



LORATADINA

1. NOMBRE DEL PRODUCTO, CONCENTRACIÓN, DENOMINACIÓN COMÚN INTERNACIONAL, FORMA FARMACÉUTICA

LORATADINA 5mg/5mL

Loratadina

Jarabe

2. COMPOSICIÓN CUALITATIVA Y CUANTITATIVA

Cada 5mL de jarabe contiene:

Loratadina..... 5mg

Excipientes: Propilenglicol, Azúcar grano fino, Edetato disódico, Esencia de frutilla, Ácido cítrico anhidro, Benzoato de sodio, Agua purificada.

3. INFORMACIÓN CLÍNICA

3.1 INDICACIONES TERAPÉUTICAS

La loratadina está indicada para:

- El alivio de los síntomas asociados con la rinitis alérgica estacional, como estornudos, secreción y prurito nasal y ardor y prurito ocular.
- El alivio de los síntomas y signos de la urticaria crónica y otros trastornos dermatológicos alérgicos.

Los estudios clínicos realizados hasta ahora apoyan el tratamiento hasta por 6 meses, por lo que se recomienda tener la indicación médica para el uso a largo plazo.

En niños, la loratadina en solución oral está indicada para:

- El alivio de los síntomas asociados con la rinitis alérgica estacional, como estornudos, secreción y prurito nasal y ardor y prurito ocular.
- El alivio de los síntomas y signos de la urticaria crónica y otros trastornos dermatológicos alérgicos.

Ninguna forma de dosificación de Loratadina Jarabe se recomienda para mujeres embarazadas o que dan de lactar.

Geriatría:

Los parámetros farmacocinéticos de la loratadina y de su metabolito más importante son comparables en los voluntarios sanos adultos y en los voluntarios geriátricos sanos.

PI: PE_LORATADINA_JARABE_5MG-5ML_PI_L Clean: VV-LBL-0189793 Annotated: VV-LBL-0189790	PIL ASOCIADO: PE_LORATADINA_JARABE_5MG-5ML_PIL_L Clean: VV-LBL-0189795 Annotated: VV-LBL-0189794
--	---



Pediatría (2-12 años de edad):

En los niños, está destinado únicamente al uso a corto plazo, a menos de que se tome bajo supervisión médica.

3.2 DOSIS Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN

Vía de administración: Oral.

Consideraciones de dosificación

Pacientes con deterioro grave de la función hepática: se recomienda una dosis inicial de 5 mg (5mL) una vez al día o 10 mg (10mL) en días alternos para adultos y niños que pesen más de 30 kg, y para niños que pesen 30 kg o menos, 5 ml (5 mg) se recomienda cada dos días.

No se requieren ajustes de dosis en pacientes con insuficiencia renal (*Ver ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES, Renales*).

Dosis recomendada y ajustes de la dosis

Adultos Y los niños mayores de 10 años de edad (peso corporal mayor de 30 Kg): 10 mL (dos cucharaditas) de jarabe de loratadina una vez al día.

Niños de 2 a 9 años de edad (peso corporal menor o igual a 30 Kg): 5 mL (una cucharadita) de jarabe de loratadina una vez al día.

El jarabe de loratadina no debe administrarse a niños entre 2 y 12 años de edad por más de 14 días, a menos que lo recomiende un médico.

Consulte a su médico o farmacéutico si tiene alguna duda sobre la administración.

3.3 CONTRAINDICACIONES

Pacientes que sean hipersensibles a este medicamento, incluido su metabolito, Descarboetoxi-loratadina o cualquier ingrediente en la formulación o componente del envase.

3.4 ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

Hepáticas/biliares/pancreáticas

En pacientes con enfermedad hepática alcohólica crónica, el AUC y los niveles plasmáticos máximos (C_{máx}) de loratadina fueron el doble, mientras que el perfil farmacocinético del metabolito activo no se modificó significativamente del de los pacientes con función hepática normal. La vida media de eliminación de loratadina y su metabolito activo fue de 24 horas y 37 horas, respectivamente, y aumentó con el aumento de la gravedad de la enfermedad hepática. Por lo tanto, se recomienda ajustar la dosis en pacientes con enfermedad hepática grave. Los pacientes con insuficiencia hepática grave deben recibir una dosis inicial más baja porque pueden tener un aclaramiento

PI: PE_LORATADINA_JARABE_5MG-5ML_PI_L Clean: VV-LBL-0189793 Annotated: VV-LBL-0189790	PIL ASOCIADO: PE_LORATADINA_JARABE_5MG-5ML_PIL_L Clean: VV-LBL-0189795 Annotated: VV-LBL-0189794
--	---



reducido de loratadina.

Renal

En pacientes con insuficiencia renal crónica, tanto el AUC como los niveles plasmáticos máximos (C_{max}) aumentaron para loratadina y su metabolito en comparación con los AUC y los niveles plasmáticos máximos (C_{max}) de pacientes con función renal normal. La vida media de eliminación de loratadina y su metabolito no fue significativamente diferente de la observada en sujetos normales. La hemodiálisis no tiene ningún efecto sobre la farmacocinética de loratadina o su metabolito activo en sujetos con insuficiencia renal crónica. Por lo tanto, no se requieren ajustes de dosis en pacientes con insuficiencia renal. En el caso de insuficiencia renal grave, la loratadina debe usarse con precaución.

Poblaciones especiales

Pediatría (2-12 años de edad): no se ha establecido la seguridad y eficacia de la loratadina en niños menores de 2 años de edad. La seguridad y la eficacia a largo plazo de la loratadina en niños entre los 2 y los 12 años de edad no se han demostrado. Por lo tanto, es deseable que la loratadina no se administre a niños entre los 2 y los 12 años de edad por más de 14 días, a menos que lo recomiende un médico.

3.5 INTERACCIONES CON OTROS MEDICAMENTOS Y OTRAS FORMAS DE INTERACCIÓN

Interacciones medicamentosas graves

Ninguna que reportar.

Resumen

Cuando se administra concomitantemente con alcohol, la loratadina no tiene efectos potenciados medidos mediante estudios de desempeño psicomotor.

Interacciones fármaco-fármaco

Se han reportado incrementos de las concentraciones plasmáticas de la loratadina después del uso concomitante de ketoconazol, eritromicina o cimetidina en estudios clínicos controlados, pero sin cambios clínicos significativos (incluyendo electrocardiográficos). Se deben coadministrar con precaución otros fármacos que inhiben el metabolismo hepático hasta que se completen los estudios de interacción definidos.

Interacciones entre el fármaco y los alimentos

Ver la sección de Acción y farmacología clínica / Farmacocinética / Absorción.



Interacciones entre el fármaco y productos naturistas

No se han establecido interacciones con los productos naturistas.

Interacciones entre fármacos y pruebas de laboratorio

La loratadina se debe descontinuar aproximadamente 48 horas antes de las pruebas cutáneas, debido a que los antihistamínicos pueden prevenir o disminuir las reacciones positivas a los indicadores de reactividad dérmicos.

Interacciones entre el fármaco y el estilo de vida

No se han establecido interacciones con el estilo de vida

3.6 ADMINISTRACIÓN DURANTE EL EMBARAZO Y LACTANCIA

Mujeres embarazadas: no se ha establecido el empleo seguro de la loratadina durante el embarazo y, por lo tanto, no se recomienda.

Mujeres que amamantan: no se ha establecido el empleo seguro de la loratadina en madres que amamantan y, por lo tanto, su empleo no se recomienda.

3.7 EFECTOS SOBRE LA CAPACIDAD DE CONDUCIR Y USAR MAQUINARIA

No se reportan.

3.8 REACCIONES ADVERSAS

Resumen de las reacciones adversas

Las experiencias adversas reportadas con la loratadina en los adultos durante los estudios clínicos fueron leves y consistieron en fatiga, dolor de cabeza, boca seca, sedación, trastornos gastrointestinales (como náusea y gastritis) y también síntomas alérgicos como erupción cutánea.

El nerviosismo y la hipercinesia estuvieron entre las experiencias adversas reportadas entre los pacientes pediátricos. Las reacciones adversas gastrointestinales reportadas durante los estudios pediátrico pudieron haber sido ligeramente más frecuentes en los pacientes jóvenes (≤ 30 Kg).

Durante la comercialización de la loratadina, se han reportado raramente alopecia, anafilaxis, función hepática anormal, mareo, palpitaciones y taquicardia.

Reacciones adversas al medicamento en los estudios clínicos

Debido a que los estudios clínicos se realizan en condiciones muy específicas, las frecuencias de las reacciones adversas en los estudios clínicos pudieran no reflejar las frecuencias observadas en la

PI: PE_LORATADINA_JARABE_5MG-5ML_PI_L Clean: VV-LBL-0189793 Annotated: VV-LBL-0189790	PIL ASOCIADO: PE_LORATADINA_JARABE_5MG-5ML_PIL_L Clean: VV-LBL-0189795 Annotated: VV-LBL-0189794
--	---



práctica y no deben compararse con las frecuencias en los estudios clínicos de otro fármaco. La información de las reacciones adversas de los estudios clínicos es útil para identificar eventos adversos relacionados al fármaco y para obtener frecuencias aproximadas.

Tabla 1. Loratadina Jarabe 5 mg/5 mL, 5-10 mg una vez al día

Número (%) de pacientes adultos que reportaron frecuentemente ($\geq 2\%$ de los pacientes tratados con loratadina): estudios clínicos controlados con placebo en pacientes pediátricos con rinitis alérgica estacional y estudios de trastornos alérgicos cutáneos

Experiencias adversas	Loratadina		Clorfenamina		Placebo
	5 mg	10 mg	2 mg	4 mg	
	n=46	n=119	n=48	n=122	
Nerviosismo	2 (4)	5 (4)	1 (2)	2 (2)	2 (1)
Hipercinesia	0 (0)	4 (3)	0 (0)	1 (1)	1 (0.6)
Sedación	2 (4)	6 (5)	4 (8)	13 (11)	9 (5)
Dolor de cabeza	3 (6)	4 (3)	4 (8)	5 (4)	13 (8)

Tabla 2. Número de pacientes que reportan experiencias adversas gastrointestinales en estudios clínicos pediátricos controlados con placebo, posiblemente o probablemente relacionados al medicamento del estudio, agrupados de acuerdo a tratamiento, dosis y peso

Evento adverso	Dosis de 5 mg	Dosis de 10 mg	Placebo
	Peso ≤ 30 Kg	Peso > 30 Kg	Peso > 30 Kg
	(N=46)	(N=119)	(N=168)
Diarrea	1	0	0
Náusea	2	2	5
Dispepsia	2	3	3
Vómito	2	0	0
Dolor abdominal	0	2	0
Total	7 (15%)	7 (5.9%)	8 (4.8%)

Las experiencias adversas reportadas en los pacientes pediátricos se muestran en la tabla 1 y 2. Entre las experiencias adversas reportadas, se observaron nerviosismo e hipercinesia. Un caso de hipercinesia se calificó como grave, y el médico lo juzgó como posiblemente relacionado al tratamiento con loratadina. Las reacciones adversas gastrointestinales reportadas en los estudios



pediátricos pudieron haber sido ligeramente más frecuentes en pacientes más jóvenes (≤ 30 Kg), pero en niños mayores (> 30 Kg) fueron similares al placebo.

Reacciones adversas de ensayo clínico menos frecuentes (<1%)

Además de los enumerados en la Tabla 1, se notificaron con menos frecuencia los siguientes casos (menos del 1%): aumento del apetito, tos, mareos y palpitaciones.

Hallazgos hematológicos y de la química clínica anormales

No procede.

Reportes de postcomercialización

Durante la comercialización de loratadina, además de los eventos adversos reportados en los estudios clínicos, se han reportado raramente alopecia, anafilaxis (incluyendo angioedema), función hepática anormal, mareo, palpitaciones y taquicardia. Muy raramente se han reportado convulsiones.

Notificación de sospechas de reacciones adversas:

Es importante notificar sospechas de reacciones adversas al medicamento tras su autorización. Ello permite una supervisión continuada de la relación beneficio/riesgo del medicamento. Se invita a los profesionales sanitarios a notificar las sospechas de reacciones adversas directamente a través del Sistema Nacional de Farmacovigilancia o a Sanofi por cualquiera de las siguientes vías: farmacovigilancia.peru@sanofi.com ó <http://www.sanofi.com.pe/es/contacto>

3.9 SOBREDOSIS Y TRATAMIENTO

Se ha reportado somnolencia, taquicardia y dolor de cabeza con la sobredosis de la formulación convencional de loratadina. Una ingestión única aguda de 160 mg no produjo eventos adversos.

En el caso de sobredosificación, el tratamiento debe comenzar de inmediato, es sintomático y de apoyo.

Considere medidas estándar para eliminar cualquier medicamento no absorbido en el estómago, como absorción con carbón activado administrado en una solución con agua. La aplicación de un lavado gástrico debe considerarse. La solución salina fisiológica es la solución de elección para el lavado, particularmente en niños. En adultos, se puede emplear agua para beber; sin embargo, se debe eliminar la mayor cantidad posible antes de la instalación. Los catárticos salinos jalen agua hacia el intestino por osmosis y, por lo tanto, pueden ser útiles por su acción en dilución rápida del contenido del intestino.



Loratadina no se elimina mediante hemodiálisis de una manera apreciable. No se sabe si la loratadina se elimina mediante diálisis peritoneal.

4 PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

4.1 PROPIEDADES FARMACODINÁMICAS

Mecanismo de acción

La loratadina es un antihistamínico tricíclico de larga acción con actividad antagonista periférica selectiva para el receptor H1. Muestra una inhibición relacionada a la dosis de las respuestas cutáneas de inflamación y formación de ronchas inducidas por la histamina en humanos que es de inicio rápido, es aparente en dos horas y persiste durante el periodo de observación 24 horas. Las dosis orales únicas de hasta 160 mg y las dosis repetidas diarias de 40 mg hasta por 13 semanas fueron bien toleradas, y la incidencia de sedación y de boca seca no fue diferente del placebo. Todas las especies estudiadas absorben bien la loratadina y se metaboliza casi totalmente.

Farmacodinamia

La loratadina tiene una menor afinidad por los receptores centrales que por los receptores periféricos y no penetra fácilmente al tejido cerebral.

- *Ronchas y brotes:* la actividad antihistamínica y el perfil de dosis-respuesta de la loratadina se evaluaron en 3 estudios clínicos farmacológicos utilizando un modelo de supresión de roncha inducida por histamina en hombres voluntarios sanos. Todas las dosis fueron más efectivas que el placebo en la supresión de la formación de ronchas inducidas por la histamina.
- *Alcohol:* la capacidad de concentración en hombres voluntarios sanos no se alteró con la combinación de loratadina y alcohol. La loratadina no potenció los efectos del alcohol en la conducción de vehículos.

4.2 PROPIEDADES FARMACOCINÉTICAS

Absorción: La loratadina marcada con ^{14}C se absorbe rápidamente, alcanzando valores de $\text{C}_{\text{máx}}$ (4.7, 10.8 Y 26.1 ng/mL) a las 1.5, 1.0 Y 1.3 horas con dosis de 10, 20 Y 40 mg, respectivamente. La vida media de eliminación ($T_{1/2}$) de la loratadina varió de 7.8 - 11.0 horas. La descarboetoxiloratadina, el metabolito activo más importante, alcanzó valores de $\text{C}_{\text{máx}}$ (4.0, 9.9 Y 16.0 ng/mL) a las 3.7, 1.5 Y 2.0 horas después de una dosis de 10, 20 Y 40 mg, respectivamente. Su $T_{1/2}$ varió de 17 a 24 horas. Los índices de acumulación, calculados mediante $\text{C}_{\text{máx}}$ y las razones del área bajo la curva (ABC) no cambiaron después del quinto día, lo que indica que no hubo acumulación o hubo muy poca acumulación de loratadina o su metabolismo después de un régimen de dosificación múltiple de una vez al día. La $T_{1/2}$ en el estado de equilibrio de loratadina y su



metabolito fueron de 14.4 y 18.7 horas, respectivamente, similar a lo reportado después de una dosis oral única.

Los intervalos de confianza de $C_{\max}$ y del ABC (I)* estuvieron dentro del rango de 80-125%, lo que indica que los comprimidos de loratadina de disolución rápida en la lengua fueron bioequivalentes con respecto al metabolito activo descarboetoxiloratadina.

* ABC(I) = área bajo la curva de la concentración plasmática-tiempo desde cero extrapolada al infinito.

Después de la administración de una dosis única de 10 mg de un comprimido convencional o de la formulación de jarabe (1 mg/mL), la concentración plasmática máxima de loratadina y sus metabolitos se alcanzó aproximadamente en 1 y 2 horas, respectivamente; la vida media de eliminación media del metabolito activo varió entre 19 y 21 horas.

Dado que la loratadina se metaboliza ampliamente, hubo una alta variabilidad entre sujetos en las concentraciones de fármaco en plasma. Por lo tanto, el porcentaje de CV de los parámetros farmacocinéticos fue grande.

Después de la administración de 10 mg de loratadina una vez al día durante 10 días como una tableta de desintegración oral o una tableta convencional, las concentraciones plasmáticas de loratadina y su metabolito activo se encontraban en estado estacionario para el día 5 con ambas formulaciones. Las concentraciones plasmáticas máximas medias ($T_{\max}$) de loratadina y su metabolito en ambas formulaciones se alcanzaron a las 1,3 horas; las fluctuaciones de pico a valle observadas para la tableta de desintegración oral y la tableta convencional fueron similares con respecto a la loratadina y su metabolito. La vida media de eliminación media del metabolito activo fue de 20 horas para ambas formulaciones.

Excreción: Aproximadamente, el 82% de la dosis de la ^{14}C -loratadina se excretó en la orina (40%) y en las heces (42%) durante un periodo de 10 días. Aproximadamente, el 27% de la dosis se eliminó en la orina durante las primeras 24 horas, en gran medida de forma conjugada. El fármaco sin cambios se encuentra solamente en cantidades traza en la orina y el metabolito activo descarboetoxiloratadina representa sólo del 0.4 al 0.6% de la dosis administrada de loratadina.

Poblaciones y condiciones especiales

Geriatría: los parámetros farmacocinéticos de la loratadina y de su metabolito más importante son comparables en los adultos voluntarios sanos y los ancianos voluntarios sanos.



5 DATOS FARMACÉUTICOS

5.1 LISTA DE EXCIPIENTES

Propilenglicol
Azúcar grano fino
Edetato disódico
Esencia de frutilla
Ácido cítrico anhidro
Benzoato de sodio
Agua purificada.

5.2 INCOMPATIBILIDADES

No se han reportado.

5.3 FECHA DE EXPIRA

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

5.4 PRECAUCIONES ESPECIALES DE CONSERVACIÓN

Consérvese a temperatura inferior a 30°C, protegido de la luz y la humedad.
No administrar si observa el empaque dañado o deteriorado.

5.5 NATURALEZA Y CONTENIDO DEL ENVASE

Frasco PET ámbar x 60mL, 100mL y 120mL

5.6 PRECAUCIONES ESPECIALES PARA LA ELIMINACIÓN DEL MEDICAMENTO

Ninguna en especial.

6 REFERENCIA

Agencia sanitaria de Canada.
Mayo 2019
Bayer Inc.

REVISIÓN LOCAL

Versión 1.0
Agosto 2020

PI: PE_LORATADINA_JARABE_5MG-5ML_PI_L Clean: VV-LBL-0189793 Annotated: VV-LBL-0189790	PIL ASOCIADO: PE_LORATADINA_JARABE_5MG-5ML_PIL_L Clean: VV-LBL-0189795 Annotated: VV-LBL-0189794
--	---