

Forma de conservación

- Conservar en lugar fresco y seco, preferentemente entre 15 y 30°C.
- Mantener alejado del alcance de los niños.

Dirección Técnica: Dr. Luis M. Radici – Farmacéutico.
MEDICAMENTO AUTORIZADO POR EL MINISTERIO DE SALUD.
Certificado N° 48.720
Laboratorios CASASCO S.A.I.C.
Boyacá 237 - Buenos Aires

ALERCAS® 60



COMPRIMIDOS
RECUBIERTOS

FEXOFENADINA CLORHIDRATO

Industria Argentina
Venta Bajo Receta

Fórmula

Cada comprimido recubierto contiene: fexofenadina clorhidrato 60,00 mg. Excipientes: almidón de maíz 30,00 mg; lactosa 88,00 mg; povidona K-30 6,40 mg; croscarmelosa sódica 10,00 mg; estearato de magnesio 2,00 mg; talco 5,01 mg; hidroxipropilmetilcelulosa E-15 2,81 mg; polietilenglicol 6000 1,20 mg; propilenglicol 0,57 mg; bióxido de titanio 3,81 mg; sacarina sódica 0,16 mg; óxido de hierro rojo 0,04 mg

Acción Terapéutica: antagonista de los receptores H1 de la histamina.

Indicaciones: rinitis alérgica estacional. Urticaria crónica idiopática.

Acción Farmacológica: fexofenadina clorhidrato es un antihistamínico con actividad antagonista periférica selectiva de los receptores H1 de la histamina. Inhibe el broncoespasmo inducido por antígenos en cobayos sensibilizados y la liberación de histamina de los mastocitos peritoneales en la rata. No se observaron efectos bloqueantes de los receptores colinérgicos o alfa 1 adrenérgicos en animales de laboratorio. No se observaron efectos sedantes ni otros efectos sobre el SNC. La fexofenadina no atraviesa la barrera hematoencefálica. Estudios en humanos demostraron que la fexofenadina posee un efecto antihistamínico durante la 1ª hora, alcanzado un efecto máximo a las 2-3 horas. No se registró evidencia de tolerancia a dichos efectos luego de 28 días de su administración. Tanto en estudios en animales como en humanos no se registraron alteraciones significativas del intervalo QTc.

Farmacocinética: después de su administración oral la fexofenadina se absorbe en voluntarios sanos alcanzando una concentración plasmática máxima a las 2,6 hs. Después de administrar una dosis de 120 mg por vía oral la concentración plasmática media fue de 427 ng/ml en voluntarios sanos. La farmacocinética fue lineal para dosis orales de hasta 120 mg dos veces por día. La vida media de eliminación es de 14,4 hs cuando se administran 60 mg dos veces por día. El 80% de la dosis se eliminó en materia fecal y el 11% se recuperó en la orina; aproximadamente el 5% de la dosis total fue metabolizada. La biodisponibilidad absoluta de fexofenadina no ha sido establecida, por lo tanto, se desconoce si el componente fecal representa la droga no absorbida o es el resultado de la excreción biliar. La farmacocinética en pacientes con rinitis alérgica fue similar a la de los individuos

E-0757-02 / D0186 / Act.: 12/2009

CASASCO

4

1

sanos. Las concentraciones plasmáticas máximas fueron similares entre adultos y adolescentes (12 a 16 años). El porcentaje de unión a las proteínas del plasma es de 60 a 70%, principalmente a la albúmina y a la alfa-1-glicoproteína ácida.

En pacientes ancianos (mayores de 65 años de edad), los niveles plasmáticos pico de fexofenadina fueron un 99% mayores a los que se observaron en voluntarios sanos (menores de 65 años de edad). La vida media de eliminación fue similar en ambos grupos.

En pacientes con insuficiencia renal leve (depuración de creatinina de 41-80 ml/min) a severa (depuración de creatinina 11-40 ml/min) las concentraciones plasmáticas máximas de fexofenadina fueron de 87% y 111% mayores, respectivamente y las vidas medias de eliminación fueron 59% y 72% más prolongadas, respectivamente, comparadas con las de voluntarios sanos. En pacientes con insuficiencia renal se recomienda una dosis inicial de 60 mg 1 vez por día.

En los pacientes con insuficiencia hepática no se observaron diferencias sustanciales con respecto a individuos sanos.

Posología y Modo de administración

Rinitis alérgica estacional: adultos y niños desde 12 años: 60 mg 2 veces por día ó 120 mg una vez al día.

En pacientes con disminución de la función renal se recomienda una dosis inicial de 60 mg/día.

Urticaria idiopática crónica: adultos y niños de 12 años: 180 mg una vez por día.

En pacientes con disminución de la función renal se recomienda una dosis inicial de 60 mg/día.

Contraindicaciones: hipersensibilidad a cualquiera de los componentes del producto.

Precauciones

Embarazo: no existen estudios adecuados y bien controlados en mujeres embarazadas. La fexofenadina solo debería usarse durante el embarazo si el beneficio potencial justifica los riesgos potenciales sobre el feto.

Lactancia: no existen estudios adecuados y bien controlados en mujeres durante la lactancia. Debido a que muchas drogas se excretan en leche materna, fexofenadina deberá administrarse con precaución a mujeres que amamantan.

Uso pediátrico: La seguridad y eficacia de la fexofenadina no ha sido establecida en pacientes pediátricos menores de 12 años de edad.

Uso en geriatría: los efectos adversos en este grupo de edad fueron similares en cuanto a su incidencia cuando se comparó con individuos jóvenes.

Interacciones medicamentosas: en dos estudios separados se evaluó la coadministración de fexofenadina 120 mg 2 veces por día con eritromicina 500 mg cada 8 hs y ketoconazol 400 mg 1 vez por día en voluntarios sanos. Estas combinaciones no produjeron aumentos en los efectos adversos o en el intervalo QTc.

Después de 7 días de coadministración se produjeron aumentos de la C_{max} de eritromicina en un 82% y del ketoconazol en un 135%. El área bajo la curva de concentración-tiempo aumentó en 109% para eritromicina y en un 164% para ketoconazol. Se desconocen los mecanismos de estas interacciones y la posibilidad de

interacción con otros antifúngicos azólicos o macrólidos no ha sido estudiada. Fexofenadina no tuvo efectos sobre la farmacocinética de la eritromicina o el ketoconazol.

Carcinogénesis, mutagénesis, alteraciones de la fertilidad: se evaluó el potencial carcinogénico y la toxicidad reproductiva de la fexofenadina empleando estudios de terfenadina con una adecuada exposición de fexofenadina (basado sobre valores plasmáticos del área bajo la curva) con dosis orales de 50 y 150 mg/kg de terfenadina durante 18 y 24 meses, respectivamente, y no se observaron evidencias de efectos carcinogénicos en ratones y ratas; estas dosis resultaron en valores plasmáticos de fexofenadina que llegaron hasta 4 veces el valor terapéutico humano (basado sobre una dosis de 60 mg dos veces al día de fexofenadina).

Estudios en animales in vitro e in vivo de fexofenadina no revelaron evidencia de mutagenicidad.

En estudios de fertilidad en ratas, se observaron reducciones en implantes relacionados con las dosis, e incrementos en la pérdida post-implantación a dosis orales de 150 mg/kg de terfenadina o mayores; estas dosis produjeron valores plasmáticos de fexofenadina iguales o mayores a 3 veces el valor terapéutico humano (basado sobre una dosis de 60 mg de fexofenadina dos veces por día).

Reacciones adversas: en estudios clínicos controlados con placebo que incluyeron 2461 pacientes que recibieron fexofenadina a dosis de 20 a 240 mg 2 veces por día, los efectos adversos fueron similares en pacientes tratados con la droga y aquellos que recibieron placebo. Los siguientes efectos adversos se registraron con una frecuencia mayor al 1% en los pacientes que recibieron una dosis de 60 mg 2 veces por día:

- Generales: fatiga.
- Sistema Nervioso: somnolencia.
- Sistema Gastrointestinal: náuseas, dispepsia.
- Sistema urogenital: dismenorrea.
- Sistema respiratorio: resfrió, gripe.

La cefalea y la irritación de la garganta fueron efectos adversos que se presentaron en más de 1% de los pacientes tratados con fexofenadina 60 mg dos veces por día, pero fueron más comunes en el grupo placebo.

Sobredosificación: en estudios clínicos se administraron dosis únicas de hasta 800 mg (6 voluntarios normales) y dosis de hasta 690 mg dos veces por día durante 1 mes (3 voluntarios normales), sin observarse el desarrollo de efectos adversos clínicamente significativos. En caso de sobredosis se recomienda tratamiento sintomático y de soporte de las funciones vitales. Se recomienda el empleo de las medidas adecuadas para eliminar la droga no absorbida.

La hemodiálisis no es efectiva para remover la droga de la sangre.

Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al Hospital más cercano o comunicarse con los Centros de Toxicología:

Hospital A. Posadas: (011) 4654-6648/4658-7777.

Optativamente otros Centros de Intoxicaciones.

Presentación: envases con 10 comprimidos recubiertos.

Fecha de última revisión: julio de 2007.

2

3