

RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto:	LORATADINA
Forma farmacéutica:	Jarabe
Fortaleza:	5,0 mg/5mL
Presentación:	Estuche por un frasco de vidrio ámbar con 120 mL. Estuche por un frasco de PET ámbar con 120 mL.
Titular del Registro Sanitario, país:	Empresa Laboratorio Farmacéutico Oriente, Cuba.
Fabricante, país:	Empresa Laboratorio Farmacéutico Oriente. Unidad Empresarial de Base (UEB) Bayamo, Cuba.
Número de Registro Sanitario:	M-14-186-R06
Fecha de Inscripción:	23 de septiembre 2014.
Composición:	
Cada cucharadita (5 mL) contiene:	
Loratadina	5,0 mg
Alcohol etílico	0,150 mL
Propilenglicol	250,000 mg
Plazo de validez:	Frasco de vidrio ámbar: 24 meses Frasco de PET ámbar: 18 meses
Condiciones de almacenamiento:	Almacenar por debajo de 30 °C. Protéjase de la luz.

Indicaciones terapéuticas:

Alivio de los síntomas asociados a la rinitis alérgica estacional o perenne, sinusitis alérgica, urticaria idiopática crónica, prurito, rinorrea, dermatitis atópica, dermatitis por contacto, y otras dermatitis alérgicas de diferente etiología (reacción a drogas y alimentos), eczema atópico, conjuntivitis alérgica, ardor y prurito ocular, reacciones locales producidas por picaduras de insectos y cualquier reacción alérgica en general.

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad conocida a la loratadina o alguno de los componentes de la formulación o a otros fármacos de estructura similar. Lactancia. Niños menores de 1 año de edad. Glaucoma. Estenosis pilórica, retención urinaria y crisis aguda de asma bronquial (CAAB). Ingestión de bebidas alcohólicas y sedantes. Contiene sacarosa, no administrar en pacientes con intolerancia hereditaria a la fructosa, mala absorción a la glucosa o galactosa o deficiencia de sacarasa isomaltasa.

Precauciones:

El tratamiento con loratadina, debe suspenderse aproximadamente 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.

Pediatría: Aún no se ha establecido la seguridad y eficacia de jarabe de loratadina en niños menores de 1 año. Sin embargo después de la administración de 2.5 mL (2.5 mg) de jarabe de loratadina, la actividad farmacocinética del medicamento en niños de 1 a 2 años de edad, es similar a la de niños mayores y adultos. En niños mayores tratados con dosis elevadas de este tipo de fármacos se puede desarrollar una reacción paradójica caracterizada por excitabilidad.

Geriatría: En ancianos tratados con antihistamínicos, es más probable la aparición de mareos, sedación, confusión e hipotensión; también a una reacción paradójica caracterizada por hiperexcitabilidad o a los efectos secundarios anticolinérgicos como sequedad de boca, retención urinaria, precipitación de glaucoma, no obstante es poco probable que la loratadina, en particular, produzca estos efectos pues ella carece de efectos anticolinérgicos y de sedación, por lo que su uso está aceptado en ancianos. Si se producen los efectos secundarios descritos o si persisten o se agravan se deberá suspender el medicamento.

A los pacientes con menoscabo grave de la función hepática o renal, se debe administrar inicialmente una dosis menor, ya que estos pacientes pueden tener una depuración más lenta del fármaco.

Pacientes con historia de prolongación del intervalo QT. Se debe monitorear regularmente la función cardiaca por el riesgo de aparición de arritmia ventricular.

Contiene etanol, tener precaución en pacientes con enfermedades hepáticas, alcoholismo, epilepsia, embarazo, lactancia y niños.

Evitar conducir o manejar maquinarias peligrosas.

Advertencias especiales y precauciones de uso:

Puede provocar somnolencia. Si esto ocurre no deberá conducirse vehículos o manejar maquinarias donde una disminución de la atención pueda originar accidentes.

Contiene etanol y propilenglicol, puede disminuir la capacidad para conducir o usar maquinarias. Puede alterar los efectos de otros medicamentos.

Reacciones Adversas:

A las dosis diarias recomendadas, la loratadina carece de propiedades sedantes, anticolinérgicas y sobre el desempeño psicomotor clínicamente significativas.

No produce efectos significativos sobre la presión arterial, temperatura, pulso, frecuencia respiratoria, E.C.G. ni pruebas rutinarias de laboratorio.

Se han reportado algunos efectos adversos de intensidad leve a moderada, como mareos, cefalea, fatiga, náuseas, vómitos, nerviosismo, insomnio, sedación ligera, retención urinaria, impotencia, visión borrosa, resequeidad de las mucosas en

boca, nariz y garganta, gastritis y reacciones alérgicas como rash. En raras ocasiones se han informado casos de alopecia, anafilaxia, alteraciones hepáticas.

Posología y modo de administración:

Adultos y niños mayores de 12 años: Dos cucharaditas, 10 mg de Loratadina una vez al día.

Niños de 2 a 12 años:

Peso corporal mayor de 30 kg: 10 mL (10 mg), dos cucharaditas de jarabe, una vez al día.

Peso corporal menor e igual de 30 kg: 5 mL (5 mg), una cucharadita de jarabe, una vez al día.

Niños de 2 a 6 años: Menores de 15 kg, a criterio del médico.

En caso de disfunción hepática o renal: La dosis inicial recomendada es de 5 mg una vez al día. Ó 10 mg en días alternos. En caso de pacientes pediátricos se administrará la mitad de la dosis ponderal.

Interacciones con otros productos medicinales y otras formas de interacción:

La administración concomitante con eritromicina, cimetidina y ketoconazol incrementa las concentraciones plasmáticas de loratadina, por posible inhibición de su metabolismo hepático sin significación clínica pues no se ha reportado potenciación de su toxicidad.

Cuando se administra con medicamentos que se conocen que inhiben el metabolismo hepático, se debe administrar con precaución.

Uso en embarazo y lactancia:

Embarazo: No existen estudios adecuados y bien controlados durante el embarazo, por lo tanto, deberá emplearse solamente si los beneficios potenciales para la madre justifican el posible riesgo potencial para el feto.

Los lactantes y niños pequeños son especialmente sensibles a los efectos adversos anticolinérgicos de los antihistamínicos (excitación del SNC y tendencia a las convulsiones).

Efectos sobre la conducción de vehículos / maquinarias: No procede

Sobredosis:

Se ha reportado somnolencia, taquicardia y cefalea. Hasta la fecha no han ocurrido sobredosis con loratadina. Una sola ingestión de 260 mg no produjo efectos adversos.

Tratamiento: En el caso de una sobredosis, el tratamiento, que debe iniciarse inmediatamente, es sintomático y coadyuvante.

Debe inducirse el vómito aunque este haya ocurrido espontáneamente. El vómito inducido farmacológicamente, por administración de jarabe de ipecacuana es el método preferido. Sin embargo no se debe inducir el vómito en pacientes con

alteraciones del estado de despierto. La acción de ipecacuana se facilita por la actividad física y por la administración de 240 a 360 mL de agua. Si no ocurre la emesis dentro de 15 minutos de haberse administrado ipecacuana, debe repetirse la dosis. Deben tomarse precauciones para evitar la broncoaspiración, especialmente en niños. Después de la emesis debe tratarse de absorber cualquier resto de medicamento que quede en el estómago, administrando carbón activado en forma de suspensión espesa en agua. Si el vómito no ha tenido éxito o está contraindicado, debe realizarse lavado gástrico. El agente preferido para el lavado gástrico es la solución salina isotónica, especialmente en los niños. En los adultos se puede usar agua corriente; sin embargo, antes de la siguiente instilación debe extraerse el mayor volumen del líquido administrado previamente. Los agentes catárticos salinos atraen agua dentro del intestino por ósmosis y, por lo tanto, pueden ser valiosos por su rápida acción diluyente del contenido intestinal.

Debe emplearse oxígeno y líquidos endovenosos si éstos fueran necesarios. La loratadina no es depurada mediante hemodiálisis en grado alguno apreciable. Después de administrar tratamiento de urgencia se debe mantener al paciente bajo vigilancia médica.

Propiedades farmacodinámicas:

La loratadina es un antihistamínico tricíclico potente, de segunda generación, de acción prolongada, con actividad selectiva, antagónica a los receptores H₁ periféricos. Su mecanismo de acción es por competencia con la histamina sobre los receptores H₁ de las células efectoras. Por lo tanto previene pero no revierte la respuesta mediada por la histamina.

No bloquea la liberación de histamina, pero antagoniza en diversos grados la mayoría de los efectos farmacológicos de la histamina, incluyendo la urticaria y el prurito. No tiene acción anticolinérgica significativa. Es un broncodilatador leve, por lo tanto, bloquea la broncoconstricción inducida por la histamina en los pacientes asmáticos. También se ha demostrado que disminuye el broncoespasmo inducido por ejercicio y la hiperventilación secundaria al broncoespasmo.

Presenta mínima penetración a través de la barrera hematoencefálica, por lo que carece de efectos depresores centrales e inhibe la liberación de histamina y leucotrienos.

Posee muy baja afinidad por los receptores del S.N.C. involucrados en el fenómeno de sedación y por los receptores muscarínicos, lo que permite el tratamiento a largo plazo sin los efectos secundarios de los histaminoantagonistas H₁ de primera generación.

Propiedades farmacocinéticas (absorción, distribución, biotransformación, eliminación):

Absorción: Se absorbe muy bien después de la administración oral; se encuentra en el plasma en concentraciones medibles a los 15 minutos.

Biodisponibilidad: No se ve afectada por los alimentos.

Distribución: Ampliamente por los tejidos, encontrándose principalmente a nivel pulmonar, hepático y gastrointestinal; por sus marcadas características lipofóbicas, la

loratadina no cruza la barrera hematoencefálica; se encuentra en la leche materna en concentraciones similares a las plasmáticas; sin embargo sólo un 0,029 % es excretado por esta vía.

Inicio de la acción: Rápido, entre 27 y 30 minutos aproximadamente.

Los picos máximos de concentración plasmática son dosis/proporcionales (4,7 ng/mL-10,8 ng/mL y 26,1 ng/mL con dosis de 10-20 y 40 mg respectivamente).

Tiempo para alcanzar las máximas concentraciones séricas: de 1 a 1,5 horas, independiente de la edad o la dosis.

Efecto máximo: dura de 4 a 6 horas, aunque su acción permanece 24 horas.

En pacientes geriátricos (66 a 78 años de edad), los niveles máximos en plasma de loratadina son aproximadamente 50 % mayor que en pacientes jóvenes. En pacientes con insuficiencia renal crónica (depuración de creatinina menor o igual a 30 minutos) aumenta en un 75 % y un 120 % el metabolito en los niveles plasmáticos máximos en relación con pacientes con una función renal normal.

Las concentraciones plasmáticas estables de loratadina (27,1 ng/mL) se obtienen después de 5 días de administración continua.

Unión a las proteínas plasmáticas: Alta, de un 97 a un 99 %.

Metabolismo: La loratadina es rápidamente metabolizada a descarboetoxiloratadina, metabolito activo, y otros metabolitos conjugados, a través del sistema citocromo P-450.

Vida media de eliminación: De 3 a 20 horas; en estado estable la vida media es de 14,4 horas. Sin embargo su actividad antihistamínica y la de su metabolito activo, la descarboetoxiloratadina, es de aproximadamente 24 horas, lo que permite la administración de una vez al día.

Excreción: Por orina en un 40 % y por las heces en un 41 %, en un período máximo de 10 días, como principio activo y como su metabolito descarboetoxiloratadina no conjugada. En pacientes con insuficiencia hepática la eliminación de loratadina y su metabolito son de 24 a 37 horas, respectivamente, incrementando el tiempo, según la gravedad de la insuficiencia hepática.

Aproximadamente el 27 % de la dosis se elimina por la orina en las primeras 24 horas.

En ancianos y enfermos con cirrosis hepática alcohólica, la vida media de la loratadina y de su metabolito activo está prolongadas. En insuficiencia renal, la farmacocinética de la loratadina no está alterada. Tanto la loratadina como su metabolito activo no son dializables.

Instrucciones de uso, manipulación y destrucción del remanente no utilizable del producto

Fecha de aprobación / revisión del texto: 23 de septiembre 2014.