



1. NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

LORATADINA

2. VIA DE ADMINISTRACION

VIA ORAL

3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Antihistamínicos para uso sistémico
Código ATC: R06AX.13

3.1. Farmacodinamia

La Loratadina es un antihistamínico de 2da. Generación piperidina-derivado de acción prolongada con actividad antagonista selectiva de los receptores H_1 periféricos de histamina.

En ensayos *in vitro* la loratadina exhibe una muy escasa o nula afinidad por receptores colinérgicos o H_2 de histamina y prácticamente ninguna por receptores alfa-adrenérgicos.

La evidencia experimental postula que la presencia de un grupo carboxietil éster en la molécula de loratadina parece limitar su paso a través de la barrera hemato-encefálica y, en consecuencia, reducir su potencial para generar efectos adversos a nivel del sistema nervioso central (en especial, sedación). Así mismo, los estudios sugieren que el efecto antihistamínico prolongado de la loratadina podría ser el resultado de su lenta disociación del receptor H_1 y/o de la formación de su metabolito activo, la desloratadina (descarboetoxiloratadina). También se ha descrito un efecto supresor de la liberación de histamina de los mastocitos.

Estudios clínicos con loratadina en pacientes adultos y pediátricos han demostrado su eficacia en el alivio sintomático la rinitis alérgica y a la urticaria idiopática crónica, sin evidencia de tolerancia al efecto antihistamínico en tratamientos hasta por 24 semanas.

3.2. Farmacocinética

Luego de su absorción en el tracto gastrointestinal la loratadina sufre un rápido e intenso metabolismo de primer paso que da lugar a un producto activo, la desloratadina, que contribuye en gran medida a la magnitud y duración del efecto farmacológico. Tras la administración del fármaco se registran concentraciones séricas pico de loratadina y su metabolito en 1.3 y 2.5 horas, respectivamente, y se observa un inicio de la acción antihistamínica en 1-3 horas, que se hace máxima a la





8-12 horas y persiste por aproximadamente 24 horas. La ingestión concomitante de alimentos puede retrasar ligeramente la absorción de loratadina pero sin influir en su efecto clínico.

Ambas moléculas, loratadina y desloratadina se unen a proteínas plasmáticas en un 97-99% y 73-77%, respectivamente, y se distribuyen a los tejidos pero sin lograr niveles apreciables en sistema nervioso central. Se excretan en la leche materna.

Se transforman en un 80% en el hígado a metabolitos inactivos que son posteriormente eliminados por la orina y las heces en proporciones similares. La vida media de eliminación de la loratadina es de 8-15 horas y la de desloratadina 17-28 horas, prolongándose significativamente ambas en pacientes con insuficiencia hepática.

3.3. Información pre-clínica sobre seguridad

Los ensayos de mutagenicidad realizados hasta la fecha con loratadina han resultado negativos.

En las evaluaciones de potencial carcinogénico la administración oral de 40 mg/kg durante 18 meses a ratones y de 25 mg/kg por 2 años a ratas (equivalentes a 3.6 y 28 veces, respectivamente, la exposición observada con dosis terapéutica en humanos), produjo una elevada incidencia de tumores hepatocelulares. Se desconocen las implicaciones clínicas de dicho hallazgo en relación al uso prolongado de la loratadina.

Los estudios de reproducción en ratas con niveles plasmáticos de loratadina 10 veces superiores a los terapéuticos en humanos, revelaron prolongación del parto y una reducción de la viabilidad de las crías. No se evidenció teratogénesis.

4. INDICACIONES

Tratamiento sintomático de la rinitis alérgica, la urticaria y otras afecciones dermatológicas alérgicas como la dermatitis atópica.

5. POSOLOGIA

5.1. Dosis

Adultos y niños mayores de 12 años: 10 mg una vez al día

Niños de 2 años (peso > 20 kg) a 12 años: 5 mg una vez al día

Niños de 2 años (peso < 20 kg): 2,5 mg una vez al día

5.2. Dosis máxima diaria:

Las dosis recomendadas. El uso de dosis superiores no genera beneficios terapéuticos adicionales y, por el contrario, podría ocasionar efectos adversos.





5.3. Dosis en pacientes especiales:

Insuficiencia hepática o renal: En pacientes con falla hepática o insuficiencia renal (depuración de creatinina < 30 ml/min) iniciar terapia con las mismas dosis recomendadas para adultos y niños, según sea el caso, pero reduciendo su frecuencia de administración: en lugar de administración diaria (cada 24 horas), administrar en días alternos (cada 48 horas).

Ancianos: Dado que por su edad estos pacientes tienen mayor probabilidad de presentar afecciones renales y/o hepáticas que podrían comprometer la eliminación del fármaco e incrementar los riesgos, es recomendable en ellos evaluar la función renal y hepática antes de iniciar el tratamiento y, en caso de ser necesario, hacer el ajuste antes señalado.

5.4. Modo de empleo o forma de administración:

Tabletas, comprimidos y comprimidos recubiertos: Administrar por vía oral con agua, con o sin las comidas.

Jarabe, solución oral y solución gotas: Administrar por vía oral, con o sin las comidas, acompañado con medio vaso de agua después de cada administración.

6. REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas se han clasificado por su frecuencia en:

- Muy frecuentes ($\geq 1/10$)
- Frecuentes ($\geq 1/100$, $< 1/10$)
- Poco frecuentes ($\geq 1/1000$, $< 1/100$)
- Raras ($\geq 1/10.000$, $< 1/1.000$)
- Muy raras ($< 1/10.000$)
- Frecuencia no conocida (notificadas durante el uso post-comercialización y en datos de laboratorio)

Trastornos del sistema sanguíneo y linfático

Frecuencia no conocida: Trombocitopenia.

Trastornos gastrointestinales

Frecuentes: Dolor abdominal, sequedad de la boca, estomatitis, diarrea.

Poco frecuentes: Dispepsia, gastritis, náusea, vómito, anorexia, aumento del apetito, constipación.

Trastornos hepato-biliares

Frecuencia no conocida: Alteraciones de la función hepática.

Trastornos renales y urinarios

Poco frecuentes: Retención urinaria.





Trastornos cardiovasculares

Poco frecuentes: Palpitaciones, hipertensión, hipotensión, taquicardia.
Frecuencia no conocida: Edema periférico.

Trastornos del sistema nervioso

Frecuentes: Cefalea, nerviosismo, somnolencia, fatiga, insomnio, hiperquinesia.
Poco frecuentes: Agitación, confusión, dificultad de concentración, mareo, ansiedad, irritabilidad.
Frecuencia no conocida: Convulsiones.

Trastornos respiratorios

Frecuentes: Sibilancias, infección del tracto respiratorio superior, epistaxis, faringitis.
Poco frecuentes: Tos, bronquitis, disnea, laringitis, resequedad nasal.

Trastornos músculo-esqueléticos

Poco frecuentes: Mialgia, artralgia, calambres en piernas.

Trastornos del oído y laberinto

Frecuentes: Dolor de oído.
Poco frecuentes: Tinnitus.

Trastornos oculares

Frecuentes: Conjuntivitis.
Poco frecuentes: Visión borrosa.

Trastornos del aparato reproductor y de la mama

Frecuencia no conocida: Crecimiento de las mamas, mastalgia.

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo

Frecuentes: Erupción.
Poco frecuentes: Prurito, púrpura, dermatitis, resequedad de la piel y el cabello.
Frecuencia no conocida: Alopecia.

Trastornos del sistema inmunológico

Poco frecuentes: Angioedema, reacciones de fotosensibilidad.
Frecuencia no conocida: Anafilaxia, eritema multiforme.

Trastornos generales

Frecuentes: Malestar general, disfonía, síndrome gripe-similar, astenia.
Frecuencia no conocida: Sed, temblor, sudoración.





7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

No se han descrito interacciones clínicamente relevantes con loratadina.

En estudios de comportamiento psicomotor su uso concomitante con alcohol no produjo efectos de potenciación, ni alteraciones en el desempeño de los sujetos.

Se han reportado incrementos en las concentraciones plasmáticas de loratadina y su metabolito activo tras su co-administración con fármacos que afectan el sistema microsomal hepático (como: azitromicina, claritromicina, cimetidina o ketoconazol), pero sin evidencia alguna de efectos adversos en los pacientes o manifestaciones de importancia clínica.

En el tracto gastrointestinal la presencia de alimentos incrementa la absorción de loratadina, pero no genera cambios importantes en la concentración plasmática de su metabolito activo. Puede ocurrir un ligero retardo en la aparición del efecto terapéutico, pero no en la magnitud o intensidad del mismo.

7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio

Los antihistamínicos, en general, pueden alterar el resultado de las pruebas de reactividad dérmica a alérgenos. Para evitarlo se recomienda interrumpir la terapia 48 horas antes de la prueba.

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

No se conoce la seguridad de su empleo en niños menores de 2 años.

En algunos pacientes la loratadina podría causar depresión del sistema nervioso central (somnolencia) y, como resultado, afectar la capacidad de concentración y la habilidad para conducir vehículos u operar maquinarias. Se debe advertir a los pacientes tal posibilidad.

Usar con precaución en ancianos y en pacientes disfunción renal y/o hepática.

8.2. Embarazo

Aunque no se ha evidenciado teratogenicidad en ensayos experimentales con loratadina, no existen estudios clínicos adecuados que demuestren su seguridad en mujeres embarazadas. Por lo tanto, su empleo en tales circunstancias debe limitarse a situaciones en las que se considere estrictamente necesario.

8.3. Lactancia

Dado que la loratadina es distribuida a leche materna en cantidades importantes y se desconocen sus efectos en el lactante, se deberá decidir entre discontinuar la





medicación o la lactancia sopesando los beneficios a la madre derivados del tratamiento y los riesgos que supone para el niño la suspensión temporal o definitiva de la lactancia. De ser imprescindible su uso por no existir otra alternativa terapéutica, se deberá suspender la lactancia mientras dure el tratamiento.

9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a los constituyentes de la formula.
Niños menores de 2 años.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas:

Se ha reportado somnolencia, taquicardia y cefalea en adultos por sobredosificación (40-180 mg) de loratadina. En niños se han descrito signos extrapiramidales y palpitaciones por ingestión de dosis superiores a 10 mg.

10.2. Tratamiento:

En caso de ingestión reciente (menos de 60 minutos) se recomiendan medidas orientadas a prevenir la absorción gastrointestinal (emesis o lavado gástrico, según la condición del paciente, mas carbón activado), seguido por tratamiento sintomático y de soporte. La hemodiálisis es inefectiva.

11. TEXTOS DE ESTUCHES Y ETIQUETAS

11.1 SOLO PARA LAS PRESENTACIONES DE USO EN ADULTOS

VIA DE ADMINISTRACION: Oral.

INDICACIONES: Tratamiento sintomático de la rinitis alérgica, la urticaria y otras afecciones dermatológicas alérgicas como la dermatitis atópica.

POSOLOGIA (Dosis recomendada):

Adultos y niños mayores de 12 años: 10 mg una vez al día.

ADVERTENCIAS:

Si está embarazada o en período de lactancia, consulte al médico antes de usar este producto.

Si los síntomas persisten y no se observa mejoría después de 2-3 días con el uso de este medicamento, suspéndase y consulte al médico.

Este producto puede causar somnolencia. Durante su administración evítense actividades que impliquen coordinación y estados de alerta mental, como conducir vehículos u operar maquinarias.

Manténgase fuera del alcance de los niños.





Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"
Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

No exceda la dosis recomendada.

Antes de administrar este producto, leer prospecto interno.

CONTRAINDICACIONES: Alergia a los componentes de la fórmula.

SIN PRESCRIPCION FACULTATIVA.

11.2 SOLO PARA LAS PRESENTACIONES DE USO EN NIÑOS

USO PEDIATRICO

VIA DE ADMINISTRACION: Oral.

INDICACIONES: Tratamiento sintomático de la rinitis alérgica, la urticaria y otras afecciones dermatológicas alérgicas como la dermatitis atópica.

POSOLOGIA (Dosis recomendada):

Niños de 2 años (peso > 20 kg) a 12 años: 5 mg una vez al día

Niños de 2 años (peso < 20 kg): 2.5 mg una vez al día

ADVERTENCIAS:

No administrar a niños menores de 2 años.

Si los síntomas persisten y no se observa mejoría después de 2-3 días con el uso de este medicamento, suspéndase y consulte al médico.

Este producto puede causar somnolencia. Durante su administración evítense actividades que impliquen coordinación y estados de alerta mental.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

No exceda la dosis recomendada.

Antes de administrar este producto, leer prospecto interno.

CONTRAINDICACIONES: Alergia a los componentes de la fórmula.

SIN PRESCRIPCION FACULTATIVA



Gobierno Bolivariano
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la Salud

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"

