



# Frenaler

## Desloratadina

Vía oral  
Comprimidos recubiertos

### Fórmula

Cada comprimido recubierto contiene Desloratadina 5 mg. Excipientes: Almidón pregelatinizado; Ácido silícico coloidal; Celulosa microcristalina; Crospovidona; Talco siliconado; Hidroxipropilmetilcelulosa 3 cp; Hidroxipropilmetilcelulosa 6 cp; Dióxido de titanio; Polietilenglicol 400; Polisorbato 80; Óxido de hierro rojo.

### Acción terapéutica

Antihistamínico.

### Indicaciones

**Frenaler** está indicado para el alivio de los síntomas nasales y no nasales asociados con la rinitis alérgica (estacional y perenne) y para el alivio sintomático del prurito y del número y tamaño de las pápulas en pacientes con urticaria crónica idiopática.

### Acción farmacológica

**Frenaler** es un antihistamínico tricíclico de acción prolongada, no sedativo, con actividad antagonista selectiva de los receptores H<sub>1</sub> de la histamina periféricos. Inhibe la liberación de histamina por los mastocitos.

La Desloratadina es efectiva en el alivio de síntomas tales como estornudos, rinorrea y prurito nasal, prurito ocular, lagrimeo, enrojecimiento ocular y prurito del paladar en pacientes con rinitis alérgica estacional o perenne. En la urticaria crónica idiopática fue eficaz en el control del prurito y del número y tamaño de las pápulas.

La sintomatología se controla eficazmente durante 24 horas luego de una toma diaria.

### Farmacocinética:

La Desloratadina es bien absorbida luego de su administración por vía oral. Se puede detectar en plasma dentro de los 30 minutos y las concentraciones plasmáticas máximas se alcanzan aproximadamente en 3 horas. Los alimentos no alteran su absorción. La Desloratadina y la 3-hidroxisdesloratadina se unen a las proteínas plasmáticas en un 85% y 87% ( $\pm$  2) respectivamente y su unión no se modifica en sujetos con insuficiencia renal.

La Desloratadina es metabolizada a 3-hidroxisdesloratadina, un metabolito activo, que se conjuga posteriormente con ácido glucurónico. La enzima responsable de la transformación a 3-hidroxisdesloratadina no ha sido identificada. Existe un pequeño porcentaje de sujetos metabolizadores lentos de Desloratadina con predominio en individuos de la raza negra. El área bajo la curva de concentración-tiempo (AUC) de Desloratadina en el grupo de metabolizadores lentos fue varias veces mayor que en los sujetos no metabolizadores lentos. Los sujetos metabolizadores lentos de Desloratadina no pueden ser identificados prospectivamente y por estar expuestos a niveles más altos de Desloratadina, con la dosis habitualmente recomendada, podrían ser más susceptibles a los eventos adversos relacionados con la dosis.

La vida media de eliminación es de 27 horas. La 3-hidroxisdesloratadina mostró valores comparables a la Desloratadina. La eliminación se realiza bajo la forma de metabolitos en la

orina y las heces en partes iguales.

La Desloratadina no penetra fácilmente en el sistema nervioso central. A la dosis recomendada de 5 mg diarios, no se detectó un exceso en la incidencia de somnolencia en comparación con placebo.

En sujetos ancianos se observaron diferencias en la farmacocinética de la Desloratadina dependientes de la edad. Sin embargo, estas diferencias son clínicamente irrelevantes y no se recomiendan ajustes de dosis en ancianos.

Los pacientes con insuficiencia renal leve y moderada (clearance de creatinina 30-70 ml/min) mostraron valores aumentados de la concentración plasmática máxima (C<sub>max</sub>) y del AUC en 1,2 y 1,9 veces respectivamente, con relación a sujetos con función renal normal. En pacientes con insuficiencia renal severa (clearance de creatinina < 30 ml/min) o en plan de hemodiálisis, las C<sub>max</sub> y AUC aumentaron 1,7 y 2,5 veces, respectivamente. Se observaron cambios mínimos en las concentraciones de 3-hidroxisdesloratadina. La Desloratadina y 3-hidroxisdesloratadina no se eliminan por hemodiálisis en forma significativa. Se recomienda ajustar la dosis en pacientes con alteración de la función renal. (Ver Posología y forma de administración).

Se ha informado que los pacientes con insuficiencia hepática tienen un aumento del AUC de aproximadamente 2,4 veces comparado con los sujetos normales y un incremento en la vida media de la Desloratadina sin modificación de los valores de 3-hidroxisdesloratadina.

Se recomienda ajustar la dosis en pacientes con alteración de la función hepática. (Ver Posología y forma de administración).

### Posología y forma de administración

Adultos y niños mayores de 12 años de edad: 1 comprimido recubierto (5 mg) una vez por día. Pacientes con insuficiencia hepática o renal: 1 comprimido recubierto (5 mg) en días alternos.

### Contraindicaciones

Hipersensibilidad conocida a la Desloratadina, a cualquiera de los componentes del producto y a la loratadina.

### Precauciones y advertencias

Se debe advertir a los pacientes que no deben incrementar la dosis. En los diversos estudios realizados no se obtuvo aumento de la eficacia con dosis mayores de 5 mg y por el contrario se puede producir somnolencia.

Debido a que el alimento no modifica la biodisponibilidad, los comprimidos se pueden tomar con independencia de las comidas.

Embarazo: No se ha establecido la seguridad del empleo de Desloratadina en mujeres embarazadas. Por lo tanto, **Frenaler** no debe utilizarse durante la gestación a menos que los potenciales beneficios superen los riesgos.

Lactancia: La Desloratadina se excreta en la leche. Luego de haber evaluado la relación riesgo/beneficio de la utilización de **Frenaler** durante la lactancia y si su indicación se juzgara beneficiosa, deberá considerarse la discontinuación de la lactancia.

Uso pediátrico: No se han establecido la seguridad y la eficacia de **Frenaler** comprimidos recubiertos en niños menores de 12 años.

Uso en ancianos: No se dispone de estudios específicos con Desloratadina en sujetos mayores de 65 años. Sin embargo, en informes aislados, no se detectaron diferencias entre pacientes ancianos y más jóvenes.

En general, la selección de la dosis para un paciente anciano debe ser prudente, considerando la mayor frecuencia en la disminución de las funciones hepática, renal o cardíaca, y la presencia de enfermedades o tratamientos concomitantes.

Efectos sobre la capacidad para conducir vehículos y utilizar maquinarias: La Desloratadina ha evidenciado muy escasa o ninguna influencia sobre la capacidad para conducir vehículos y usar maquinarias.

### Interacciones medicamentosas

No se detectaron interacciones farmacológicas relevantes desde el punto de vista clínico en los estudios en los que se administró en forma concomitante eritromicina, ketoconazol, azitromicina, fluoxetina o cimetidina a pesar de que se observó un aumento en las concentraciones plasmáticas de Desloratadina y 3-hidroxisdesloratadina. No se detectaron cambios clínicamente relevantes en el perfil de seguridad de la Desloratadina evaluado por medio de parámetros electrocardiográficos, incluyendo el intervalo QT corregido para la



frecuencia cardíaca (QTc), análisis de laboratorio, signos vitales y registro de eventos adversos. Se ha informado que la administración concomitante de Desloratadina y alcohol no potenció los trastornos inducidos por el mismo.

#### Reacciones adversas

En los pacientes que recibieron Desloratadina a la dosis recomendada de 5 mg diarios, la frecuencia de reacciones adversas fue similar a la de los pacientes tratados con placebo. El porcentaje de pacientes que abandonaron prematuramente el tratamiento por eventos adversos también fue similar en ambos grupos (2%). No hubo reacciones adversas serias en pacientes que recibieron Desloratadina. A continuación se mencionan todas las reacciones adversas que fueron informadas en  $\geq 2\%$  de pacientes que recibieron la dosis diaria recomendada (5 mg) y que fueron más comunes con Desloratadina que con placebo: Faringitis, cefaleas, sequedad bucal, somnolencia, fatiga, síntomas seudogripales, mialgias, náuseas, vértigos, sequedad de garganta y dispepsia. La frecuencia y magnitud de las anomalías electrocardiográficas y de laboratorio fueron similares en los pacientes tratados con Desloratadina o placebo. No se registraron diferencias en eventos adversos en subgrupos de pacientes definidos por sexo, edad o raza. Los siguientes eventos adversos fueron informados espontáneamente luego de la comercialización de Desloratadina: Taquicardia, raramente reacciones de hipersensibilidad (rash, prurito, urticaria, edema, disnea y anafilaxia), y elevación de las enzimas hepáticas y la bilirrubina.

#### Sobredosificación

Los síntomas informados en la escasa experiencia existente se limitan a somnolencia e incremento de la frecuencia cardíaca del orden de 9 latidos por minuto. El intervalo QTc calculado por los métodos de Bazett y de Fridericia mostró un incremento de sólo 8,1 milisegundos y 0,4 milisegundos, con relación al placebo, respectivamente. No se informaron eventos adversos clínicamente relevantes.

En caso de sobredosis, se debe considerar la realización de los procedimientos habituales para la remoción de la droga no absorbida. Se recomienda el tratamiento sintomático y de sostén. La Desloratadina y la 3-hidroxisdesloratadina no se eliminan por hemodiálisis. Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al hospital más cercano o comunicarse con los Centros de Toxicología: Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez: (011) 4962-6666 / 2247, Hospital A. Posadas: (011) 4654-6648 / 4658-7777.

#### Presentación

**Frenaler** Comprimidos recubiertos:

Envases conteniendo 7 y 14 comprimidos recubiertos.



5

Comprimidos redondos, color rosado oscuro, codificados DL en una cara y 5 en la otra.

#### Otra presentación

**Frenaler** Jarabe: Envase conteniendo 60 ml.

Venta bajo receta.

*Industria Argentina.*

Medicamento autorizado por el Ministerio de Salud.

Certificado N° 50.419.

Directora Técnica: Mirta Beatriz Fariña, Farmacéutica.

Elaborado en José E. Rodó 6424,

C1440AKJ Ciudad Autónoma de Buenos Aires.

Fecha de última actualización: Agosto de 2002.

#### Producto medicinal.

**Mantener fuera del alcance de los niños.**

**Conservar en lugar seco a temperatura inferior a 30°C.**

Información a profesionales y usuarios: ☎ 0-800-333-5658

#### Roemmers S.A.I.C.F.

Fray Justo Sarmiento 2350,  
B1636AKJ Olivos,  
Pcia. de Buenos Aires.

[www.roemmers.com.ar](http://www.roemmers.com.ar)

B 1119101870  
9854 1009 (52/L149)



**ROEMMERS**  
CONCIENCIA POR LA VIDA