

**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL  
DEGRALER FORTE JARABE 5 mg/5mL**

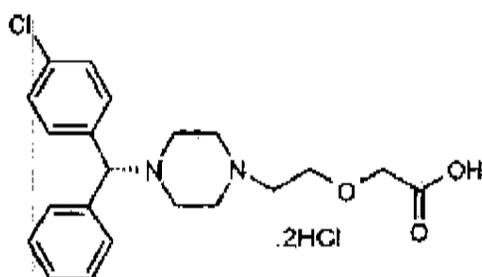
**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL**

**COMPOSICIÓN:**

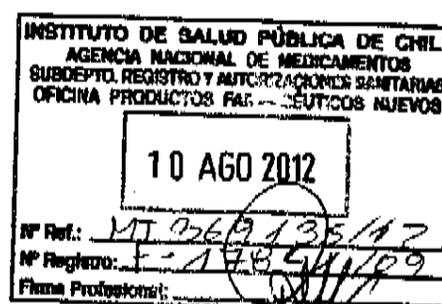
Cada 5 mL de jarabe contiene:

Levocetirizina diclorhidrato 5 mg

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

**FÓRMULA QUÍMICA ESTRUCTURAL:**

Levocetirizina diclorhidrato

**CLASIFICACIÓN TERAPÉUTICA:**

**CÓDIGO ATC:** R06A E09

Antialérgico-antihistamínico

**ACCIONES FARMACOLÓGICAS:****Propiedades farmacodinámicas**

La levocetirizina, el enantiómero (R) de la cetirizina, es un antagonista potente y selectivo de los receptores  $H_1$  periféricos. Los estudios de afinidad han demostrado que la levocetirizina presenta una elevada afinidad por los receptores  $H_1$  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  $H_1$  con una vida media de  $115 \pm 38$  min.

**FOLLETO DE INFORMACION  
AL PROFESIONAL**

**Ref.: MT369135/12**

**Reg. I.S.P. N° F-17841/09**

**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL  
DEGRALER FORTE JARABE 5 mg/5mL**

---

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.

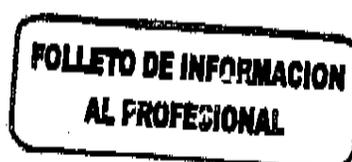
La vida media en plasma y en adultos es de  $7,9 \pm 1,9$  horas. El clearance medio total aparente es de 0,63 ml/min/kg. La orina es la principal vía de excreción de levocetirizina y sus metabolitos, por ella se elimina alrededor del 85,4% de la dosis. Sólo el 12,9% de la dosis se excreta por las heces. Levocetirizina se excreta tanto por filtración glomerular como por secreción tubular activa.

**INDICACIONES:**

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

**USOS:**

Rinitis Alérgica estacional (incluyendo síntomas oculares)  
Rinitis alérgica perenne  
Urticaria crónica idiopática



**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL  
DEGRALER FORTE JARABE 5 mg/5mL****POSOLÓGÍA Y MODO DE ADMINISTRACIÓN:**

Uso en adultos y adolescentes a partir de los 12 años: La dosis diaria recomendada es de 5 mg (5 mL)

*Niños de 6 a 11 años. La dosis diaria recomendada es de 2,5 mg (2,5 mL)*

*Niños de 6 meses a 5 años. La dosis diaria recomendada es de 1,25 mg (1,25 mL)*

Uso en ancianos: Se recomienda ajustar la dosis en ancianos 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:

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

**Ajuste de dosis en pacientes con insuficiencia renal:**

*En adultos y niños de 12 años en adelante:*

*Insuficiencia renal leve (clearance de creatinina = 50-80 mL/min) se recomienda 2,5 mg (2,5 mL) una vez al día.*

*Insuficiencia renal moderada (clearance de creatinina = 30-49 mL/min): se recomienda 2,5 mg (2,5 mL) una vez cada dos días.*

*Insuficiencia renal grave (clearance de creatinina = 10-29 mL/min): se recomienda 2,5 mg (2,5 mL) dos veces por semana (administrada cada 3 o 4 días)*

*Los pacientes en etapa terminal de la enfermedad renal (clearance de creatinina menor a 10 mL/min) y pacientes sometidos a hemodiálisis no deben recibir levocetirizina.*

**Uso en pacientes con insuficiencia hepática.** No es preciso ajustar la dosis en pacientes que sólo tengan insuficiencia hepática. Si, se recomienda ajustar en pacientes que poseen conjuntamente insuficiencia renal y hepática.

**FOLLETO DE INFORMACION  
AL PROFESIONAL**

**Ref.: MT369135/12**

**Reg. I.S.P. N° F-17841/09**

**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL  
DEGRALER FORTE JARABE 5 mg/5mL**

---

*Duración del tratamiento:* La duración del tratamiento depende del tipo, duración y curso de los síntomas.

**CONTRAINDICACIONES:**

Hipersensibilidad a levocetirizina, o a cualquier derivado piperogénico  
Pacientes con enfermedad renal terminal con un clearance de creatinina inferior a 10 ml/min.

**EFFECTOS SECUNDARIOS:**

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.

**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 combinación 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 deben 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 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 de efectos dañinos sobre el embarazo, el desarrollo embrionario y fetal, el parto y el desarrollo postnatal. No debe utilizarse en el embarazo, a menos que sea estrictamente necesario. Se espera que levocetirizina se excrete en la

**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL  
DEGRALER FORTE JARABE 5 mg/5mL**

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 puede sufrir el lactante.

**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 aumenta el AUC plasmático de cetirizina en un 42% acompañada 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.

**PRESENTACIONES:**

(Las autorizadas en el registro)

**FOLLETO DE INFORMACION  
AL PROFESIONAL**

**Ref.: MT369135/12**

**Reg. I.S.P. N° F-17841/09**

**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL  
DEGRALER FORTE JARABE 5 mg/5mL**

**BIBLIOGRAFÍA:**

1. Levocetirizine: from scientific evidence to a potent modern-day treatment of today's allergic patients. Klimek L. *Drugs Today (Barc)*. 2009 Mar;45(3):213-25.
2. Comparison of the efficacy of levocetirizine 5 mg and desloratadine 5 mg in chronic idiopathic urticaria patients. Potter PC, Kapp A, Maurer M, Guillet G, Jian AM, Hauptmann P, Finlay AY. *Allergy*. 2009 Apr;64(4):596-604. Epub 2008 Nov 11.
3. Management of persistent allergic rhinitis: evidence-based treatment with levocetirizine. Mullol J, Bachert C, Bouquet J. *Ther Clin Risk Manag*. 2005 Dec;1(4):265-71.
4. Levocetirizine: The latest treatment option for allergic rhinitis and chronic idiopathic urticaria. Dubuske LM. *Allergy Asthma Proc*. 2007 Nov-Dec;28(6):724-34. Review.
5. Retrospective population pharmacokinetics of levocetirizine in atopic children receiving cetirizine: the ETAC@studyZiad Hussein, Maria Pitsiu, Oneeb Majid, Leon Aarons, Marc de Longueville & Armel Stockis, on behalf of the ETAC@Study Group Medeval Ltd, Manchester, UK, University of Manchester, UK and UCB S.A. Pharma Sector, Brussels, Belgium Br. *J. Clin. Pharmacol*, Vol 59, (1), p 28-37, 2005.
6. Levocetirizine in 1-2 year old children: Pharmacokinetic and pharmacodynamic profile Cranswick et al. Australia. *International Journal of Clinical Pharmacology and Therapeutics*, 2005, 43/4 (172-177)
7. Population pharmacokinetics of levocetirizine in very young children: the pediatricians' perspective. Dr. F.E.R. Simons, on behalf of the ETAC study Group. *Pediatric Allergy and Immunology*, 2005, 16:97-103.
8. Levocetirizine in children: Evidenced efficacy and safety in a 6-week randomized seasonal allergic rhinitis trial De Blic J.; Wahn U.; Billard E.; Alt R.; Pujazon M.-C. *Pediatric Allergy and Immunology*, 2005, Volume: 16, Number: 3, Page: 267-275.
9. Levocetirizine: pharmacokinetics and pharmacodynamics in children age 6-11 years. F.E.R. Simons, MD, FRCPC, and Keith J, Simons. *J. Allergy Clin. Immunol* 2005; 116:355-61.
10. A double-blind, randomized, single-dose, crossover comparison of levocetirizine with ebastine, fexofenadine, loratadine, mizolastine, and placebo: Suppression of histamine-induced wheal-and-flare response during 24 hours in healthy male subjects. Dr. J.A. Grant, University of Texas Medical Branch, Medical Research Building, 301 University Boulevard, Galveston, TX 77555-1083, United States. *Annals of Allergy, Asthma and Immunology ( ANN. ALLERGY ASTHMA IMMUNOL. ) (United States)*, ^2002, 88/2 (190-197).
11. Levocetirizine in allergic diseases - An open multicenter practice study on efficacy and safety LEVOCETIRIZIN BEI ALLERGISCHEN ERKRANKUNGEN: EINE OFFENE MULTIZENTRISCHE PRAXISSTUDIE ZUR WIRKSAMKEIT UND VERTRAGLICHKEIT. Dr. L. Klimek, HNO, Allergologie, Umweltmedizin, An den Quellen 10, D-65183 Wiesbaden, Germany *Allergologie ( ALLERGOLOGIE ) (Germany)*, ^2002, 25/1 (S1-S7).
12. Efficacy and safety of levocetirizine in seasonal allergic rhinitis. Prof. F. Leynadier, Centre d'Allergologie, Hopital TENON (AP-HP), 20, rue de la Chine, F-75970 Paris, France. *Acta Oto-Rhino-Laryngologica Belgica ( ACTA OTO-RHINO-LARYNGOL. BELG. ) (Belgium)*, ^2001, 55/4 (305-312).