LORATADINA

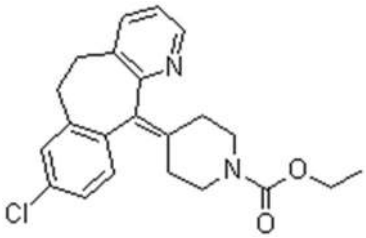
1. NOMBRE DEL MEDICAMENTO

Loratadina 5 mg/5 mL Jarabe

2. COMPOSICIÓN CUALITATIVA Y CUANTITATIVA

Cada 100 mL de jarabe contiene:
Loratadina 0,10 g.
Excipientes con efecto conocido: 40 g de azúcar (sacarosa).
Para consultar la lista completa de excipientes ver sección 6.1.

Cada 5 mL de jarabe contiene:
Loratadina 5 mg.



Ácido 4-(8-Cloro-5,6-dihidro-11H-benzo[5,6]ciclohepta[1,2-b]piridin-11-ilidene-1-piperidin-carboxílico etil éster

3. FORMA FARMACÉUTICA

Loratadina 5 mg/5 mL se presenta en forma de jarabe para administración por vía oral.

4. DATOS CLÍNICOS

4.1. Indicaciones terapéuticas

Alivio sintomático y temporal de los procesos alérgicos producidos por polen de las plantas (fiebre del heno), animales domésticos, polvo u otros agentes alergénicos.

4.2. Posología y forma de administración

Posología

Adultos y niños mayores de 12 años:
10 mL (10 mg) de jarabe una vez al día

Niños 6 de 12 años se dosificarán por peso:
Peso corporal mayor de 30 kg: 10 mL (10 mg) de jarabe una vez al día.

Peso corporal menor de 30 kg: 5 ml (5 mg) de jarabe una vez al día.

La utilización en niños menores de 6 años se realizará únicamente bajo supervisión médica.

No se ha establecido la seguridad y la eficacia en niños menores de 2 años.

A los pacientes con daño hepático grave se les deberá administrar una dosis inicial más baja debido a que pueden tener reducido el aclaramiento de loratadina. Se recomienda una dosis inicial de 10 mg en días alternos para adultos y niños con peso mayor de 30 kg.

No se requieren ajustes en la dosificación en ancianos o en pacientes con insuficiencia renal.

4.3. Contraindicaciones

- Hipersensibilidad a los componentes.
- Embarazo
- Lactancia.
- Niños menores de dos años de edad.

4.4. Advertencias y precauciones especiales de empleo

Loratadina debe ser administrada con precaución en pacientes con insuficiencia hepática grave (ver sección 4.2).

Si los síntomas empeoran o si persisten después de 7 días de tratamiento, el médico evaluará la situación clínica.

Interferencias con pruebas diagnósticas

La administración de Loratadina deberá ser interrumpida al menos 48 horas antes de efectuar cualquier tipo de prueba cutánea, ya que los antihistamínicos pueden impedir o disminuir las reacciones que, de otro modo, serían positivas a los indicadores de reactividad dérmica.

Advertencia sobre excipientes

Este medicamento contiene sacarosa. Pacientes con problemas raros hereditarios de intolerancia a la fructosa, malabsorción de la glucosa o galactosa o insuficiencia del complejo sacarasa-isomaltasa, no deben tomar este medicamento. Puede producir caries.

4.5. Interacción con otros medicamentos y otras formas de interacción

Cuando se administra concomitantemente con alcohol, este medicamento no tiene efectos potenciadores como se muestra en los estudios de comportamiento psicomotor.

Puede presentarse una potencial interacción con todos los inhibidores conocidos de CYP3A4 o CYP2D6 teniendo como resultado el aumento de los niveles de loratadina (ver sección 5.2) que puede causar un aumento de las reacciones adversas.

4.6. Fertilidad, embarazo y lactancia

Loratadina no tiene efectos teratogénicos en animales. No se ha establecido la seguridad del empleo de loratadina durante el embarazo. Por consiguiente el uso de Loratadina durante el embarazo no está recomendado.

Loratadina se excreta en la leche materna, por lo que no está recomendada su administración en mujeres en periodo de lactancia.

4.7. Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

No se ha producido disminución de la capacidad de conducir en los pacientes que reciben loratadina. No obstante, se deberá informar a los pacientes que muy raramente, algunas personas experimentan somnolencia, que puede afectar a su capacidad para conducir o para utilizar máquinas.

4.8. Reacciones adversas

Las reacciones adversas frecuentemente comunicadas en niños de 2 a 12 años de edad son cefalea (2,7%), nerviosismo (2,3 %) y cansancio (1 %).

Las reacciones adversas más frecuentemente comunicadas en adultos y adolescentes son somnolencia (1,2 %), cefalea (0,6 %), aumento del apetito (0,5 %) e insomnio (0,1 %). Otras reacciones adversas comunicadas muy raramente (<1/10.000) durante el periodo de poscomercialización se presentan en la siguiente tabla.

Trastornos del sistema inmunológico	Anafilaxia
Trastornos del sistema nervioso	Mareo
Trastornos cardíacos	Taquicardia, palpitaciones
Trastornos gastrointestinales	Náuseas, sequedad de boca, gastritis
Trastornos hepatobiliares	Función hepática alterada
Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo	Rash, alopecia
Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración	Cansancio

En caso de observar la aparición de reacciones adversas se deben notificar a los sistemas de farmacovigilancia y, si fuera necesario, suspender el tratamiento.

4.9. Sobredosis

La sobredosis con loratadina aumentó la aparición de síntomas anticolinérgicos. Se ha comunicado con sobredosis somnolencia, taquicardia y cefalea.

En el caso de sobredosis, se deben iniciar y mantener durante el tiempo que sea necesario medidas sintomáticas y de apoyo generales. Se puede intentar la administración de carbón activado mezclado con agua. Se puede considerar el lavado gástrico. Loratadina no se elimina por

hemodiálisis y se desconoce si loratadina se elimina por diálisis peritoneal. Tras el tratamiento de urgencia el paciente debe seguir bajo control médico.

5. PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

5.1. Propiedades farmacodinámicas

Grupo farmacoterapéutico: antihistamínicos – antagonista H_1

Código ATC: R06A X13

Loratadina, es un antihistamínico tricíclico con actividad selectiva sobre los receptores H_1 periféricos.

Loratadina no presenta propiedades sedantes o anticolinérgicas clínicamente significativas en la mayoría de la población y cuando se utiliza a la dosis recomendada.

En tratamientos crónicos no hubo cambios clínicamente significativos en los signos vitales, valores de pruebas de laboratorio, exámenes físicos o electrocardiogramas.

Loratadina no tiene actividad significativa sobre los receptores H_2. No inhibe la captación de norepinefrina y prácticamente no influye sobre la función cardiovascular o sobre la actividad intrínseca del marcapasos.

5.2. Propiedades farmacocinéticas

Después de la administración oral, loratadina se absorbe bien y rápidamente y experimenta un intenso metabolismo de primer paso, principalmente por medio de CYP3A4 y CYP2D6. El metabolito principal-desloratadina (DL)- es farmacológicamente activo y responsable de gran parte de su efecto clínico. Loratadina y DL alcanzan las concentraciones plasmáticas máximas (T_{max}) entre 1–1,5 horas y 1,5–3,7 horas después de su administración, respectivamente.

En ensayos controlados se ha comunicado un incremento en las concentraciones plasmáticas de loratadina tras la administración concomitante de ketoconazol, eritromicina y cimetidina, pero sin alteraciones clínicamente significativas (incluyendo electrocardiográficas).

Loratadina se une intensamente a las proteínas plasmáticas (97 % a 99 %) y su metabolito activo se une de forma moderada (73 % a 76 %).

En sujetos sanos, las semividas de distribución plasmática de loratadina y de su metabolito activo son aproximadamente 1 y 2 horas, respectivamente. Las semividas de eliminación media en adultos sanos fueron de 8,4 horas (intervalo = 3 a 20 horas) para loratadina y de 28 horas (intervalo = 8,8 a 92 horas) para el metabolito activo principal.

Aproximadamente el 40 % de la dosis se excreta en la orina y el 42 % en las heces durante un periodo de 10 días y principalmente en forma de metabolitos conjugados. Aproximadamente el 27 % de la dosis se elimina en la orina durante las primeras 24 horas. Menos del 1 % del principio activo se excreta inalterado en forma activa, como loratadina o DL.

Los parámetros de biodisponibilidad de loratadina y del metabolito activo son proporcionales a la dosis.

El perfil farmacocinético de loratadina y de sus metabolitos es comparable en voluntarios adultos sanos y en voluntarios geriátricos sanos.

La ingestión concomitante de alimentos puede retrasar ligeramente la absorción de loratadina pero sin influir en su efecto clínico.

En pacientes con alteración renal crónica, tanto el AUC como los niveles plasmáticos máximos (C_{max}) para loratadina y su metabolito fueron más elevados que los obtenidos en pacientes con función renal normal. Las semividas de eliminación media de loratadina y su metabolito no fueron significativamente diferentes a las observadas en sujetos sanos. La hemodiálisis no tiene efecto sobre la farmacocinética de loratadina o su metabolito activo en sujetos con alteración renal crónica.

En pacientes con alteración hepatica crónica debida al alcohol, el AUC y los niveles plasmáticos máximos (C_{max}) para loratadina fueron el doble, mientras que el perfil farmacocinético del metabolito activo no fue significativamente distinto con respecto al de pacientes con función hepática normal. Las semividas de eliminación para loratadina y su metabolito fueron 24 horas y 37 horas, respectivamente, incrementándose al aumentar la gravedad del daño hepático.

Loratadina y su metabolito activo se excretan en la leche materna de mujeres en periodo de lactancia.

5.3. Datos preclínicos sobre seguridad

Los datos preclínicos no ponen de manifiesto ningún riesgo especial en base a estudios convencionales sobre seguridad, farmacología, toxicidad tras la administración de dosis repetidas, genotoxicidad y potencial carcinogénico.

En estudios de toxicidad sobre la reproducción, no se observaron efectos teratogénicos. No obstante, en la rata se observó una prolongación del parto y una reducción de la viabilidad de las crías a niveles plasmáticos (AUC) 10 veces superiores a los alcanzados con dosis clínicas.

No se observó irritación de la membrana mucosa tras la administración diaria de hasta 12 comprimidos (120 mg) de liofilizados orales en la mucosa oral del hámster durante cinco días.

6. DATOS FARMACÉUTICOS

6.1. Lista de excipientes

Propilenglicol, azúcar, edetato disódico, esencia de frutilla 46942, ácido cítrico, benzoato de sodio, agua purificada.

6.2. Incompatibilidades

No se han reportado.

6.3. Periodo de validez

No administrar luego de la fecha de expiración indicada en el envase.

6.4. Precauciones especiales de conservación

Consérvese a temperatura no mayor a 30 ° C, protegido de la humedad y la luz.
Todo medicamento debe conservarse fuera del alcance de los niños.
No administrar si observa el empaque dañado o deteriorado.

6.5. Naturaleza y contenido del envase

Loratadina 5 mg/5 mL se presenta en caja con 1 frasco PET ámbar con tapa de polipropileno por 100 mL.

6.6. Precauciones especiales de eliminación

La eliminación del medicamento no utilizado y de todos los materiales que hayan estado en contacto con él, se realizará de acuerdo con la normativa local (o se procederá a su devolución a la farmacia).

7. FABRICANTE

Sanofi-Aventis de Colombia
Carrera 9 N° 30 – 20, Cali, Valle del Cauca, Colombia.

8. TITULAR DE LA AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN

Colombia, Costa Rica, Ecuador, El Salvador, Guatemala, Honduras, Nicaragua, Panamá: Winthrop Pharmaceuticals de Colombia S.A., con domicilio en Bogotá, Colombia.
Rep. Dominicana: Sanofi-aventis de la Rep. Dominicana S.A.

9. FECHA DE LA REVISIÓN DEL TEXTO

13 de mayo de 2016.

10. REFERENCIAS

Agencia Española de Medicamentos y Productos Sanitarios, Centro de Información Online de Medicamentos de la AEMPS.

Instituto Nacional de Vigilancia de medicamentos y Alimentos (INVIMA). Resolución 2005010447 de 14/06/2005.