

DES Loratadina

Desloratadina es un antihistamínico de última generación capaz de aliviar la congestión nasal derivada de la rinitis alérgica de forma sistemática y sostenida. Su eficacia y su perfil de seguridad garantizan la ausencia de sedación y de trastornos cognitivos o psicomotores así como la ausencia de alteraciones a nivel cardíaco.

MARIÁN CARRETERO COLOMER. Vocal del COF de Barcelona.

Recientemente ha aparecido en el mercado una nueva solución oral de desloratadina de una sola toma diaria que no contiene azúcar y ha ampliado la indicación de urticaria crónica idiopática a todo tipo de urticaria, pudiendo ser administrado a niños a partir de un año.

La rinitis alérgica es una enfermedad muy común en todo el mundo. Su prevalencia se sitúa entre el 10 y el 30% de la población y va en aumento. Se trata de un trastorno sintomático nasal que se debe a la exposición a alérgenos y a la inflamación mediada por IgE de las membranas nasales. No es una enfermedad grave pero es muy molesta y altera la calidad de vida de la persona que la presenta.

La rinitis alérgica ha sido reclasificada por la Organización Mundial de la Salud según la duración de sus síntomas en:

- Intermitente: de duración inferior a cuatro días a la semana y a 4 semanas en total, sin síntomas molestos y sin repercusión en la calidad de vida.
- Persistente: de duración igual o superior a cuatro días a la semana y duración total superior a cuatro semanas, con síntomas que repercuten en la calidad de vida.

La hiperactividad nasal no específica es la característica más importante de la rinitis alérgica, que provoca estornudos, secreción y congestión nasal.

La rinitis alérgica convive con frecuencia con el asma.

DESCRIPCIÓN

Desloratadina es un nuevo agonista inverso de los receptores H₁, no sedante y de acción prolongada y es el metabolito activo principal de loratadina.

Desloratadina sufre un metabolismo de primer paso menos extenso que loratadina y su vida media de eliminación es de 27 horas, en comparación con las 12-15 horas de loratadina. Está indicada en el alivio de los síntomas nasales y no nasales de las rinitis alérgicas y en los síntomas asociados a la urticaria.

FARMACODINAMIA

Desloratadina es un antagonista de acción prolongada, no sedante, con una actividad antagonista selectiva en el receptor H₁ periférico. Tras su administración oral, desloratadina bloquea selectivamente los receptores H₁ periféricos de la histamina porque la sustancia no penetra en el sistema nervioso central. De ahí que en diversos ensayos clínicos se haya comprobado que el fármaco no causa somnolencia ni afecta a la actividad psicomotriz.

Sus propiedades antialérgicas incluyen la inhibición de la liberación de citoquinas proinflamatorias, de las células cebadas/basófilos humanos, así como la inhibición de la expresión de la molécula de adhesión P-selectina en las células endoteliales.

La solución oral de desloratadina no se ha investigado en ensayos independientes en pediatría pero sí se ha demostrado la seguridad de su concentración en tres ensayos pediátricos.

En pacientes adultos y adolescentes con rinitis alérgicas, desloratadina es eficaz en el alivio de los estornudos, rino-rrea, picor nasal, escozor, lagrimeo, enrojecimiento ocular y picor del paladar.

Desloratadina alivia la carga de rinitis alérgica estacional y favorece la práctica cotidiana que estaría limitada por los síntomas.

FARMACOCINÉTICA

Las concentraciones plasmáticas de desloratadina se pueden detectar en plasma a los 30 minutos de la administración. La absorción es buena y la concentración máxima se alcanza a las tres horas aproximadamente.

La vida media de eliminación es de unas 27 horas. La biodisponibilidad del fármaco es proporcional a la dosis en el intervalo de 5-20 mg.

En los ensayos clínicos se detectó que el 6% de los pacientes alcanzó una concentración superior a la media de desloratadina. La prevalencia de este fenotipo metabolizador pobre fue similar en adultos y en niños.

Desloratadina se une moderadamente a proteínas plasmáticas (83-87%). Tras la dosificación diaria de 5-20 mg en adultos y adolescentes, no se observó evidencia clínica relevante de acumulación de principio activo.

En un ensayo se comprobó la bioequivalencia entre comprimidos y jarabe.

En estudios de dosis únicas independientes, a las dosis recomendadas, los pacientes pediátricos presentaron valores de AUC y Cmax de desloratadina similares a los obtenidos en adultos que recibieron una dosis de desloratadina jarabe.

Los alimentos no alteran la biodisponibilidad de desloratadina. Tampoco afecta la ingesta de zumo de pomelo.

Los estudios llevados a cabo muestran que no hay diferencias cuantitativas en el perfil de toxicidad de desloratadina y loratadina a niveles comparables de exposición a loratadina.

SEGURIDAD Y TOLERABILIDAD

Desloratadina presentó un perfil de efectos adversos similar al del placebo en estudios clínicos sobre el tratamiento de la rinitis alérgica y la urticaria idiopática crónica.

La mayoría de los efectos adversos fue de intensidad leve o moderada y su frecuencia fue similar en los pacientes tratados con desloratadina y en los que recibieron placebo. La incidencia global de reacciones adversas en niños de 2 a 11 años fue similar en los grupos de desloratadina y placebo.

En bebés y niños de edades comprendidas entre 6 y 23 meses, las reacciones adversas más frecuentes fueron diarrea, fiebre e insomnio. En adultos, las más frecuentes fueron cansancio, sequedad de boca y cefalea. Muy raramente se notificaron los siguientes efectos adversos: alucinaciones, mareo, somnolencia, taquicardia, trastornos gastrointestinales, mialgia y reacciones de hipersensibilidad.

Los antihistamínicos de primera generación alteran la función del sistema nervioso central y pueden producir sedación y deterioro importante de la función cognitiva. Se ha demostrado que estos fármacos afectan significativamente a la capacidad de conducir vehículos. Los antihistamínicos de segunda generación no causan estos efectos aunque alguno de ellos, en dosis superiores a las recomendadas, sí puede causar diferen-



tes grados de somnolencia o alteración cognitiva. No es el caso de desloratadina, que no causa efectos en el sistema nervioso central ni siquiera a dosis superiores a las recomendadas.

CONCLUSIÓN

Desloratadina es un fármaco ampliamente estudiado que ha demostrado su eficacia en el control de síntomas asociados a las enfermedades alérgicas. Se ha demostrado su capacidad de aliviar la congestión nasal mejorando la permeabilidad y el flujo respiratorio nasal.

Presenta un excelente perfil de seguridad con ausencia de sedación y de trastornos cognitivos o psicomotores. No interacciona con los alimentos y no provoca alteraciones cardíacas.

Desloratadina ofrece una mejora de la calidad de vida del paciente alérgico permitiendo que mantenga su actividad cotidiana sin las molestias derivadas de esta condición. **Of**