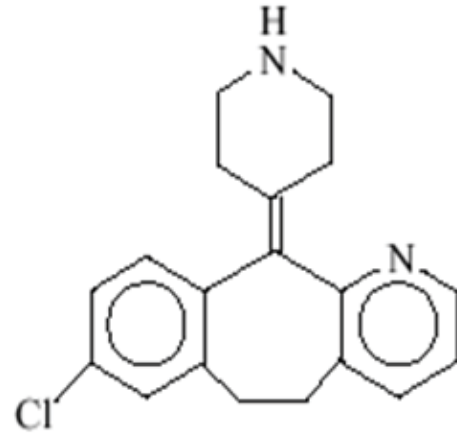


QUÍMICA DEL PRINCIPIO ACTIVO: Desloratadina 5 mg	
NOMBRE QUÍMICO: 8-chloro-6,11-dihydro-11-(4-piperidinylidene)-5H-benzo[5,6]cyclohepta[1,2-b]pyridine.	
FÓRMULA: C ₁₉ H ₁₉ ClN ₂	PESO MOLECULAR: 310.82 [g/mol]
SINÓNIMOS: Desloratadina Descarboetoxiloratadina	
ASPECTO DE LA SUSTANCIA: Polvo color blanco	
SOLUBILIDAD: Ligeramente soluble en agua, muy soluble en etanol, propilenglicol	



Descripción:

Losiral® es desloratadina, un antihistamínico activo por vía oral. Es un polvo blanco-transparente que es ligeramente soluble en agua, pero muy soluble en etanol y propilenglicol. Su fórmula empírica es C₁₉H₁₉ClN₂ y su peso molecular de 310,8.

Farmacología clínica:

Mecanismo de acción:

La desloratadina es un antagonista selectivo de acción prolongada de la histamina con actividad antagonista sobre los receptores H₁. Los datos de unión al receptor indican que una concentración de 2-3 ng/ml de desloratadina muestra una interacción significativa con el receptor de histamina H₁ humano. La desloratadina inhibe la liberación de histamina de los mastocitos humanos in vitro. Estudios en animales de laboratorio han demostrado que la desloratadina no cruza la barrera hematoencefálica.

Farmacodinamia:

La desloratadina muestra un efecto antihistamínico al cabo de 1 hora y su actividad persiste más de 24 horas.

Farmacocinética:

Absorción: Después de la administración oral el tiempo para la concentración plasmática máxima (T_{max}) es de aproximadamente 3 horas. Ni los alimentos ni el jugo de frutas tienen efectos sobre la biodisponibilidad de la desloratadina.

Distribución: La desloratadina y la 3-hidroxidesloratadina se unen a proteínas del plasma entre un 82-85% y un 85-89% respectivamente. La unión a proteínas plasmáticas no se altera en pacientes con trastornos de la función renal.

Metabolismo: La desloratadina (un metabolito mayor de la loratadina) se metaboliza extensivamente a 3-hidroxidesloratadina, un metabolito activo, que es posteriormente glucuronizado. La enzima responsable de la formación del 3-hidroxidesloratadina no ha sido identificada.

Eliminación: La vida media de la desloratadina es de 27 horas. Los valores de C_{max} y AUC se incrementan de manera proporcional siguiendo dosis orales desde los 5 hasta los 20 mg. El grado de acumulación después de 14 días fue consistente con la vida media y la frecuencia de la dosis. El 87 % de la dosis de desloratadina se recupera de manera similar en heces u orina como productos metabólicos. La vida media y el T_{max} del 3-hidroxidesloratadina es similar a la de la desloratadina.

Poblaciones especiales:

Geriátrica: En mayores de 65 años la C_{max} media y la AUC son 20 % mayores que en personas menores de 65. La vida media es de 33,7 hrs. El aclaramiento total del cuerpo es similar para los dos grupos. La farmacocinética para el 3-hidroxidesloratadina no parece experimentar cambios en ambos grupos. Las diferencias en cuanto a la edad no son relevantes de manera clínica por lo que no son necesarios ajustes de dosis en personas ancianas.

Pediatría: Las concentraciones plasmáticas son similares a las del adulto aunque la C_{max} y la AUC de la 3-hidroxidesloratadina son ligeramente mayores en adultos.

Trastornos renales: la C_{max} y la AUC de la desloratadina se incrementan en la medida que el aclaramiento de creatinina disminuye. Cambios mínimos en la concentración de la 3-hidroxidesloratadina se observan. Se recomienda ajustar la dosis en pacientes con trastornos renales.

Trastorno hepático: se incrementan la vida media y la AUC de la desloratadina mientras que la C_{max} y la AUC de la 3-hidroxidesloratadina no se ven significativamente afectados. Se recomienda ajuste de dosis para pacientes con trastornos hepáticos.

Género: no es necesario hacer ajustes de dosis entre pacientes de diferente género.

Raza: no es necesario hacer ajustes de dosis en pacientes de diferente raza.

Interacciones medicamentosas:

No se han identificado interacciones relevantes de manera significativa en el perfil de seguridad de la desloratadina medido como cambios electrocardiográficos, pruebas de laboratorio clínico, signos vitales y efectos adversos.

Indicaciones y usos:

Losiral® está indicado para el alivio de los síntomas nasales y no nasales de la rinitis alérgica estacional en niños mayores de 2 años de edad y adultos.

Losiral® está indicado para el alivio de los síntomas nasales y no nasales de la rinitis alérgica perenne en niños mayores de 6 meses de edad y adultos.

Losiral® está indicado para el alivio sintomático del prurito, reducción en el número y tamaño de los habones en pacientes con urticaria idiopática crónica mayores de 6 meses de edad y adultos.

Contraindicaciones:

Losiral® está contraindicado en pacientes con sensibilidad conocida a la desloratadina, loratadina o a alguno de los componentes de la fórmula.

Carcinogénesis, mutagénesis y trastorno de la fertilidad:

El significado clínico con el uso a largo plazo de la desloratadina de los datos obtenidos en animales de laboratorio en cuanto a carcinogénesis y trastornos de la fertilidad se refiere no es conocido. La desloratadina no ha mostrado potencial mutagénico en las pruebas de laboratorio estándar.

Embarazo y lactancia:

Categoría de embarazo: C. La desloratadina debe ser usada durante el embarazo solo si el potencial beneficio justifica el potencial riesgo para el feto. En animales de laboratorio se han observado pérdidas en la pre-implantación, pérdidas de la implantación, disminución en el número de las implantaciones y disminución en el peso a concentraciones muy superiores a la dosis normal en humanos. No existen estudios adecuados y bien controlados en mujeres embarazadas.

Lactancia: La desloratadina se excreta en la leche humana. Se debe tomar la decisión de si se suspende la lactancia o se discontinúa la desloratadina tomando en cuenta la importancia que representa el medicamento para la madre.

Reacciones adversas:

Las reacciones reportadas mayores al 2 % comparado con placebo en adultos y adolescentes con rinitis alérgica fueron: faringitis, boca seca, mialgia, fatiga, somnolencia, dismenorrea.

Las reacciones reportadas mayores al 2 % y 2.5ma/5mL comparado con placebo en adultos y adolescentes con urticaria fueron: cefalea, náuseas, fatiga, mareos, faringitis, dispepsia y mialgia.

En pediatría los efectos adversos reportados mayores al 2 % comparado con placebo fueron: fiebre, diarrea, tos, aumento del apetito, labilidad emocional, epistaxis, faringitis, rash maculopapular, infecciones del tracto respiratorio, náuseas.

Otros efectos adversos reportados aunque con una relación no establecida con la desloratadina han sido: taquicardia, palpitaciones, reacciones de hipersensibilidad (como rash, prurito, urticaria, edema, disnea, anafilaxia), elevación de las enzimas hepáticas, hepatitis, hiperactividad psicomotora.

Abuso del medicamento y dependencia:

No hay información que indique abuso o dependencia con el uso de la desloratadina.

Sobredosis:

Se recomiendan medidas estándar para remover cualquier parte del fármaco no absorbido. Se debe iniciar tratamiento de soporte y sintomático. Ni la desloratadina ni la 3-hidroxidesloratadina son eliminadas por hemodiálisis.

Dosis y administración:

Mayores de 12 años y adultos: 1 tableta una vez al día.

Niños de 6 a 11 años: 1 cucharadita (2,5 mg en 5 mL) una vez al día.

Niños de 12 meses a 5 años: ½ cucharadita (1,25 mg en 2,5 ml) una vez al día.

Niños de 6 meses a 11 meses: la dosis en esta edad es 1 mg (2 mL) una vez al día.

Pacientes con trastorno renal o hepático: se recomienda una dosis de 1 tableta (5 mg) cada 48 horas.

Losiral® se administra por vía oral.

Presentación:

Losiral® tabletas recubiertas

Estuche con 10 tabletas, cada tableta contiene 5 mg de desloratadina.

Losiral® jarabe

Frasco con 120 mL que contiene 2,5 mg de desloratadina por cada 5 mL.

REFERENCIAS BIBLIOGRÁFICAS: