



# 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>

## 1. NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

LEVOCETIRIZINA

## 2. VA DE ADMINISTRACION

VIA ORAL

## 3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

**Grupo farmacoterapéutico:** Antihistamínicos para uso sistémico  
**Código ATC:** R06AE.09

### 3.1. Farmacodinamia

La levocetirizina es el enantiómero R activo de la mezcla racémica de cetirizina, un antihistamínico (2da. generación) piperazina-derivado de acción prolongada con actividad antagonista selectiva de los receptores H1 periféricos de histamina. Las propiedades farmacológicas de ambos principios son similares y no parece existir superioridad desde el punto de vista terapéutico del uno sobre el otro.

### 3.2. Farmacocinética

Luego de su administración oral, la levocetirizina se absorbe rápido en el tracto gastrointestinal, generando concentraciones plasmáticas pico en aproximadamente 0.9 horas, alcanzando el estado estable con la dosificación continua en 2 días. La presencia de alimentos en el tubo digestivo retrasa ligeramente la absorción, pero no su magnitud.

No se conoce bien su distribución a los tejidos y fluidos corporales. Exhibe un volumen aparente de distribución es de 0.4-0.6 L/kg y una unión a proteínas plasmáticas de 90%.

Se metaboliza parcialmente (menos de un 14% de la dosis) por oxidación de compuestos aromáticos (mediada por isoenzimas del citocromo P450 aun no identificadas), desalquilación (mediada por CYP3A4) y conjugación de taurina, dando lugar a productos inactivos que se excretan, junto a la levocetirizina no metabolizada, en un 85.4% por la orina (mediante filtración glomerular y secreción tubular) y un 12.9% por las heces. Su vida media de eliminación terminal es de 8-10 horas y se incrementa en pacientes con insuficiencia renal.





## 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>

### 3.3. Información pre-clínica sobre seguridad

Aunque no se han realizado estudios del potencial carcinogénico de la levocetirizina, los resultados obtenidos en tal sentido con la cetirizina aplican por analogía a la levocetirizina. Así, en ratones expuestos por 2 años a dosis orales de cetirizina de 16 mg/kg/día (6 veces superiores a sus equivalentes en humanos) se registró una incidencia incrementada de tumores hepáticos benignos sólo en los machos. Sin embargo, en un ensayo similar pero en ratas con dosis de hasta 20 mg/kg/día (15 veces superiores a sus equivalentes en humanos) no se evidenció tumorigenicidad. Se desconoce la relevancia clínica de estos hallazgos.

Los ensayos de mutagenicidad con levocetirizina resultaron negativos.

En los estudios de toxicidad reproductiva no hubo evidencias de teratogenicidad, fetotoxicidad ni efectos adversos sobre la fertilidad con levocetirizina.

### 4. INDICACIONES

Tratamiento de la rinitis alérgica estacional, la rinitis alérgica perenne y la urticaria crónica idiopática.

### 5. POSOLOGIA

#### 5.1. Dosis

Tabletas, Comprimidos, Capsulas

Adultos y niños mayores de 12 años: 5 mg una vez al día.

Solución Oral (concentración 5 mg/mL):

Niños de 2 años a 12 años de edad: 2,5 mg (0,5 mL) una vez al día.

Adulto y niños mayores de 12 años: 5 mg (1 mL) una vez al día.

#### 5.2. Dosis máxima diaria

La dosis usual establecida. El uso de dosis superiores no genera beneficio alguno desde el punto de vista terapéutico y, por el contrario, podrían ocasionar efectos adversos.

#### 5.3. Dosis en pacientes especiales

**Insuficiencia renal:** Se debe ajustar la dosis con base en la tasa de depuración de creatinina del paciente cuando ésta sea menor de 80 mL/min como a continuación se propone:





## 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>

- Depuración de creatinina entre 50 y 80 mL/min: 2.5 mg diarios.
- Depuración de creatinina entre 30 y 50 mL/min: 2.5 mg cada 2 día.
- Depuración de creatinina entre 10 y 30 mL/min: 2.5 mg cada 3-4 día.
- Depuración de creatinina < 10 mL/min: Contraindicado el uso.

Cuando sólo se dispone de la concentración sérica de creatinina, las siguientes fórmulas (basadas en el sexo, peso y edad del paciente) permiten calcular aproximadamente la tasa de depuración de creatinina a partir de dicho valor:

Depuración (mL/min) en Hombres:  $\text{Peso (kg)} \times (140 - \text{edad}) / (72) \times \text{creatinina sérica (mg/100 mL)}$

Depuración (mL/min) en Mujeres:  $(0.85) \times \text{Depuración en hombres.}$

**Insuficiencia hepática:** No se requieren ajustes de dosificación, salvo que co-exista insuficiencia renal (en cuyo caso se ajustará con base en la depuración de creatinina).

**Ancianos:** No se requieren ajustes de dosificación, salvo que exista insuficiencia renal (en cuyo caso se ajustará con base en la depuración de creatinina).

#### 5.4. Modo de empleo o forma de administración

Administrar por vía oral acompañado con agua, con o sin las comidas.

#### 6. REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas se han clasificado por su frecuencia en:

- Muy frecuentes (>1/10)
- Frecuentes (>1/100, <1/10)
- Poco frecuentes (>1/1000, <1/100)
- Raras (>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 gastrointestinales

Frecuentes: Sequedad de la boca.

Poco frecuentes: Dolor abdominal.





## 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>

Frecuencia no conocida: Náuseas, vómitos, diarrea, constipación, alteraciones del gusto.

### **Trastornos hepato-biliares**

Frecuencia no conocida: Alteración en las pruebas de función hepática, hepatitis.

### **Trastornos del metabolismo y de la nutrición**

Frecuencia no conocida: Apetito incrementado, aumentos de peso.

### **Trastornos renales y urinarios**

Frecuencia no conocida: Retención urinaria, disuria.

### **Trastornos cardiovasculares**

Frecuencia no conocida: Palpitaciones, taquicardia, edema periférico.

### **Trastornos del sistema nervioso**

Frecuentes: Cefalea, somnolencia.

Frecuencia no conocida: Agitación, agresividad, depresión, mareo, temblor, insomnio, parestesias, ideación suicida, alucinaciones, convulsiones.

### **Trastornos respiratorios**

Poco frecuentes: Nasofaringitis, tos, epistaxis.

Muy raras: Disnea.

### **Trastornos músculo-esqueléticos**

Frecuencia no conocida: Mialgia.

### **Trastornos del oído y laberinto**

Muy raras: Otitis media.

Frecuencia no conocida: Vértigo.

### **Trastornos oculares**

Frecuencia no conocida: Visión borrosa, trastornos oculares, diplopía.

### **Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo**

Frecuencia no conocida: Angioedema, erupción, prurito, urticaria.

### **Trastornos del sistema inmunológico**

Muy raras: Reacciones de hipersensibilidad, anafilaxia.





## 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>

### **Trastornos generales**

Frecuentes: Fatiga.

Poco frecuentes: Astenia.

Frecuencia no conocida: Fiebre.

## **7. INTERACCIONES**

### **7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas**

No se han realizado estudios de interacción con levocetirizina, ni se conoce de reportes o notificaciones en tal sentido. Con la mezcla racémica de cetirizina solo vale referir una reducción del 16% en la depuración de cetirizina durante su co-administración con teofilina, así como un aumento de su concentración plasmática y del tiempo de vida media al administrarse conjuntamente con ritonavir.

Aunque no se dispone de evidencia clínica, se presume que su co-administración con depresores del sistema nervioso central o con bebidas alcohólicas podría resultar en un efecto depresor aditivo.

### **7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio**

Los antihistamínicos, en general, pueden alterar los resultados de 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**

En algunos pacientes la levocetirizina puede provocar depresión del sistema nervioso central (somnolencia, mareos, astenia) lo cual podría comprometer la capacidad y/o habilidad para conducir vehículos u operar maquinarias. Los pacientes deben ser informados al respecto.

Durante el tratamiento se debe evitar el consumo de bebidas alcohólicas.

Dado que ha reportado retención urinaria con el uso de levocetirizina, se recomienda precaución en pacientes con factores que predisponen a dicha condición (como la hipertrofia prostática). Se debe instruir a los pacientes a suspender el producto e informar al médico si se presenta retención urinaria durante la terapia.

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





## 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>

### 8.2. Embarazo

Aunque no se ha evidenciado teratogenicidad en ensayos experimentales con levocetirizina, no existen estudios clínicos adecuados que demuestren su seguridad en mujeres embarazadas. No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche de su existencia a menos que el balance riesgo/beneficio sea favorable.

### 8.3. Lactancia

Con base en lo observado con la mezcla racémica de cetirizina, cabe esperar que la levocetirizina se excrete en la leche materna. Por ello y debido a que no se conocen 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. No se administre durante la lactancia a menos que el medico lo indique.

## 9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a la cetirizina o a los constituyentes de la formulación.  
Insuficiencia renal severa (depuración de creatinina < 10 mL/min).

## 10. SOBREDOSIS

### 10.1. Signos y síntomas

Se ha documentado sobredosificación de levocetirizina con síntomas que incluyen: somnolencia en adultos y agitación e inquietud en niños, seguidos por somnolencia. Con sobredosis de cetirizina se ha reportado: cefalea, confusión, mareos, fatiga, nerviosismo, irritabilidad, sedación, somnolencia, estupor, taquicardia, temblores, visión borrosa y retención urinaria.

### 10.2. Tratamiento

En casos de ingestión reciente (menos de 60 minutos) de una dosis masiva, considerar medidas orientadas a prevenir la absorción gastrointestinal del fármaco (emesis o lavado gástrico, según la condición del paciente, más carbón activado). Tratamiento sintomático y de soporte. La hemodiálisis es inefectiva.





## 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>

### 11.- TEXTOS DE EMPAQUES Y ETIQUETAS

#### 11.1- TEXTOS DE EMPAQUES Y ETIQUETAS (ORAL)

VIA DE ADMINISTRACION: Oral.

INDICACION Y POSOLOGIA: A juicio del facultativo

ADVERTENCIAS:

Producto de uso delicado que debe ser administrado bajo vigilancia médica.  
No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia ni durante la lactancia, a menos que el médico lo indique.

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

Con el uso de este producto no ingiera bebidas alcohólicas, ni sedantes.

No exceda la dosis prescrita.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

Antes de administrar este producto, leer prospecto interno.

PRECAUCIONES:

En conductores de vehículos y operadores de maquinarias.

CONTRAINDICACIONES:

Alergia a los componentes de la fórmula.

CON PRESCRIPCION FACULTATIVA

#### 11.2. TEXTOS DE ESTUCHES Y ETIQUETAS (USO PEDIATRICO)

USO PEDIATRICO

VIA DE ADMINISTRACION: Oral.

INDICACION Y POSOLOGIA: A juicio del facultativo

ADVERTENCIAS:

Producto de uso delicado que debe ser administrado bajo vigilancia médica.

Este producto puede ocasionar somnolencia. Evítense actividades que impliquen coordinación y estados de alerta mental.

No exceda la dosis prescrita.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

Antes de administrar este producto, leer prospecto interno.

CONTRAINDICACIONES:

Alergia a los componentes de la fórmula.

CON PRESCRIPCION FACULTATIVA

