

Venta Bajo Receta
Industria Argentina

Fórmula

Cada 5 ml de suspensión oral contiene: fexofenadina clorhidrato 30,0 mg (equivalente a 28,0 mg de fexofenadina). Excipientes: poloxámero 407 2,5 mg; glicerina 800,0 mg; azúcar 1.000,0 mg; esencia de Tutti Fruti 1,5 mg; bioóxido de titanio 5,0 mg; sal disódica del ácido etilendiaminotetraacético 7,5 mg; metilparabeno 10,0 mg; propilparabeno 1,0 mg; propilglicol 300,0 mg; goma xántica 10,0 mg; fosfato sódico monohidratado 35,0 mg; fosfato sódico dibásico 30,0 mg; agua purificada c.s.p. 5 ml.

Acción Terapéutica: antihistamínico no sedativo. Antagonista de los receptores H1 de la histamina.

Indicaciones

Rinitis Alérgica Estacional

ALERCAS, Suspensión Oral, está indicada para el alivio sintomático de la rinitis alérgica estacional, en niños de 2 a 11 años de edad. Los síntomas tratados efectivamente fueron estornudos, rinorrea, picazón de nariz/paladar/garganta, picazón/lagrimeo/enrojecimiento ocular.

Urticaria Idiopática Crónica

ALERCAS, Suspensión Oral, está indicada para el tratamiento de las manifestaciones cutáneas sin complicaciones de la urticaria idiopática crónica en niños de 6 meses a 11 años de edad. Fexofenadina clorhidrato reduce significativamente el prurito y el número de pápulas.

Acción Farmacológica: fexofenadina clorhidrato, el principal metabolismo activo de terfenadina, es un antihistamínico con actividad antagonista selectiva periférica selectiva del receptor H1. Ambos enantiómeros de fexofenadina clorhidrato desarrollaron efectos antihistamínicos aproximadamente equipotentes. Fexofenadina clorhidrato inhibió el broncoespasmo inducido por el antígeno en cobayos sensibilizados y la liberación de histamina en células mastoideas peritoneales en la rata. Se desconoce la significación clínica de estos hallazgos. En animales de laboratorio, no se observaron efectos bloqueantes anticolinérgicos o alfa 1-adrenérgicos. No se observaron efectos sedativos u otros efectos sobre el sistema nervioso central. La fexofenadina no atraviesa la barrera hematoencefálica.

Farmacocinética

La farmacocinética de fexofenadina clorhidrato en pacientes con rinitis alérgica estacional y en pacientes con urticaria crónica fue similar a la de los probandos sanos.

Absorción: después de la administración de una dosis de 30 mg de Suspensión Oral de fexofenadina a probandos sanos, la C_{max} media fue de 118,0 ng/ml y se produjo a aproximadamente 1.0 hora. La administración de las comidas con alto contenido graso disminuye el AUC y la C_{max} media en aproximadamente 30 y 47%, respectivamente en adultos sanos.

Distribución: fexofenadina clorhidrato se une a las proteínas plasmáticas en un 60 a un 70%, principalmente albúmina y 1 glicoproteína ácida.

Metabolismo: Aproximadamente el 5% de la dosis total de fexofenadina clorhidrato se elimina por medio del metabolismo hepático.

Eliminación: la medida de la vida media de eliminación de fexofenadina es de 14,4 horas, después de la administración de 60 mg dos veces por día en probandos sanos. La recuperación es de aproximadamente el 80% y el 11% de la dosis de fexofenadina clorhidrato en heces y orina, respectivamente. Se desconoce si el componente fecal representa principalmente la droga no absorbida o el resultado de la excreción biliar.

Poblaciones especiales

Pacientes con Insuficiencia Renal: en pacientes con insuficiencia renal leve a moderada (clearance de creatinina de 41-80 ml/min) y severa (clearance de creatinina 11-40 ml/min), las concentraciones plasmáticas pico de fexofenadina fueron 87% y 111% mayores, respectivamente y la media de las vidas medias de eliminación fueron 59% y 72% más prolongadas, respectivamente, que las observadas en los pacientes sanos. Las concentraciones plasmáticas pico en pacientes con diálisis (clearance de creatinina 10 ml/min) fueron 82% mayores y la vida

media fue 31% más prolongada que la observada en pacientes sanos. Se recomienda para los pacientes pediátricos con disminución de la función renal, una dosis de inicio de fexofenadina de 30 mg una vez por día para los pacientes de 2 a 11 años de edad y de 15 mg una vez por día para los 6 meses a menos de 2 años (Ver Posología Modo de Administración).

Pacientes con insuficiencia hepática: la farmacocinética de fexofenadina en pacientes con enfermedad hepática no difiere substancialmente de la que se observó en pacientes sanos.

Pacientes Geriátricos: en pacientes mayores (< 65años de edad) los niveles plasmáticos pico de fexofenadina fueron 99% mayores de los que se observaron en pacientes más jóvenes (< 65 años de edad). La media de las vidas medias de eliminación de fexofenadina fue similar a la que se observó en pacientes más jóvenes.

Pacientes pediátricos: la administración de una dosis de 15 mg de fexofenadina clorhidrato a pacientes pediátricos de 6 meses a menos de 2 años de edad y una dosis de 30 mg a pacientes pediátricos de 2 a 11 años de edad produjeron exposiciones comparables a las observadas con una dosis de 60 mg administrada a adultos.

Efecto del sexo: no se observaron diferencias clínicamente significativas relacionadas con diferencias de sexo en la farmacocinética.

Farmacodinamia: la administración de una dosis de 15 mg de fexofenadina clorhidrato a pacientes pediátricos entre 6 meses a 2 años de edad y de 30 mg a pacientes entre 2 años a 11 años de edad produjeron exposiciones comparables a aquellas con una dosis de 60 mg en adultos.

Pápulas y erupciones: estudios de pápulas y erupciones cutáneas realizados en humanos por histamina después de las dosis diarias únicas y de dos veces al día de 20 y 40 mg de fexofenadina clorhidrato demostraron que la droga desarrolla un efecto antihistamínico en 1 hora, logra el efecto máximo a las 2 a 3 horas y se observa todavía un efecto a las 12 horas. No se produjo ninguna evidencia de tolerancia a estos efectos después de los 28 días de dosificación. Estudios de pápulas y erupciones cutáneas por histamina en pacientes de 7 a 12 años mostraron que después de una dosis única de 30 a 60 mg, el efecto antihistamínico se observó a 1 hora y alcanzó un máximo a las 3 horas. Una inhibición mayor del 49% del área con pápulas y una inhibición del 74% del área con erupción se mantuvieron durante 8 horas después de la dosis de 30 y 60 mg.

Efecto sobre el intervalo QTc: en perros (30 mg/kg por vía oral dos veces por día durante 5 días) y conejos (10 mg/kg por vía endovenosa durante 1 hora), fexofenadina clorhidrato no prolongó el intervalo QTc. En perros, la concentración plasmática de fexofenadina fue aproximadamente 9 veces las concentraciones plasmáticas terapéuticas en adultos que recibieron la dosis oral diaria máxima recomendada en humanos de 180 mg. En conejos, la concentración plasmática de fexofenadina fue de aproximadamente 20 veces la concentración plasmática terapéutica en adultos que reciben la dosis oral diaria máxima recomendada en humanos de 180 mg. No se observó ningún efecto sobre la corriente de la cadena del calcio, la corriente lenta del canal K⁺ clonado del corazón humano a concentraciones de hasta 1 x 10⁵ M de fexofenadina.

No se observó ningún aumento estadísticamente significativo en la media del intervalo QTc comparado con placebo en 714 pacientes con rinitis alérgica estacional que recibieron cápsulas de fexofenadina clorhidrato en dosis de 60 a 240 mg dos veces por día durante 2 semanas. Los pacientes pediátricos provenientes de 2 ensayos controlados con placebo (n = 855) tratados con hasta 60 mg de fexofenadina clorhidrato dos veces por día no demostraron ningún aumento en el intervalo QTc relacionado con el tratamiento o con la dosis. Además, no se observó ningún aumento estadísticamente significativo en la media del intervalo QTc en comparación con placebo en 40 pacientes sanos que recibieron fexofenadina clorhidrato como solución oral a dosis de hasta 400 mg dos veces por día durante 6 días, o en 230 pacientes sanos que recibieron fexofenadina clorhidrato 240 mg una vez por día durante 1 año. En pacientes con urticaria idiopática crónica, no se registraron diferencias clínicamente significativas para ninguno de los intervalos del ECG, incluyendo QTc entre los pacientes que fueron tratados con fexofenadina clorhidrato 180 mg una vez por día (n = 163) y los que fueron tratados con placebo (n = 91) durante 4 semanas.

ESTUDIOS CLÍNICOS

Rinitis Alérgica Estacional

Adultos. En tres ensayos multicéntricos, randomizados, doble ciego, controlados con placebo, de 2 semanas, en pacientes de 12 a 68 años con rinitis alérgica estacional (n = 1634, fexofenadina clorhidrato 60 mg dos veces por día redujo significativamente los puntajes totales de los síntomas (la suma de los puntajes individuales de estornudos, rinorrea, picazón en nariz/paladar/garganta, picazón/lagrimeo/enrojecimiento ocular) comparado con placebo. Se observaron reducciones estadísticamente significativas en los puntajes de los síntomas después de la primera dosis de 60 mg. El efecto se mantuvo durante todo el intervalo de 12

mg (2,5 ml) una vez por día para los pacientes de 6 meses de 2 años de edad. (ver Acción Farmacológica). Agitar bien el envase antes de utilizarlo.

Contraindicaciones: hipersensibilidad a cualquiera de los componentes del producto.

Precauciones

Información para los pacientes

La suspensión de ALERCAS se indica por el médico para el alivio de los síntomas de la rinitis alérgica estacional o para el alivio de los síntomas de la urticaria idiopática crónica (urticaria). ALERCAS debe tomarse sólo según la prescripción. **No excederse de la dosis recomendada.** En caso de que se produzca algún efecto desfavorable mientras se está administrando ALERCAS, discontinuar el uso y consultar a un médico.

Los productos no deben ser utilizados por pacientes que sean hipersensibles a alguno de los ingredientes.

Estos productos deben ser utilizados en el embarazo o durante el período de lactancia sólo si el beneficio potencial justifica el riesgo potencial para el feto o para el lactante. Consultar siempre con el médico.

El envase de la suspensión oral de ALERCAS debe ser bien agitado cada vez antes de ser utilizado.

ALERCAS Suspensión Oral, como todo medicamento, debe conservarse en un recipiente herméticamente cerrado en un lugar frío y seco, lejos del alcance de los niños.

Interacción de la droga con eritromicina y ketoconazol

La co-administración de fexofenadina clorhidrato ya sea con ketoconazol o eritromicina, condujo a un aumento en las concentraciones plasmáticas de fexofenadina. Fexofenadina no tuvo ningún efecto sobre la farmacocinética de eritromicina ni de ketoconazol. En 2 estudios separados, fexofenadina clorhidrato 120 mg dos veces por día (dosis diaria total de 240 mg) fue co-administración con eritromicina 500 mg cada 8 horas o con ketoconazol 400 mg una vez por día en condiciones de estado estacionario a sujetos sanos (n = 24, cada estudio). No se observaron diferencias en los eventos adversos o el intervalo QTc cuando se administró a los pacientes fexofenadina clorhidrato solo o combinado ya sea con eritromicina o ketoconazol. Los resultados de estos estudios se sintetizan en la tabla siguiente:

Droga concomitante	C _{max} SS	AUC _{0-12 h}
	(Concentración plasmática pico)	(Extensión de la exposición sistémica)
Eritromicina (500 mg cada 8 horas)	+ 82 %	+ 109 %
Ketoconazol (400 mg una vez por día)	+ 135 %	+ 164 %

Los cambios producidos en los niveles plasmáticos estuvieron dentro del rango de los niveles plasmáticos logrados en ensayos clínicos adecuados y bien controlados.

El mecanismo de estas interacciones ha sido evaluado en modelos animales in Vitro, in situ e in vivo. Este aumento observado en la biodisponibilidad de fexofenadina puede deberse a los efectos relacionados con el transporte, tales como la glicoproteína-p. Los estudios in vivo en animales también sugieren que además de mejorar la absorción, ketoconazol reduce la excreción gastrointestinal de fexofenadina, mientras que eritromicina también puede reducir la excreción biliar.

Interacción de la droga con los antiácidos

La administración de 120 mg de fexofenadina clorhidrato (2 cápsulas x 60 mg) dentro de los 15 minutos de administración de un antiácido que contenga aluminio y magnesio redujo el AUC de fexofenadina en 41% y la C_{max} en un 43%. ALERCAS no debe tomarse con poco tiempo de diferencia con respecto a la toma de antiácidos que contengan aluminio y magnesio.

Interacciones con jugos de fruta

Los jugos de fruta como el de pomelo, naranja y manzana pueden reducir la biodisponibilidad y la exposición de fexofenadina. Esto se basa en los resultados de 3 ensayos clínicos que utilizan histamina que indujo ronchas y erupciones acoplado con el análisis de la población farmacocinética. El tamaño de las ronchas y de las erupciones fue significativamente mayor cuando fexofenadina clorhidrato se administró ya sea con jugo de pomelo o de naranja comparado con agua. Sobre la base de los informes de la literatura, los mismos efectos pueden

Efectos sobre la farmacocinética de fexofenadina en estado estacionario después de 7 días de co-administración con fexofenadina clorhidrato 120 mg cada 12 horas (dos veces la dosis de dos veces por día recomendada). En pacientes sanos (n = 24)

Tabla 1
Reacciones adversas en pacientes mayores de 12 años informadas en ensayos clínicos de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en los Estados Unidos

Dos dosis diarias con 60 mg de fexofenadina; incidencias superiores al 1%	Fexofenadina 60 mg dos veces por día (n = 679)	Placebo dos veces por día (n = 671)
Infección viral (resfrió, gripe)	2,5%	1,5%
Náuseas	1,6%	1,5%
Dismenorrea	1,5%	0,3%
Somnolencia	1,3%	0,9%
Dispepsia	1,3%	0,6%
Fatiga	1,3%	0,9%

Tabla 2
Reacciones adversas en pacientes mayores de 12 años informadas en ensayos clínicos de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en los Estados Unidos

Dos dosis diarias con fexofenadina clorhidrato en estudios en los Estados Unidos y en Canadá; incidencias superiores al 2%	Fexofenadina 60 mg dos veces por día (n = 191)	Placebo (n = 183)
Dispepsia	4,7%	4,4%
Mialgia	2,6%	2,2%
Dolor de espalda	2,1%	1,1%
Vértigo	2,1%	1,1%
Dolor en extremidades	2,1%	0,0%

Tabla 3
Reacciones adversas informadas en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en pacientes de 6 a 11 años en los Estados Unidos y Canadá a incidencias superiores al 2%

Reacción adversa	Fexofenadina 30 mg dos veces por día (n = 209)	Placebo (n = 229)
Cefalea	7,2%	6,6%
Lesión accidental	2,9%	1,3%
Tos	2,8%	1,3%
Fiebre	2,4%	0,9%

Tabla 4
Reacciones adversas informadas en estudios con control de placebo en pacientes pediátricos con rinitis alérgica estacional controlados con placebo en niños de 6 a 11 años de edad que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Reacción adversa	Fexofenadina 15 mg dos veces por día (n = 108)	Fexofenadina 30 mg dos veces por día (n = 426)	Total (n = 534)	Placebo (n = 430)
Vómitos	12,0%	4,2%	5,8%	8,6%
Pirexia	1,9%	4,5%	3,9%	7,0%
Tos	1,9%	4,0%	3,6%	3,3%
Otitis media	2,8%	3,8%	3,6%	3,3%
Diarrea	3,7%	2,8%	3,0%	2,6%
Rinorrea	0,9%	2,1%	1,9%	0,9%
Infección del tracto urinario	0,9%	2,1%	1,9%	4,0%

Tabla 5
Reacciones adversas informadas por pacientes mayores de 12 años en estudios de urticaria idiopática crónica controlados con placebo fueron similares a los informados en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo. La Tabla 4 también incluye las incidencias adversas que fueron informadas por más del 2% de los pacientes tratados con comprimidos de fexofenadina clorhidrato que placebo.

Tabla 6
Reacciones adversas informadas en pacientes mayores de 12 años en estudios de urticaria idiopática crónica con control de placebo

Reacción adversa	Fexofenadina 150 mg una vez por día (n = 283)	Placebo (n = 293)
Cefalea	10,6%	7,5%

Tabla 7
Reacciones adversas informadas en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en pacientes de 6 a 11 años de edad que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Reacción adversa	Fexofenadina 30 mg dos veces por día (n = 209)	Placebo (n = 229)
Cefalea	7,2%	6,6%
Lesión accidental	2,9%	1,3%
Tos	2,8%	1,3%
Fiebre	2,4%	0,9%

Tabla 8
Reacciones adversas informadas en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en pacientes de 6 a 11 años de edad que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Reacción adversa	Fexofenadina 150 mg dos veces por día (n = 167)	Placebo (n = 92)
Cefalea	4,8%	3,3%

Tabla 9
Reacciones adversas informadas en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en pacientes de 6 a 11 años de edad que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Reacción adversa	Fexofenadina 30 mg dos veces por día (n = 209)	Placebo (n = 229)
Cefalea	7,2%	6,6%
Lesión accidental	2,9%	1,3%
Tos	2,8%	1,3%
Fiebre	2,4%	0,9%

Tabla 10
Reacciones adversas informadas en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en pacientes de 6 a 11 años de edad que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Reacción adversa	Fexofenadina 150 mg dos veces por día (n = 167)	Placebo (n = 92)
Cefalea	4,8%	3,3%

Tabla 11
Reacciones adversas informadas en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en pacientes de 6 a 11 años de edad que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Reacción adversa	Fexofenadina 30 mg dos veces por día (n = 209)	Placebo (n = 229)
Cefalea	7,2%	6,6%
Lesión accidental	2,9%	1,3%
Tos	2,8%	1,3%
Fiebre	2,4%	0,9%

Tabla 12
Reacciones adversas informadas en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en pacientes de 6 a 11 años de edad que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Reacción adversa	Fexofenadina 150 mg dos veces por día (n = 167)	Placebo (n = 92)
Cefalea	4,8%	3,3%

Tabla 13
Reacciones adversas informadas en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en pacientes de 6 a 11 años de edad que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Reacción adversa	Fexofenadina 30 mg dos veces por día (n = 209)	Placebo (n = 229)
Cefalea	7,2%	6,6%
Lesión accidental	2,9%	1,3%
Tos	2,8%	1,3%
Fiebre	2,4%	0,9%

Tabla 14
Reacciones adversas informadas en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en pacientes de 6 a 11 años de edad que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Reacción adversa	Fexofenadina 150 mg dos veces por día (n = 167)	Placebo (n = 92)
Cefalea	4,8%	3,3%

Tabla 15
Reacciones adversas informadas en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en pacientes de 6 a 11 años de edad que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Reacción adversa	Fexofenadina 30 mg dos veces por día (n = 209)	Placebo (n = 229)
Cefalea	7,2%	6,6%
Lesión accidental	2,9%	1,3%
Tos	2,8%	1,3%
Fiebre	2,4%	0,9%

Tabla 16
Reacciones adversas informadas en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en pacientes de 6 a 11 años de edad que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Reacción adversa	Fexofenadina 150 mg dos veces por día (n = 167)	Placebo (n = 92)
Cefalea	4,8%	3,3%

Tabla 17
Reacciones adversas informadas en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en pacientes de 6 a 11 años de edad que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Reacción adversa	Fexofenadina 30 mg dos veces por día (n = 209)	Placebo (n = 229)
Cefalea	7,2%	6,6%
Lesión accidental	2,9%	1,3%
Tos	2,8%	1,3%
Fiebre	2,4%	0,9%

Tabla 18
Reacciones adversas informadas en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en pacientes de 6 a 11 años de edad que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Reacción adversa	Fexofenadina 150 mg dos veces por día (n = 167)	Placebo (n = 92)
Cefalea	4,8%	3,3%

Tabla 19
Reacciones adversas informadas en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en pacientes de 6 a 11 años de edad que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Reacción adversa	Fexofenadina 30 mg dos veces por día (n = 209)	Placebo (n = 229)
Cefalea	7,2%	6,6%
Lesión accidental	2,9%	1,3%
Tos	2,8%	1,3%
Fiebre	2,4%	0,9%

Tabla 20
Reacciones adversas informadas en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en pacientes de 6 a 11 años de edad que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Reacción adversa	Fexofenadina 150 mg dos veces por día (n = 167)	Placebo (n = 92)
Cefalea	4,8%	3,3%

Tabla 21
Reacciones adversas informadas en estudios de rinitis alérgica estacional controlados con placebo en pacientes de 6 a 11 años de edad que fueron más comunes con fexofenadina clorhidrato que placebo.

Reacción adversa	Fexofenadina 30 mg dos veces por día (n = 209)	Placebo (n = 229)
Cefalea	7,2%	6,6%
Lesión accidental	2,9%	1,