clínicos en un intervalo de indicaciones que incluyen rinitis alérgica y urticaria idiopática crónica, a la dosis recomendada de 5 mg diarios, 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 %). En un ensayo clínico con 578 pacientes adolescentes, de 12 a 17 años de edad, la reacción adversa más frecuente fue la cefalea; que se produjo en el 5,9 % de los pacientes tratados con desloratadina y en el 6,9 % de los pacientes que recibieron placebo. En la siguiente tabla se presentan otras reacciones adversas notificadas durante el período de postcomercialización.

| | |
|---|---|
| Trastornos del metabolismo y de la nutrición | Frecuencia no conocida: aumento del apetito. |
| Trastornos psiquiátricos | Muy rara: Alucinaciones. Frecuencia no conocida: comportamiento anormal, agresión. |
| Trastornos del sistema nervioso | Muy rara: Mareo, somnolencia, insomnio, hiperactividad psicomotora, crisis convulsivas. |
| Trastornos cardíacos | Muy rara: Taquicardia, palpitaciones Frecuencia no conocida: QT prolongado. |
| Trastornos gastrointestinales | Muy rara: Dolor abdominal, náuseas, vómitos, dispepsia, diarrea. |
| Trastornos hepatobiliares | Muy rara: Elevaciones de enzimas hepáticas, aumento de la bilirubina, hepatitis. |
| Trastornos musculoesqueléticos y del tejido conjuntivo | Muy rara: Mialgia. |
| Trastornos generales | Muy rara: Reacciones de hipersensibilidad (tales como anafilaxia, angioedema, disnea, prurito, rash y urticaria). |
| Exploraciones complementarias | Frecuencia no conocida: aumento de peso. |

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

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 sustancia 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 sobre las células endoteliales. La importancia clínica de estas observaciones debe ser confirmada.

Farmacocinética

Es posible detectar concentraciones plasmáticas de desloratadina dentro de 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