

Convenil[®]

Levocetirizina

COMPOSICION

Cada comprimido entérico contiene:

Levocetirizina diclorhidrato 5 mg
Excipientes, c.s.

PROPIEDADES

Es el (R) enantiómero de la cetirizina, es un antagonista potente y selectivo de los receptores periféricos H1.

Estudios de unión a receptores han demostrado que tiene una alta afinidad por los receptores humanos H1 (Ki = 3.2 nmol/l) y ésta es dos veces mayor que la presentada por cetirizina (Ki = 6.3 nmol/l). Se disocia de los receptores H1 con una vida media de 115 ± 38 min.

Estudios farmacodinámicos en voluntarios sanos demostraron que con la mitad de la dosis tiene una actividad comparable a la cetirizina al probarse en piel y nariz.

FARMACOCINETICA

Se absorbe rápida y extensamente después de su administración oral. Las concentraciones plasmáticas pico se obtienen 55 minutos después de dosificado. El estado estacionario se alcanza después de dos días. Las concentraciones pico típicas son de 270 y 308 ng/mL siguiendo un perfil de administración oral de 5 mg sencillo y repetido, respectivamente. La tasa de absorción es independiente de la dosis y no se altera con la ingestión de alimentos, aunque los picos de concentración se reducen y retrasan su aparición.

No hay datos de distribución en tejidos humanos. Se une en 90% a las proteínas plasmáticas. La distribución es restrictiva, ya que su volumen de distribución es de 0.4 l/kg.

La tasa metabólica en humanos es menor al 14% de la dosis administrada, aunque se observan diferencias debidas al polimorfismo genético o a la administración concomitante de inhibidores enzimáticos. Las vías metabólicas incluyen la oxidación aromática, las reacciones de N- y O-desalquilación y la conjugación con taurina. Las vías de desalquilación están mediadas principalmente por CYP 3A4, mientras que la oxidación aromática involucra múltiples isoformas de CYP y algunas no identificadas.

La vida media plasmática en adultos es de 7.9 ± 1.9 horas. El promedio de depuración aparente corporal total es de 0.63 mL/min./kg. La ruta de eliminación principal de la levocetirizina y sus metabolitos es por vía urinaria, tomando como promedio de 85.4% de la dosis. Por vía fecal se elimina 12.9% de la dosis. Se excreta por filtración glomerular y por secreción tubular activa.

TOXICOLOGIA

No se tienen datos suficientes a la fecha, con relación a los efectos de carcinogénesis, mutagénesis, teratogénesis y sobre la fertilidad.

INFORMACION CLINICA

INDICACIONES

Tratamiento de síntomas asociados a enfermedades alérgicas como: Rinitis alérgica estacional (incluyendo los síntomas oculares); rinitis alérgica perenne, urticaria crónica idiopática.

CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a la sustancia activa, a cualquier otro componente de la formulación o a cualquier derivado piperazínico.

Pacientes con enfermedad renal terminal, con aclaramiento de creatinina inferior a 10 mL/min.

EFFECTOS INDESEABLES

Los efectos adversos, entre leves y moderados (por encima del 1%), más frecuentemente descritos con este producto son: Sequedad de boca, dolor de cabeza, fatiga y somnolencia.

Se observaron otras reacciones adversas poco corrientes (no frecuentes >1/1000, <1/1000), como astenia o dolor abdominal.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS

No se recomienda utilizar en niños menores de 6 años, ya que los comprimidos disponibles no permiten un ajuste de la dosis.

Se recomienda precaución con la ingestión de alcohol (ver INTERACCIONES).

Los pacientes con problemas hereditarios raros como la intolerancia a la galactosa, deficiencia de lactasa Lapp o malabsorción de glucosa-galactosa, no deberían tomar este medicamento.

Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

Estudios clínicos comparativos no han mostrado evidencias que esta sustancia, produzca alteraciones de la atención, la capacidad de reacción y la habilidad para conducir 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. En pacientes sensibles, el uso concomitante con alcohol u otros depresores del SNC puede producir una reducción adicional del estado de alerta y del rendimiento.

USO EN EMBARAZO Y LACTANCIA

No se dispone de datos clínicos sobre esta sustancia en mujeres embarazadas. Estudios realizados en animales no indican efectos nocivos directos o indirectos sobre el embarazo, desarrollo embrionario / fetal, parto o desarrollo post-natal. Se deberán tomar precauciones al prescribirse a mujeres embarazadas.

Se espera que se excrete en la leche materna, por lo que no se recomienda su uso durante la lactancia, a menos que el beneficio sobre la madre sea mayor que cualquier riesgo teórico sobre el hijo.

INTERACCIONES

No se han realizado estudios de interacción con esta sustancia (incluyendo estudios con inductores del CYP3A4); estudios realizados con el compuesto racémico cetirizina han demostrado que no había interacciones clínicamente relevantes (con pseudoefedrina, cimetidina, ketoconazol, eritromicina, azitromicina, glibipizida y diazepam. En un estudio de dosis múltiple con teofilina (400 mg/día) se observó una ligera disminución (16%) en el aclaramiento 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 sí disminuye.

En pacientes sensibles a la administración simultánea con alcohol u otros depresores del SNC puede producir efectos sobre el sistema nervioso central, aunque se ha demostrado que el racémico

COMPRIMIDOS ENTERICOS

ANTIALERGICO

cetirizina no potencia el efecto del alcohol.

SOBREDOSIS

Los síntomas de sobredosis pueden incluir somnolencia en adultos y niños, inicialmente agitación e inquietud, seguido por somnolencia.

No existe un antídoto específico conocido.

De producirse sobredosis, se recomienda seguir un tratamiento sintomático o de apoyo. El lavado gástrico se podrá realizar tras una ingesta a corto plazo. No se elimina de forma efectiva por hemodiálisis.

USO Y DOSIS

Adultos y adolescentes a partir de 12 años: La dosis diaria recomendada es de 5 mg (1 comprimido).

Niños de 6 a 12 años de edad: La dosis diaria recomendada es de 5 mg (1 comprimido).

Para niños menores de 6 años todavía no es posible ajustar la dosis en función del peso.

Ancianos: Se recomienda ajustar la dosis en ancianos con insuficiencia renal de leve a moderada (ver Uso en pacientes con insuficiencia renal).

Uso en pacientes con insuficiencia renal:

Los intervalos de dosificación se deberán individualizar de acuerdo con la función renal. Consulte la siguiente tabla y ajuste la dosis según proceda. Para utilizar esta tabla de dosificación, es preciso disponer de una estimación del aclaramiento de creatinina (CLCr) del paciente, en mL/min. El valor de CLCr (en mL/min.) se puede estimar a partir de la determinación de creatinina en suero (mg/dl) mediante la siguiente fórmula:

$$CLCr = \frac{[140 - \text{edad (años)}] \times \text{peso (kg)}}{72 \times \text{creatinina en suero (mg/dl)}} \quad (\times 0,85 \text{ para mujeres})$$

Ajuste de la dosis en pacientes con insuficiencia renal:

Grupo	Aclaración de creatinina (mL/min.)	Dosis y frecuencia
Normal	≥90	1 comprimido una vez al día
Leve	60 - 79	1 comprimido una vez al día
Moderada	30 - 49	1 comprimido una vez cada 2 días
Severa	<30	1 comprimido una vez cada 3 días
Enfermedad renal Terminal-Pacientes que precisan diálisis	<10	Contraindicado

Uso en pacientes con insuficiencia hepática

No es preciso ajustar la dosis en pacientes que sólo tengan insuficiencia hepática. Si se recomienda ajustar la dosis en pacientes con insuficiencia renal y hepática (ver Uso en pacientes con insuficiencia renal).

Duración del tratamiento:

La duración del tratamiento depende del tipo, duración y curso de los síntomas. Para la fiebre del heno de 3 a 6 semanas, y en caso de exposiciones al polen durante cortos periodos de tiempo, una semana puede ser suficiente. Actualmente se dispone de experiencia clínica con comprimidos de 5 mg durante un periodo de tratamiento de 4 semanas. Para urticaria crónica y rinitis alérgica crónica existe experiencia clínica de hasta un año con el compuesto racémico, y hasta 18 meses en pacientes con prurito asociado con dermatitis atópica.

VIA DE ADMINISTRACION

Oral.

Antes de consumir este o cualquier otro medicamento, debe siempre consultar a su médico.

En caso de un marcado efecto secundario, sea este por sobredosis o reacción particular, acuda inmediatamente a su médico.

INFORMACION FARMACEUTICA

DURACION DE ESTABILIDAD

Verificar fecha de vencimiento señalada en la caja.

PRECAUCIONES ESPECIALES PARA SU CONSERVACION

Conservar a una temperatura menor o igual a los 30°C, proteger de la luz.

PRESENTACION

Caja conteniendo 1 tirilla de 10 comprimidos entéricos.

NOTA IMPORTANTE

Este producto se encuentra envasado y protegido en una adecuada y rigurosa laminación, especialmente diseñada para evitar su exposición con la luz y humedad, descartando además que por descuidos involuntarios los niños puedan acceder al mismo.

Registro Industrial No. 14109

Registro Sanitario No. 2017-0376

Venta por receta médica.

Mantener fuera del alcance de los niños.

Fabricado por Ethical Pharmaceutical, S.R.L.
de República Dominicana.