

ALERFEDINE® 120
FEXOFENADINA HCl
Comprimidos recubiertos

Industria Argentina
Venta bajo receta

Fórmula

Cada comprimido recubierto de 120 mg contiene:
Fexofenadina clorhidrato..... 120,00 mg
Excipientes..... c.s.

Indicaciones terapéuticas

Fexofenadina clorhidrato 120 mg está indicada en adultos y adolescentes de 12 años o mayores para el alivio de los síntomas asociados a la rinitis alérgica estacional.

Posología y forma de administración

Uso oral

Adultos

La dosis recomendada de fexofenadina clorhidrato para adultos es de 120 mg una vez al día administrada antes de una comida.

Población pediátrica

- **Adolescentes de 12 años y mayores**

La dosis recomendada de fexofenadina clorhidrato para adolescentes de 12 años o mayores es de 120 mg una vez al día administrada antes de una comida.

- **Niños menores de 12 años**

Fexofenadina clorhidrato no se recomienda en niños menores de 12 años debido a la falta de datos de seguridad y eficacia.

Poblaciones especiales

Los estudios en grupos de riesgo especiales (ancianos o pacientes con trastornos renales o hepáticos) indican que no es necesario ajustar la dosis de fexofenadina clorhidrato en estos pacientes.

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

Contraindicaciones

Hipersensibilidad al principio activo o a alguno de los excipientes.

Advertencias y precauciones especiales de empleo

Como ocurre con la mayoría de los nuevos medicamentos, solo están disponibles datos limitados referidos a la administración en ancianos y en pacientes con trastornos renales o hepáticos. Fexofenadina clorhidrato debe administrarse con precaución en estos grupos de pacientes. Los pacientes con antecedentes o enfermedad cardiovascular en curso deberán ser advertidos de que los medicamentos clasificados como antihistamínicos se han asociado con los siguientes efectos adversos: taquicardia y palpitaciones.

Interacción con otros medicamentos y otras formas de interacción

La fexofenadina no se biotransforma por vía hepática, y por lo tanto no interacciona con otros medicamentos que se metabolizan a través de mecanismos hepáticos. La administración concomitante de fexofenadina con eritromicina o ketoconazol aumenta 2-3 veces el nivel de fexofenadina en plasma. Los cambios no están acompañados por cualquier tipo de efectos en el intervalo QT y no se han asociado con ningún incremento en los efectos adversos comparado con el medicamento utilizado sólo.

Los estudios en animales han demostrado que el aumento en los niveles de plasma de fexofenadina observados tras la coadministración de eritromicina o ketoconazol, parecen deberse a un aumento de la absorción gastrointestinal y también a una disminución en la excreción biliar o secreción

gastrointestinal respectivamente.

No se ha observado interacción entre Fexofenadina y omeprazol. Sin embargo, la administración de un antiácido que contenga geles de hidróxidos de aluminio y magnesio 15 minutos antes de la toma de fexofenadina, causó una reducción en la biodisponibilidad de la fexofenadina, probablemente debida a su unión en el tracto gastrointestinal. Es aconsejable dejar 2 horas entre la administración de fexofenadina y antiácidos que contengan hidróxido de aluminio y magnesio.

Fertilidad, embarazo y lactancia

Embarazo

No existen datos disponibles sobre el uso de fexofenadina en mujeres embarazadas.

Los limitados estudios realizados en animales no indican ningún daño directo o indirecto sobre el embarazo, el desarrollo embrionario/fetal, el parto o el desarrollo postnatal. La fexofenadina no debe utilizarse durante el embarazo si no es claramente necesario.

Lactancia

No hay datos sobre el contenido en leche materna después de administrar fexofenadina.

Sin embargo, cuando se administró terfenadina a madres lactantes se pudo comprobar que la fexofenadina pasaba a la leche materna. Por lo tanto, no se recomienda administrar fexofenadina a madres en período de lactancia.

Fertilidad

No existen datos disponibles sobre los efectos de fexofenadina en la fertilidad humana.

No hubo pruebas de deterioro de la fertilidad en ratones a los que se administró fexofenadina.

Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

Basándose en el perfil farmacodinámico y en los efectos adversos es casi imposible que fexofenadina comprimidos produzca efectos sobre la capacidad para conducir o utilizar máquinas. En estudios objetivos, la fexofenadina ha demostrado que no tiene efectos significativos en la función del sistema nervioso central. Esto quiere decir que los pacientes pueden conducir y realizar tareas que requieran concentración. Sin embargo, a fin de identificar a aquellos pacientes sensibles que tengan una reacción inusual a los medicamentos, se recomienda evaluar la respuesta individual antes de conducir o realizar tareas complejas.

Reacciones adversas

Se ha utilizado el siguiente convenio de clasificación de frecuencias, cuando ha sido preciso:

Muy frecuentes $\geq 1/10$; Frecuentes $\geq 1/100$ a $< 1/10$; Poco frecuentes $\geq 1/1.000$ a $\leq 1/100$; Raras $\geq 1/10.000$ a $\leq 1/1.000$; Muy raras $< 1/10.000$ y Frecuencia no conocida (no puede estimarse a partir de los datos disponibles).

Dentro de cada grupo de frecuencia las reacciones adversas se muestran en orden decreciente de gravedad.

En los ensayos clínicos en adultos se han comunicado las siguientes reacciones adversas con una incidencia similar a la observada con placebo:

Trastornos del sistema nervioso

Frecuentes: cefalea, somnolencia, mareo.

Trastornos gastrointestinales

Frecuentes: náuseas.

Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración

Poco frecuentes: fatiga.

Las siguientes reacciones adversas se han comunicado en adultos en la vigilancia post-autorización. La frecuencia con la que se producen no se conoce (no puede estimarse a partir de los datos disponibles):

Trastornos del sistema inmunológico

Reacciones de hipersensibilidad con manifestaciones como angioedema, opresión en el pecho, disnea, sofocos y anafilaxis sistémica.

Trastornos psiquiátricos

Insomnio, nerviosismo, trastornos del sueño o pesadillas/-

sueños excesivos (paranoia).
Trastornos cardíacos
Taquicardia, palpitaciones.
Trastornos gastrointestinales
Diarrea.
Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo
Erupción, urticaria, prurito.

Sobredosis

Se han comunicado casos de mareo, somnolencia, fatiga y sequedad de boca por sobredosis con fexofenadina. Se han administrado dosis únicas de hasta 800 mg, y dosis de hasta 600mg dos veces al día, durante un mes o 240mg una vez al día durante un año a adultos sanos sin el desarrollo de efectos adversos clínicamente significativos en comparación con placebo. La dosis máxima tolerada de fexofenadina no ha sido establecida.
Se deben practicar las medidas habituales para eliminar el fármaco no absorbido. Se recomienda tratamiento sintomático y de soporte. La hemodíalisis no elimina eficazmente la fexofenadina de la sangre.
No se conoce un antídoto específico.

PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

Propiedades farmacodinámicas

Grupo farmacoterapéutico: Otros antihistamínicos para uso sistémico, código ATC: R06A X26.

Mecanismo de acción

El clorhidrato de fexofenadina es un antihistamínico H1 no sedante. Es un metabolito farmacológicamente activo de terfenadina.

Eficacia Clínica y seguridad

Los estudios de reacción alérgica en humanos tras dosis únicas y dos veces al día de fexofenadina demostraron que el medicamento muestra un efecto antihistamínico que se inicia en una hora, llega a un máximo a las 6 horas y permanece durante 24 horas. No hay pruebas de desarrollo de tolerancia a estos efectos tras 28 días de dosificación. Se ha encontrado que existe una relación dosis-respuesta positiva con dosis de 10 mg a 130 mg administradas por vía oral. En este modelo de actividad antihistamínica, se ha encontrado que se requieren dosis de al menos 130 mg para conseguir un efecto consistente que se mantenga durante un período de 24 horas. La inhibición máxima en las áreas dérmicas de pápula y eritema fue superior al 80%.

Los estudios clínicos realizados para la rinitis alérgica estacional han mostrado que una dosis de 120 mg es suficiente para una eficacia de 24 horas.

No se observaron cambios en el intervalo QT c en los pacientes con rinitis alérgica estacional a los que se administró 240mg de fexofenadina clorhidrato, dos veces al día, durante 2 semanas, en comparación con placebo. Tampoco se observaron cambios significativos del intervalo QT c en voluntarios sanos tratados con 60mg como máximo de fexofenadina dos veces al día durante 6 meses, 400mg, dos veces al día, durante 6,5 días y 240mg, una vez al día durante un año, en comparación con placebo. Fexofenadina a concentraciones 32 veces mayores que el nivel terapéutico en el hombre no afectó al rectificador retrasado del canal de K⁺ clonado procedente de corazón humano.

Fexofenadina clorhidrato (5-10 mg/kg por vía oral) inhibió el broncoespasmo inducido por antígeno en cobayas sensibilizadas e inhibió la liberación de histamina a concentraciones supratrapéuticas (10-100 µM) en mastocitos peritoneales.

Propiedades farmacocinéticas

Absorción: Fexofenadina clorhidrato se absorbe rápidamente en el organismo tras la administración oral con una T_{max} que se alcanza aproximadamente 1-3 horas después de la dosis. El valor medio de la C_{max} fue aproximadamente de 427ng/ml tras la administración de una dosis diaria única de 120 mg.

Distribución: Fexofenadina se encuentra unida a proteínas plasmáticas en un 60-70%.

Metabolismo o Biotransformación: La fexofenadina solo se metaboliza hasta un grado limitado (por vía hepática

o no hepática), y fue el único compuesto importante identificado en orina y heces de animales y humanos. El perfil de concentración plasmática de fexofenadina sigue una disminución biexponencial con una semivida de eliminación terminal que oscila entre 11 y 15 horas tras la administración múltiple. La farmacocinética de las dosis única y múltiple de fexofenadina es lineal para dosis orales de hasta 120 mg, dos veces al día. A dosis de 240 mg dos veces al día, se produce un aumento ligeramente mayor (8,8%) que el incremento proporcional en el área bajo la curva del estado estacionario, lo que podría indicar que la farmacocinética de la fexofenadina es prácticamente lineal a dosis entre 40 mg y 240 mg tomados diariamente. Se cree que la principal vía de eliminación es la excreción biliar, mientras que hasta un 10% de la dosis administrada se excreta inalterada en la orina.

Datos preclínicos sobre seguridad: Los perros toleraron dosis de 450 mg/kg administrados dos veces al día durante 6 meses y no mostraron signos de toxicidad, a excepción de vómitos ocasionales. En las necropsias practicadas en perros y roedores no se observaron hallazgos anatómicos evidentes relacionados con el tratamiento.

Los estudios de distribución en tejidos de rata con fexofenadina clorhidrato marcada radioactivamente indicaron que no atraviesa la barrera hematoencefálica. En estudios de mutagenicidad in vitro e in vivo se encontró que la fexofenadina no era mutagénica.

El potencial carcinogénico de la fexofenadina clorhidrato se evaluó usando ensayos de terfenadina con test farmacocinéticos de apoyo que mostraban la exposición a fexofenadina (basada en los valores AUC plasmáticos). No se observó evidencia de carcinogenicidad en ratas ni en ratones tratados con terfenadina (hasta 150 mg/kg/día).

En un estudio de toxicidad sobre la reproducción en ratones, fexofenadina clorhidrato no afectó a la fertilidad, no produjo teratogenia y no alteró el desarrollo pre y posnatal.

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

Presentaciones

Alerfedine® 120 comprimidos recubiertos: Envases conteniendo 10 y 30 comprimidos recubiertos.

Conservación

Mantener lejos del calor y la luz solar directa. Conservar a una temperatura entre 15 y 30°C, en lugar seco.

MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS

Especialidad Medicinal autorizada por el
Ministerio de Salud. 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

Directora Técnica: Daniela A. Casas,

Farmacéutica y Bioquímica.

36513/1
P366