

DEGRALER®
DEGRALER FORTE
DEGRALER® PLUS

(Levocetirizina)

Comprimidos, jarabe, gotas, comprimidos bucodispersables
 Antialérgico - Antihistamínico

COMPOSICIÓN:

COMPRIMIDO RECUBIERTO cada uno contiene:

Levocetirizina diclorhidrato 5 mg.

JARABE: Cada 5 ml de JARABE contiene: Levocetirizina diclorhidrato 2,5 mg; c.s.

JARABE FORTE: Cada 5 ml de JARABE contiene:

Levocetirizina diclorhidrato 5 mg; c.s.

Cada **COMPRIMIDO BUCODISPERSABLE** contiene:

Levocetirizina diclorhidrato 5 mg.

Excipientes: Listado de excipientes de acuerdo a fórmula autorizada en el registro sanitario.

INDICACIONES TERAPÉUTICAS:

INDICACIONES: La levocetirizina está indicada en la prevención y tratamiento de síndromes alérgicos cutáneos y de las vías aéreas.

DOSIS Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN:

Usos

Rinitis alérgica estacional (incluyendo síntomas oculares).

Rinitis alérgica perenne.

Urticaria crónica idiopática.

POSOLOGÍA Y MODO DE ADMINISTRACIÓN:

El comprimido recubierto se administra por vía oral, tragándolo entero con la ayuda de líquidos, y se puede tomar tanto en ayunas como con alimentos. Se recomienda que la dosis diaria se administre en una sola toma.

Uso en niños de 6 a 12 meses: 0,125 mg/kg cada 12 horas o una dosis al día de 0,25 m/kg.

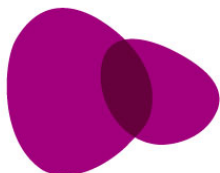
Uso en niños de 1 a 6 años: 2,5 ml una vez al día. Uso en adultos y niños a partir de los 6 años:

La dosis diaria recomendada es de 5 mg (1 comprimido recubierto). Uso en adulto mayor: Se recomienda ajustar la dosis en adulto mayor con insuficiencia renal leve a moderada (Ver más abajo). Uso en pacientes con insuficiencia renal: Los intervalos de dosificación se deberán individualizar de acuerdo con la función renal. Para utilizar esta tabla de dosificación, es preciso disponer de una estimación de la aclaramiento de creatinina (CLcr) del paciente, en ml/min. El valor se puede estimar a partir de la determinación de creatinina en suero (mg/dL) mediante la siguiente fórmula:

$$CLcr = \frac{140 - \text{año edad} \times \text{peso (kg)} \times 0,85 \text{ para mujeres}}{72 \times \text{creatinina en suero (mg /dL)}}$$

Ajuste de dosis en pacientes con insuficiencia renal:

| GRUPO | CLEARANCE CREATININA (mL/min) | DOSIS y FRECUENCIA |
|---|-------------------------------|----------------------------------|
| Normal | >80 | 1 cp. Una vez al día |
| Leve | 50 - 79 | 1 cp. Una vez al día |
| Moderada | 30 - 49 | 1 cp. Una vez al día cada 2 días |
| Severa | <30 | 1 cp. Una vez al día cada 3 días |
| Enfermedad renal terminal - pacientes que requieren diálisis. | <10 | Contraindicado |



Uso en pacientes con insuficiencia hepática: No es preciso ajustar la dosis en pacientes que solo tengan insuficiencia hepática. Si se recomienda ajustar en pacientes con insuficiencia renal y hepática (ver tabla anterior). Duración del tratamiento: La duración del tratamiento depende del tipo, duración y curso de los síntomas. Para la fiebre del heno es de 3 a 6 semanas, y en caso de exposiciones al polen durante cortos períodos de tiempo, una semana puede ser suficiente. Actualmente se dispone de experiencia clínica con comprimidos de 5 mg de levocetirizina durante un período de 4 semanas. Para urticaria de hasta un año con el compuesto racémico y 18 meses en pacientes con prurito asociado con dermatitis atópica.

Para los comprimidos bucodispersable:

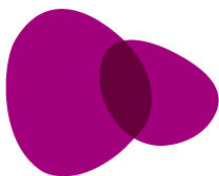
Uso en adultos y niños mayores de 12 años: La dosis diaria recomendada es de 5 mg (1 comprimido bucodispersable). Duración del tratamiento: La duración del tratamiento depende del tipo, duración y curso de los síntomas. Modo de administración: DEGRALER® PLUS comprimidos bucodispersables se administra por vía oral. Debe sacar cuidadosamente el comprimido del blister y colocarlo sobre la lengua para su desintegración. Los comprimidos bucodispersables se desintegran rápidamente en la boca, así que pueden ser fácilmente tragados con o sin agua. Se puede tomar tanto en ayunas como con alimentos, de preferencia por las noches. Se recomienda que la dosis diaria se administre en una sola toma.

RECOMENDACIONES:

Precauciones: Se recomiendan bajas dosis en pacientes con cirrosis hepática debido a que el clearance del fármaco se reduce significativamente. Se recomienda no administrar conjuntamente con depresores del sistema nervioso central, por el potencial riesgo de aumento en la sedación y somnolencia.

ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES: En ensayos clínicos la incidencia de somnolencia, fatiga y astenia se ha reportado en algunos pacientes con tratamiento con levocetirizina. Los pacientes deben ser advertidos de la participación en ocupaciones peligrosas que requieren vigilancia mental completa, y la coordinación motora, como utilizar maquinaria o conducir un vehículo motorizado después de la ingestión de levocetirizina. El uso simultáneo de levocetirizina y alcohol u otros depresores del sistema nervioso central se debe evitar porque pueden ocurrir adicionalmente reducciones en la lucidez mental y deterioro del rendimiento del sistema nervioso central. En pacientes con insuficiencia renal moderada a severa, la dosis diaria debe ser personalizada de acuerdo con la función renal basada en la depuración de la creatinina (ver Posología y Modo de Administración).

Embarazo y lactancia: No hay resultados clínicos disponibles de exposición a la levocetirizina durante el embarazo. Los estudios en animales no indican directa o indirectamente los efectos dañinos sobre el embarazo, el desarrollo embrionario y fetal, el parto y el desarrollo postnatal. No debe utilizarse durante el embarazo a menos que sea estrictamente necesario. Se espera que la levocetirizina se excrete en la leche materna, por lo que no se recomienda su uso durante la lactancia. Sólo debe considerarse su uso cuando el beneficio esperado para la madre sea mayor que cualquier riesgo teórico que pueda sufrir el lactante. Uso durante el embarazo y la lactancia Embarazo: Los datos disponibles sobre el número limitado de embarazadas indican que cetirizina no tiene efectos sobre el embarazo o sobre la salud del feto/ recién nacido. Hasta la fecha no se dispone de más datos epidemiológicos relevantes. No se dispone de datos de levocetirizina en mujeres embarazadas. Estudios clínicos en animales no indican efectos nocivos directos o indirectos sobre el embarazo, desarrollo embrional/ fetal, parto o desarrollo post-natal. Se recomienda su uso durante el embarazo, sólo si el beneficio supera los riesgos de su administración para el feto. Lactancia: Se espera que la levocetirizina se excrete por la leche materna, por lo que no se recomienda su uso durante la lactancia.



MECANISMO DE ACCIÓN:

ACCIONES FARMACOLÓGICAS

Propiedades farmacodinámicas: La levocetirizina, el enantiómero (R) de la cetirizina, es un antagonista potente y selectivo de los receptores H1 periféricos. Los estudios de afinidad han demostrado que la levocetirizina presenta una elevada afinidad por los receptores H1 humanos ($K_i = 3,2$ nmol/l). La afinidad de la levocetirizina es dos veces mayor que la de la cetirizina ($K_i = 6,3$ nmol/l). La levocetirizina se disocia de los receptores H1 con una vida media de 115 ± 38 min. Los estudios farmacodinámicos realizados en voluntarios sanos han demostrado que con la mitad de la dosis, levocetirizina presenta una actividad comparable a la de la cetirizina. Relación farmacocinética/farmacodinámica: 5 mg de levocetirizina proporcionan un patrón de inhibición similar al de 10 mg de cetirizina. Al igual que sucede con la cetirizina, la acción sobre las reacciones cutáneas inducidas por la histamina no está relacionada con las concentraciones en plasma.

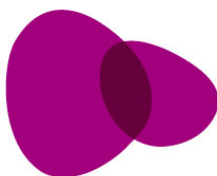
PROPIEDADES FARMACOCINÉTICAS: Las propiedades farmacocinéticas de la levocetirizina son lineales con las dosis e independiente del tiempo, con una baja variabilidad entre sujetos. El perfil farmacocinético es el mismo cuando se administra como enantiómero único o como cetirizina. La levocetirizina es rápida y ampliamente absorbida tras ser administrada por vía oral. Las concentraciones máximas en plasma se alcanzan 0,9 horas tras la administración. El estado de equilibrio se alcanza dos días más tarde. Las concentraciones máximas suelen ser 270 ng/ml y 308 ng/ml tras la administración de una dosis única de 5 mg y una dosis repetida de 5 mg cada día, respectivamente. El grado de absorción es independiente de la dosis y no se modifica con la comida, pero reduce y retrasa el pico de concentración. La vida media en plasma y en adultos es de $7,9 \pm 1,9$ horas. El clearance medio total aparente es de 0,63 ml/min/kg. La orina es la principal vía de excreción de levocetirizina y sus metabolitos, por ella se elimina alrededor del 85,4% de la dosis. Sólo el 12,9% de la dosis se excreta por las heces. Levocetirizina se excreta tanto por filtración glomerular como por secreción tubular activa.

REACCIONES ADVERSAS:

Efectos secundarios: Estudios clínicos comparativos no han mostrado evidencias que levocetirizina produzca alteraciones de la atención, la capacidad de reacción y la habilidad para conducir vehículos motorizados a la dosis recomendada. Sin embargo, se recomienda que los pacientes que vayan a conducir, realizar actividades potencialmente peligrosas o utilizar maquinaria no superen la dosis recomendada y que tengan en cuenta su respuesta al fármaco. Los efectos adversos, entre leve y moderados (por sobre el 1%), más frecuentemente descritos son: sequedad de la boca, dolor de cabeza, fatiga y somnolencia. Se observaron otras reacciones adversas poco corrientes (no frecuentes), como astenia o dolor abdominal. Se recomienda que los pacientes que vayan a conducir, realizar actividades potencialmente peligrosas o utilizar maquinaria no superen la dosis recomendada y que tengan en cuenta su respuesta al fármaco.

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS Y DE OTROS TIPOS:

No se han realizado estudios de interacción con levocetirizina (incluyendo estudios con inductores CYP3A4). Estudios realizados con el compuesto racémico cetirizina han demostrado que no existen interacciones clínicamente relevantes (con pseudoefedrina, cimetidina, ketoconazol, eritromicina, glizipida y diazepam). En un estudio de dosis múltiples con teofilina 400 mg, una vez al día, se observó una ligera disminución (16%) en la aclaración de cetirizina mientras que la disposición de teofilina no se alteró con la administración concomitante de cetirizina. La absorción de levocetirizina no se reduce con la comida, pero la velocidad de absorción se disminuye. En pacientes sensibles, la administración conjunta con alcohol u otros depresores del SNC puede producir efectos sobre el sistema nervioso central, aunque se ha demostrado que el racémico de cetirizina no potencia el efecto del alcohol. Ritonavir aumentó el AUC plasmática de cetirizina en un 42% acompañado de un aumento en la vida media (53%) y una disminución del aclaramiento (29%) de la cetirizina.



La disposición de ritonavir no ha sido alterada por la administración concomitante de cetirizina.

CONTRAINDICACIONES:

Pacientes que han demostrado hipersensibilidad a levocetirizina, a cualquier derivado piperogénico o a cualquier otro componente de la formulación. Pacientes con enfermedad renal terminal (clearance de creatinina inferior a 10 ml/min) y en pacientes sometidos a hemodiálisis. Pacientes de 6 meses a 11 años de edad con insuficiencia renal.

MANIFESTACIONES Y MANEJO DE LA SOBREDOSIFICACIÓN O INGESTA ACCIDENTAL:

Sobredosis: Los síntomas de sobredosis pueden incluir en adultos somnolencia y en niños inicialmente agitación e inquietud, seguido por somnolencia. No se conoce ningún antídoto específico para levocetirizina. En caso de sobredosis, se recomienda tratamiento sintomático o de soporte. Levocetirizina no se elimina por diálisis y por lo tanto, la diálisis será ineficaz a menos que se ingiera concomitantemente un agente dializable. La dosis oral máxima no letal de levocetirizina fue de 240 mg/kg en ratones (aproximadamente 190 veces la dosis diaria máxima por vía oral recomendada en adultos, aproximadamente 230 veces la dosis máxima diaria oral recomendada en niños de 6 a 11 años de edad, y aproximadamente 180 veces la dosis máxima diaria oral recomendada en niños de 6 meses a 5 años de edad sobre una base mg/m²). En ratas, la dosis máxima oral no letal fue de 240 mg/kg (aproximadamente 390 veces la dosis máxima recomendada diaria oral en adultos, aproximadamente 460 veces la dosis máxima recomendada diaria oral en niños de 6 a 11 años de edad, y aproximadamente 370 veces la dosis máxima recomendada diaria oral en niños de 6 meses a 5 años de edad sobre una base mg/m²).

PRESENTACIÓN:

Presentaciones

Envases conteniendo 10 **comprimidos recubiertos** de 5 mg cada uno.

Jarabe: Envase conteniendo 100 ml, cada 5 ml contiene 2,5 mg de levocetirizina.

Jarabe fuerte: Envase 100 ml, cada 5 ml contiene 5 mg de levocetirizina.

Gotas: Envase conteniendo 15 ml. 1 ml (24 gotas) con 5 mg de levocetirizina.

Comprimidos bucodispersables: Envase de 10 comprimidos.

Información complementaria a su disposición en la Dirección Médica de Laboratorios Bagó.

LABORATORIOS BAGÓ DEL ECUADOR S.A.

Quito: Lizardo García E1080 y

Av. 12 de Octubre, Edificio Alto Aragón.

T: (593-2) 400-2400 Fax (593-2) 400-2401

Correo Electrónico: dmedica@bago.com.ec

www.bago.com.ec

