



RUPATADINA

Antihistamínico de última generación

Puesta al día

Dr José M^a Negro Alvarez
Servicio de Alergología
H.U. Virgen de la Arrixaca
Prof. Asociado de Alergología
Universidad de Murcia
Murcia (España)

**Revisión de sus propiedades
farmacológicas y utilidad en
el tratamiento de la rinitis**

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

RUPATADINA

I - Características Farmacológicas

- Mecanismo de Acción
- Farmacocinética
- Seguridad (estudios preclínicos)

II - Perfil Clínico

- Eficacia Terapéutica en Rinitis Alérgica

III - Perfil de Seguridad

- Cardíaca
- SNC

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

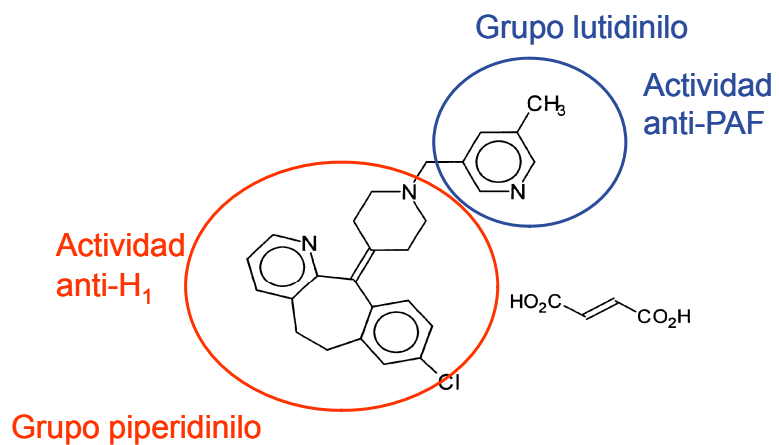
I - CARACTERISTICAS FARMACOLOGICAS

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Estructura Química

Rupatadina (fumarato)



Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Mecanismo de Acción

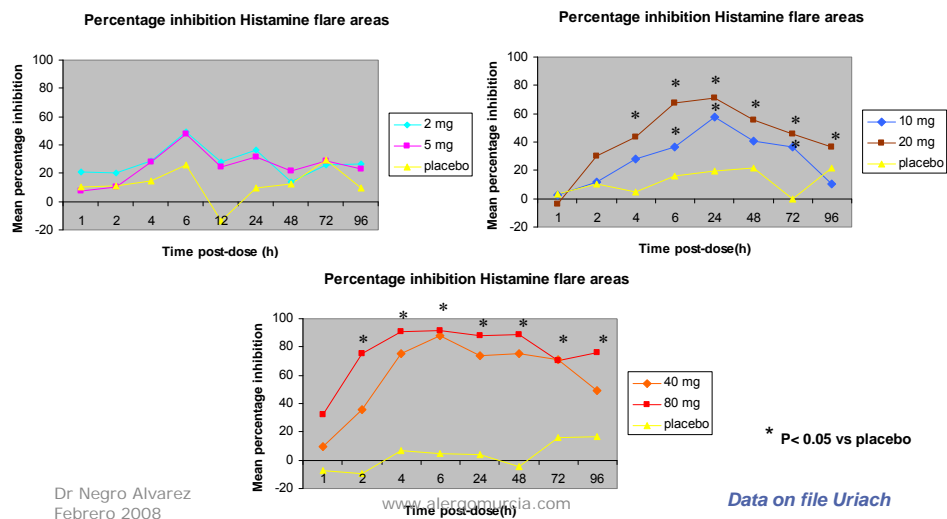
- Bloqueo selectivo de receptores H₁ periféricos de la histamina
- Antagonista de los receptores del factor de activación plaquetaria (PAF)
- Propiedades antiinflamatorias

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Actividad antihistamínica en humanos

Inhibición del área de la pápula en voluntarios sanos

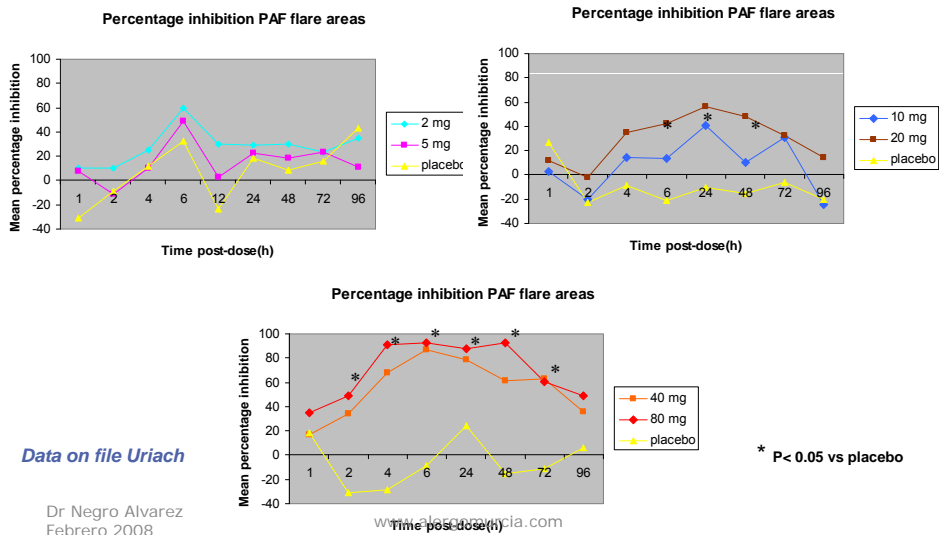


Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Actividad inhibidora del PAF en humanos

Inhibición del área de la pápula en voluntarios sanos



Propiedades antiinflamatorias adicionales

- Inhibición de la liberación de histamina y TNF- α (factor de necrosis tumoral α) por los mastocitos tras estímulo inmunológico y no inmunológico
Inflamm Res 2000; 49: 355-360
- Inhibición de la quimiotaxis en neutrófilos humanos
Allergy 2000; 55 (Suppl 63): 94-95 (Abst 304)
- Inhibición de la quimiotaxis en eosinófilos humanos
XXIII EAACI Congress. Amsterdam 2004. Abstract Book: 113 (Abst 366)

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

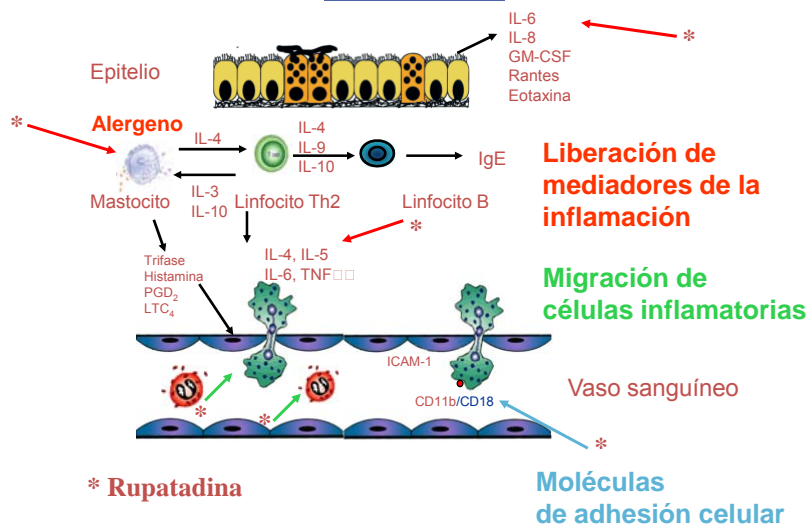
Propiedades antiinflamatorias adicionales

- Inhibición de la producción de citocinas Th2
Allergy Clin Immunol Int: J World Allergy Org 2005; Suppl (1): 427 (Abs 1175)
- Inhibición de la expresión de las moléculas de adhesión
XXIII EAACI Congress. Amsterdam 2004. Abstract Book: 113 (Abst 366)
- Inhibición de la producción de IL-6 e IL-8 por las células endoteliales
Methods Find Exp Clin Pharmacol 2005; 27 (Suppl 2): 161 (P-104)
- Inhibición de los factores de transcripción
Rev Rinol 2006, 6(1): 18

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Efectos en la inflamación alérgica Resumen



Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

FARMACOCINETICA

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Propiedades farmacocinéticas

- Rápida absorción oral ($t_{\text{máx}} = 45-60$ min.): inicio rápido de la acción
- Sin interacciones clínicas relevantes con los alimentos
- Metabolismo hepático principalmente a través del citocromo P450 (CYP3A4)
- Unión a proteínas plasmáticas: 99%
- Presencia de metabolitos que contribuyen al efecto global
- Eliminación por vía hepática (61%) y renal (35%)
- Larga duración de la acción: administración diaria única

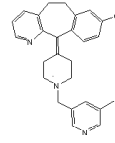
Drugs of Today 2003; 39: 451-468

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

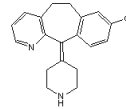
www.alergomurcia.com

Metabolismo Rupatadina

Rupatadina (muy activa)



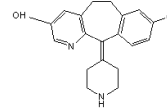
Desloratadina (activa)



Metabolitos hidroxilados Desloratadina (menos activa)



Glucuronidas (inactiva)



**VARIOS METABOLITOS DE RUPATADINA SON ACTIVOS:
CONTRIBUYENDO A LA ACTIVIDAD CONJUNTA Y A LA
LARGA DURACION DE SU ACCION**

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

SEGURIDAD

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Estudios preclínicos de seguridad cardíaca

- Sin efecto en la duración del potencial de acción (APD₉₀) en fibras de Purkinje caninas aisladas, a concentraciones > 2000 veces a la dosis terapéutica
- Ausencia de bloqueo de canales iónicos (HERG) a concentraciones terapéuticas
- Ausencia o mínimos efectos en parámetros hemodinámicos en varias especies en dosis elevadas
- Sin efectos en parámetros electrocardiográficos (especialmente QTc) en ratas, hámsters y perros a dosis > 100 veces a la recomendada en humanos
- Sin prolongación del QTc en administración conjunta con ketoconazol en hámsters

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

II - PERFIL CLINICO **EN RINITIS ALÉRGICA**

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Rinitis Alérgica

- Ensayos Clínicos en Phase II con Rupatadina
- Ensayos Clínicos en Phase III con Rupatadina
- Ensayos Clínicos en Phase IV con Rupatadina

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Ensayos clínicos en rinitis alérgica: características principales

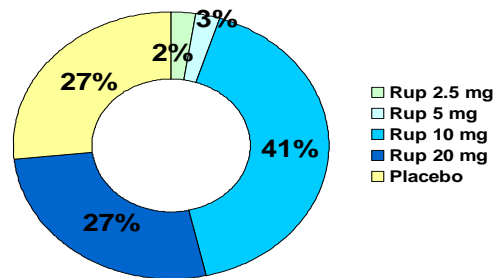
- **Dosis evaluadas:**
 - 2'5, 5, 10 ó 20 mg de rupatadina, una vez al día
- **Duración del tratamiento:**
 - 14 días (Rinitis alérgica estacional)
 - 28 días (Rinitis alérgica perenne)
- **Diseño:**
 - internacional, multicéntrico, aleatorizado, doble ciego
 - en grupos paralelos
- **Grupo de control / tratamientos activos:**
 - placebo
 - ebastina (10 mg)
 - loratadina (10 mg)
 - cetirizina (10 mg)
 - desloratadina (5 mg)

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Ensayos clínicos en rinitis alérgica características principales

Nº pacientes incluidos: 3.960



■ Pacientes incluidos en estudios clínicos de alergia: 3578

■ Pacientes tratados con Rupatadina: 2081 *

* No incluye estudios de fase I

Datos del archivo Uriach

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Ensayos clínicos de Fase II con Rupatadina

Se incluyeron un total de 866 pacientes en 4 ensayos de fase II, comparando dosis de rupatadina de 2.5, 5, 10 y 20 mg frente a placebo en RAE y RAP

Las dosis de 10 y 20 mg diarios de Rupatadina fueron superiores a placebo tanto en RAP como RAE sin diferencias significativas entre ambas

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Ensayos clínicos de Fase II con Rupatadina

Efecto de Rupatadina vs placebo en pacientes con síntomas inducidos mediante aeroalergenos en la Cámara de Exposición de Viena. *Annals of Allergy, Asthma & Immunology 2006;96:37-44.*

- En pacientes con rinitis inducida por alérgeno en la cámara de Viena, la administración de Rupatadina 10mg se asoció con un alivio altamente significativo de los síntomas de la rinitis alérgica.
- Rupatadina 10 mg mostró un **rápido inicio de acción** (15 minutos) en la reducción de los síntomas nasales y no nasales en pacientes con Rinitis Alérgica inducida mediante alérgeno en la cámara de exposición de Viena.
- En estudios similares llevados a cabo con Loratadina y Levocetirizina el inicio de acción reportado fue de 75 y 45 minutos, respectivamente.

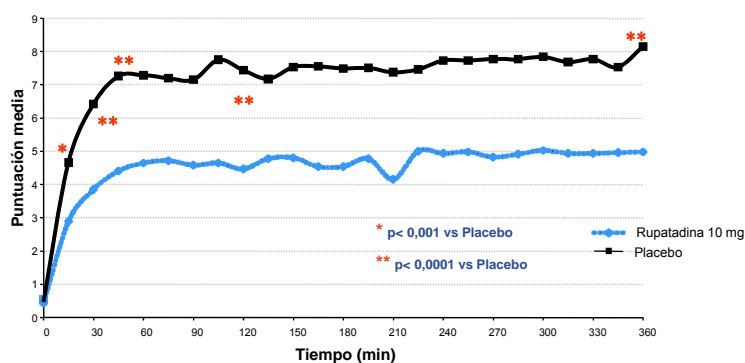
Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Ensayos clínicos de Fase II con Rupatadina

Efecto de Rupatadina vs placebo en pacientes con síntomas inducidos mediante aeroalergenos en la Cámara de Exposición de Viena. *Annals of Allergy, Asthma & Immunology 2006;96:37-44.*

Puntuación media total de síntomas nasales*



Pacientes (n=45) evaluados en unidad de exposición alérgica (Vienna Challenge Chamber)

* Incluye: congestión nasal, rinorrea, picor y estornudos

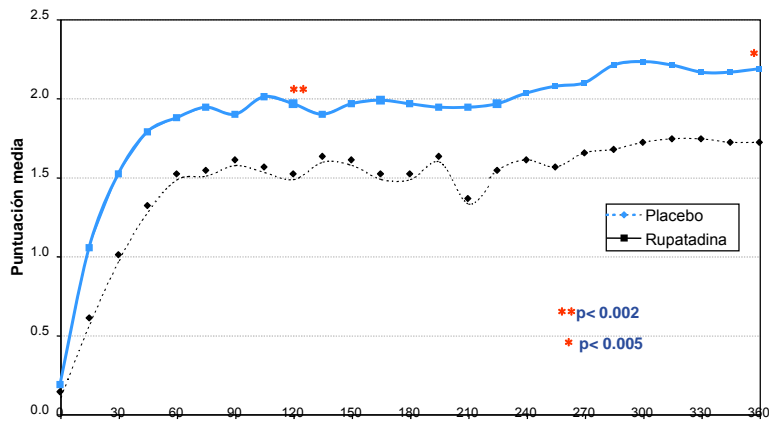
Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Ensayos clínicos de Fase II con Rupatadina

Efecto de Rupatadina vs placebo en pacientes con síntomas inducidos mediante aeroalergenos en la Cámara de Exposición de Viena. *Annals of Allergy, Asthma & Immunology 2006;96:37-44.*

Obstrucción nasal



Pacientes (n=45) evaluados en unidad de exposición alérgica (Vienna Challenge Chamber)

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Ensayos clínicos de Fase III con Rupatadina

- Se han realizado un total de 9 ensayos clínicos en más de 2.000 pacientes con Rinitis Alérgica.
- 5 ensayos en RAE y 4 ensayos en RAP
- Todos los ensayos fueron multicéntricos, randomizados, doble-ciego y controlados con placebo y/o fármacos estándar de referencia.
- Todos los ensayos incluyeron pacientes a partir de 12 años de edad, con clínica desde 2 años antes como mínimo y en todos los casos se exigió un Prick Test positivo o una prueba positiva de RAST

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Eficacia en rinitis alérgica: Comparación con ebastina

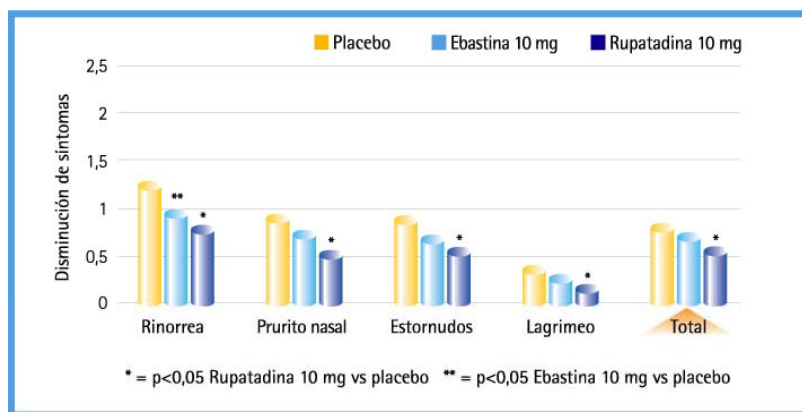
RAE: *Allergy* 2004; 59: 766-771

RAP: *Drugs* 2007; 67 (3)

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Comparación de Rupatadina 10 mg, Ebastina 10 mg y placebo en RAE



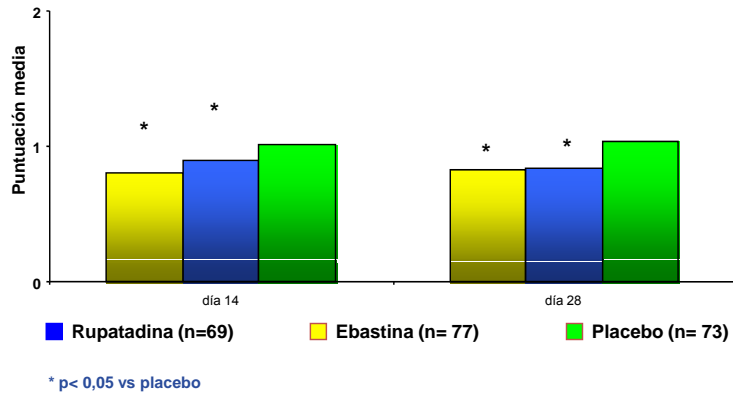
Allergy 2004; 59: 766-771

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Rupatadina vs ebastina en rinitis alérgica perenne (RAP)

Puntuación total de síntomas diarios (TDSS)

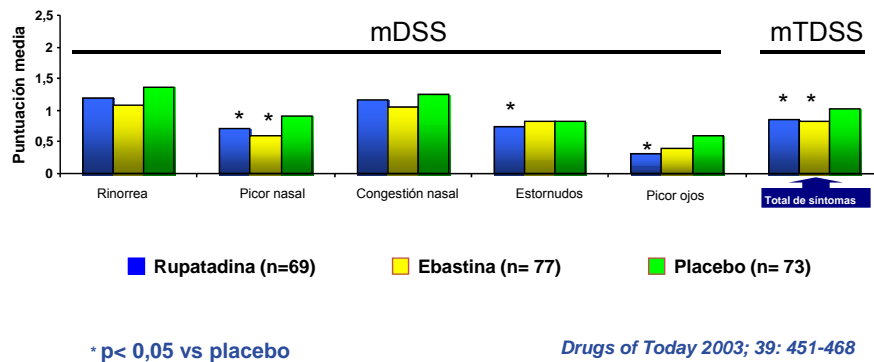


Drugs of Today 2003; 39: 451-468

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Rupatadina vs ebastina en rinitis alérgica perenne (RAP)



Drugs of Today 2003; 39: 451-468

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Eficacia en rinitis alérgica: Comparación con cetirizina

J Invest Allergol Clin Inmunol 2005; 15: 22-29

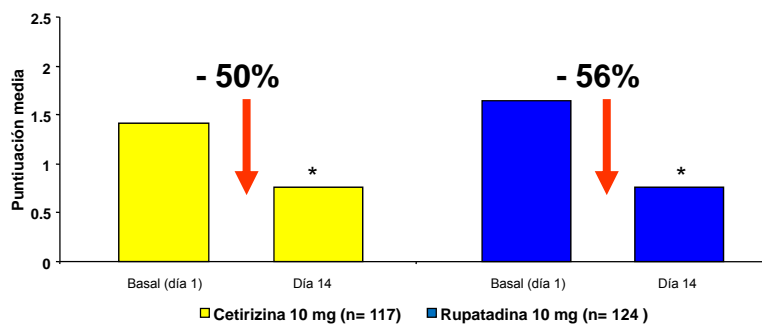
Drugs of Today 2003; 39: 451-468

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Rupatadina vs cetirizina en rinitis alérgica estacional (RAE)

Puntuación total de síntomas diarios (TDSS)



J Invest Allergol Clin Inmunol 2005; 15: 22-29

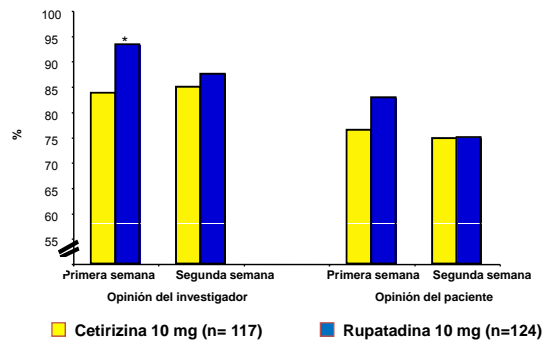
Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Rupatadina vs cetirizina en rinitis alérgica estacional (RAE)

Evaluación global por investigadores y pacientes

Pacientes con mejora o gran mejora de síntomas



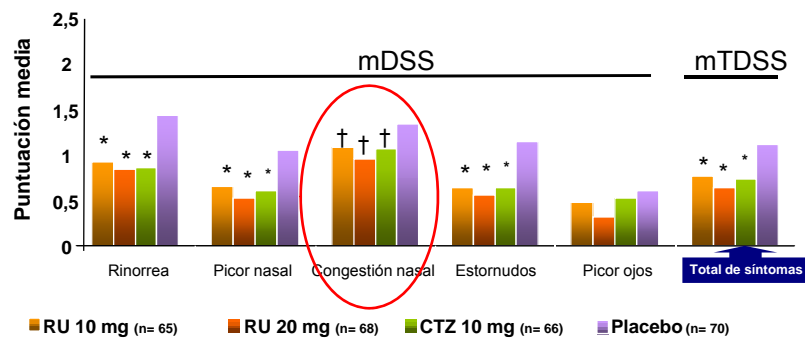
*p= 0,022 vs cetirizina

J Invest Allergol Clin Immunol 2005; 15: 22-29

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Rupatadina vs cetirizina en rinitis alérgica perenne (RAP)



* p < 0,001 vs placebo

†p= 0,04 vs placebo

Drugs of Today 2003; 39: 451-468

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Eficacia de rupatadina en comparación con cetirizina

.-Rinitis alérgica estacional

- En un estudio multicéntrico, la eficacia terapéutica de 10 mg de rupatadina vs 10 mg de cetirizina fue similar y no se hallaron diferencias entre los grupos activos en relación con ninguna variable de eficacia primaria
- Se hallaron diferencias entre rupatadina y cetirizina en la variable de la evaluación global de eficacia llevada a cabo por el investigador y en la puntuación de los síntomas de rinorrea, en ambos casos en el día 7, lo cual sugiere una mayor rapidez del efecto de rupatadina

J Invest Allergol Clin Inmunol 2005; 15: 22-29

.-Rinitis alérgica perenne

- Un estudio comparativo de dos dosis de rupatadina (10 y 20 mg), 10 mg de cetirizina y placebo, reveló que, en los tres tratamientos activos, se dio una reducción significativa de la puntuación de síntomas en comparación con placebo. Las diferencias alcanzaron niveles de mayor significación en los cuatro síntomas nasales y no nasales (incluyendo la congestión nasal)

Drugs of Today 2003; 39: 451-468

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Eficacia en rinitis alérgica: Comparación con loratadina

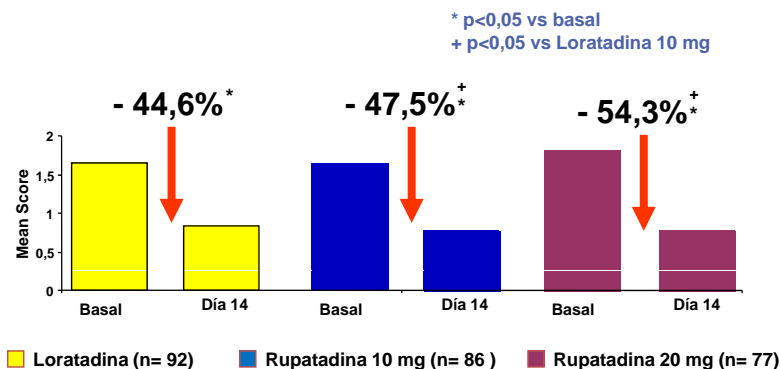
J Invest Allergol Clin Inmunol 2004; 14: 34-40

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Rupatadina vs loratadina en rinitis alérgica estacional (RAE)

Puntuación total de síntomas diarios (TDSS)



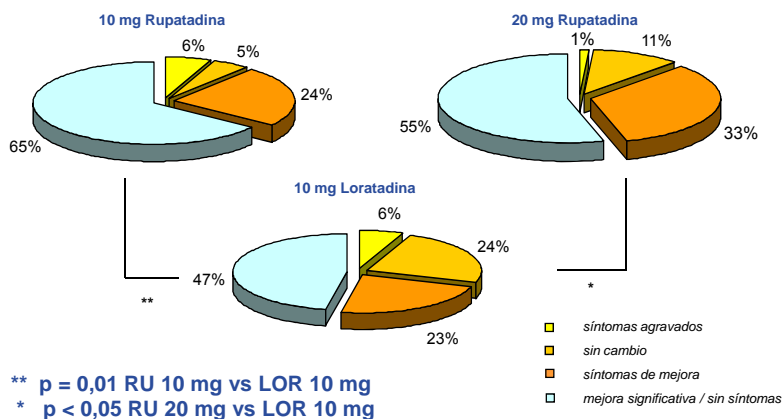
J Invest Allergol Clin Inmunol 2004; 14: 34-40

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Rupatadina vs loratadina en rinitis alérgica estacional (RAE)

Evaluación global de la eficacia según los investigadores



Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

J Invest Allergol Clin Inmunol 2004; 14: 34-40
www.alergomurcia.com

Ensayos Clínicos en Fase IV

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

12 Semanas en el tratamiento de rinitis alérgica persistente (PER)

Diseño: Doble ciego, aleatorizado, multicéntrico, internacional, controlado versus placebo

Fase Clínica: Fase IV

Países: Argentina (Buenos Aires), Chile (Santiago de Chile) y Rumania

Indicación: Pacientes mayores de 12 años con PER

Tamaño de la Muestra: 510 pacientes (170 por grupo)

Tratamiento: Placebo o Rupatadina (10 mg), Cetirizina 10 mg

End-point primario: Cambio en la puntuación total de los síntomas desde la basal durante 12 semanas

End-points: Evaluación del QoL (RQLQ)/variables farmacoeconómicas

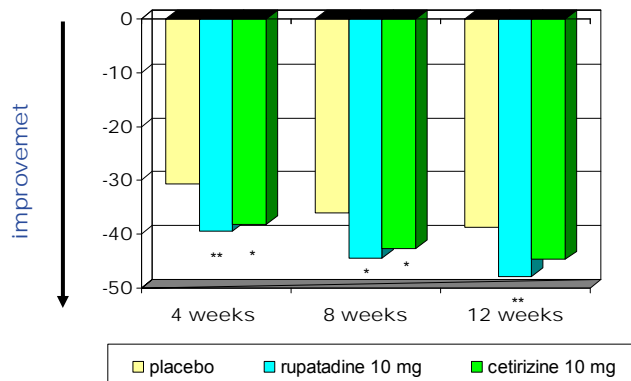
XXV EAACI Congress. Vienna 2006. Abstract Book: 216 (Abst 758)
Aceptado para su publicación en Allergy

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

12 semanas en el tratamiento de rinitis alérgica persistente (PER)

**Cambio desde la basal en puntuación total de síntomas (TSS) a
4, 8 y 12 semanas.**



*Grupo Activo vs Placebo <0.05 ; ** Grupo Activo vs Placebo <0.01

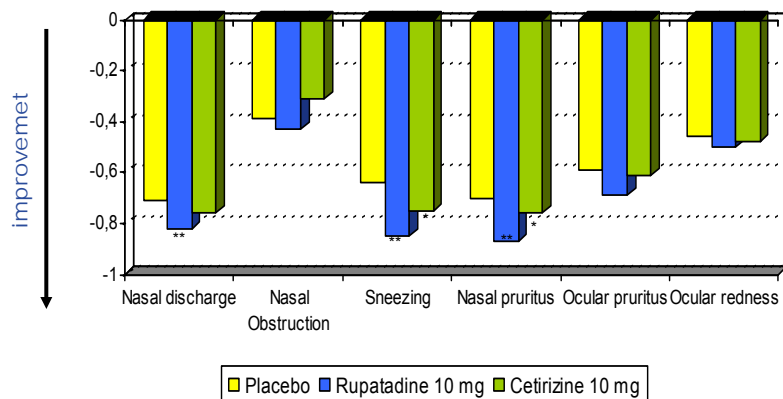
*XXV EAACI Congress. Vienna 2006. Abstract Book: 216(Abst 758)
Aceptado para su publicación en Allergy*

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

12 Semanas en el tratamiento de rinitis alérgica persistente (PER)

**Cambios desde la basal en puntuación de síntomas
diarios para cada síntoma (ITT)**



* Grupo Activo vs Placebo <0.05 ; **Grupo Activo vs Placebo <0.01

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Seguridad a largo plazo en el tratamiento de rinitis alérgica

Diseño: Fase 4 semanas a doble ciego , aleatorizado, controlado con placebo un mes; y fase abierta de extensión de 12 meses

Países: España (33 centros: alergólogos, neumólogos, ORL)

Indicación: PER pacientes mayores de 12 años

Tamaño de la Muestra: 315 pacientes

Tratamiento: Placebo o Rupatadina (10 mg) o.d. x 4 semanas Rupatadina (10 mg) o.d. X 12 meses

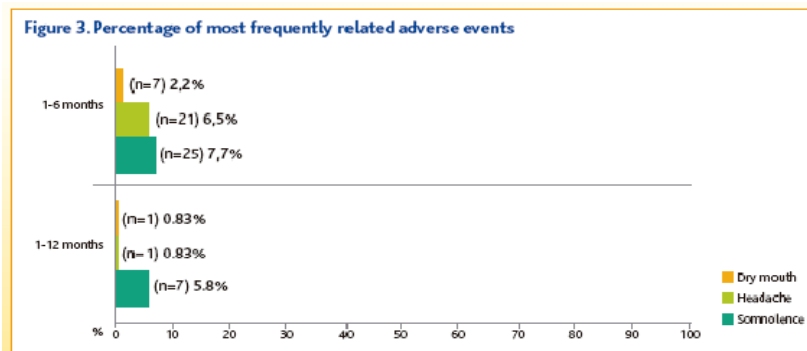
End-point Primario: Incidencia AA ; análisis ECGs (QT/QTc); QoL; y seguridad

*XXV EAACI Congress. Vienna 2006. Abstract Book: 216 (Abst 759)
Enviado a Drug Safety para su publicación*

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Seguridad a largo plazo en el tratamiento de rinitis alérgica



*XXV EAACI Congress. Vienna 2006. Abstract Book: 216 (Abst 759)
Enviado a Drug Safety para su publicación*

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Ensayos clínicos Fase IV en RA

Calidad de vida a largo plazo (1año).

- N= 92 pacientes con RA persistente.
- Rupatadina 10 mg, una vez al día durante 12 meses.
- Cuestionario de Calidad de Vida de Rinoconjuntivitis (RQLQ) de 28 preguntas, 7 veces en un año.
- La mejora en la calidad de vida se expresó como la DMI= Diferencia Mínima Importante respecto a las condiciones basales.
- Una DMI $\geq 0,5$ es considerada clínicamente relevante.

[XXV Congress of the European Academy of Allergology and Clinical Immunology \(EAACI 2006\), Vienna \(Austria\), 2006. Abstract Book: 216 \(Abs 761\).](#)

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Ensayos clínicos Fase IV en RA

Calidad de vida a largo plazo (1año):

Resultados:

- DMI = 0,8 ($p < 0,0001$)
- La mejora en la calidad de vida se observó al cabo de un mes de tratamiento.
- **El tratamiento a largo plazo (1 año) con Rupatadina a 10 mg diarios es seguro y bien tolerado en pacientes con RA Persistente y aporta una clara mejora de la calidad de vida.**

[XXV Congress of the European Academy of Allergology and Clinical Immunology \(EAACI 2006\), Vienna \(Austria\), 2006. Abstract Book: 216 \(Abs 761\).](#)

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

III - PERFIL DE SEGURIDAD

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Interacciones

Inhibidores del citocromo CYP3A4.

- Rupatadina se metaboliza a nivel hepático por acción del CYP3A4.
- Rupatadina presenta un enlentecimiento de su metabolización cuando se administra de forma concomitante con otros fármacos que emplean la vía del citocromo CYP3A4, como la **eritromicina o el ketoconazol** → **aumenta 3 y 10 veces los niveles plasmáticos.**
- Debe evitarse el uso de Rupatadina en combinación con fármacos inhibidores del isoenzima CYP3A4 del citocromo P450.

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Interacciones

Alcohol.

- Rupatadina 10 mg en dosis única junto con alcohol no intensifica los efectos depresores del alcohol sobre la capacidad psicomotora y cognitiva de los individuos, y no varían significativamente las concentraciones plasmáticas del fármaco.
- Dosis \geq 20 mg de Rupatadina en combinación con alcohol sí que pueden producir un efecto depresor a nivel de la función psicomotora.

Hum Psychopharmacol Clin Exp 2006; 21:13-26

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Interacciones

Alimentos.

- La administración junto con alimentos retrasó el tiempo hasta la concentración plasmática máxima de Rupatadina en una hora aproximadamente, aunque sin que se modificara la absorción total.
- Esto no tiene relevancia clínica → **Rupatadina se puede tomar con o sin alimentos.**

Zumo de pomelo.

- Rupatadina con zumo de pomelo aumento el valor del área bajo la curva y la concentración máxima plasmática 3 veces → **no se recomienda su administración conjunta.**

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Interacciones

Azitromicina.

- Antibiótico que se prescribe frecuentemente.
- No se observaron efectos adversos relevantes ni cambios significativos de los principales parámetros farmacocinéticos de Rupatadina ni de sus metabolitos → **la administración conjunta de Rupatadina y Azitromicina se tolera bien y es segura.** [Allergy Clin Immunol Int: J World Allergy Org 2005; Suppl \(1\): 159 \(Abs 410\)](#)

Fluoxetina.

- Rupatadina con Fluoxetina a 60 mg (antidepresivo frecuentemente prescrito) no produce efectos adversos clínicamente relevantes → **no se precisan ajustes de dosis cuando se administran conjuntamente.**

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Poblaciones Especiales

Ancianos.

- Se ha encontrado una ligera prolongación de la semivida de eliminación plasmática → Rupatadina debe emplearse **con precaución en ancianos.**

Niños.

- No hay datos de seguridad y eficacia en niños con edad < 12 años por lo que de momento no se recomienda su uso.
- Hay estudios en marcha.

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Efectos sobre el Sistema Nervioso Central

Efectos anticolinérgicos.

- **Rupatadina no tiene efectos anticolinérgicos** → en los diferentes ensayos clínicos realizados no se producía un cambio significativo de la producción de saliva con dosis únicas de Rupatadina entre 10 y 80 mg.

Efectos depresores del SNC

- A dosis terapéuticas Rupatadina no produce efectos depresores del SNC ni tampoco efecto potenciador de las benzodiazepinas ni del alcohol .

XXV EAACI Congress. Goteborg 2007. Abstract Book: (Abst 1413)

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Seguridad Cardíaca

- “In vitro” ni Rupatadina ni sus metabolitos presentaron alteraciones electrofisiológicas a dosis más de 2.000 veces superiores a las empleadas en clínica.
- “In vivo” (perros, cobayas y ratas): ausencia de efectos cardiocirculatorios a dosis hasta 100 veces superiores a las empleadas en clínica.
- En ninguno de estos estudios se produjeron alteraciones del segmento QT ni del QRS (*torsade de pointes*).

XXV EAACI Congress. Vienna 2006. Abstract Book: 216 (Abst 760)

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Seguridad Cardíaca

- Tras analizar 6450 ECGs de sujetos que habían recibido Rupatadina a diferentes dosis (2,5 a 80mg) se confirma que **Rupatadina no muestra ningún tropismo cardíaco, ni alteraciones cardíacas de relevancia clínica.**
- En un estudio realizado según las recomendaciones de la EMEA y las directrices ICH E14, en 160 voluntarios, se demuestra que **Rupatadina, incluso a dosis 10 veces por encima de las terapéuticas no tiene efectos sobre el ECG y no produce la prolongación de la duración del intervalo QTc.**

Rupatadina tiene un buen perfil de seguridad cardíaca

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

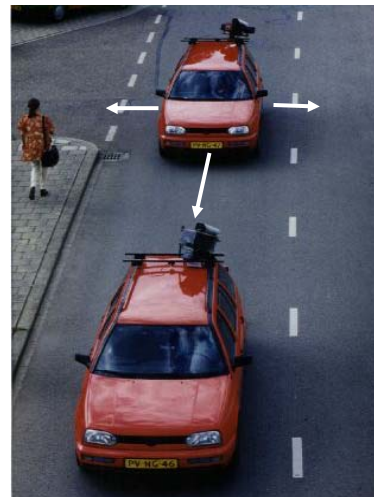
www.alergomurcia.com

Real Driving performance test (Test Driving)

Training car



*Dr. E. Vuurman
Brain & Behavior Institute
Faculty of Medicine,
Maastricht University
The Netherlands*



Hum. Psychopharmacol Clin Exp 2007; 22: 289–297.

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Rupatadina – Driving test

Efecto sobre la capacidad de conducción.

Rupatadina 10 mg no tiene efectos negativos sobre la capacidad de conducir vehículos, según un estudio realizado en condiciones reales de conducción.



Hum. Psychopharmacol Clin Exp 2007; 22: 289–297.

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Perfil de Reacciones Adversas

Resumen de la Incidencia de reacciones adversas relacionadas en ensayos clínicos controlados

Acontecimientos Adversos	Tratamiento			
	Placebo (n=1315)		Rupatadina 10 mg (n=2025)	
	n	%	n	%
Cefalea	74	5.6	139	6.8
Somnolencia	45	3.4	192	9.5
Mareo	.	.	21	1.0
Fatiga	26	2.0	64	3.2
Astenia	.	.	30	1.5
Boca seca	.	.	24	1.2

Expert Opin Pharmacother (2006) 7(14):1989-2001

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

RESUMEN PRINCIPALES CARACTERISTICAS

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Resumen de las características principales

- *Potente actividad antihistamínica H₁*
- *Inhibidor de los efectos inducidos por el factor de activación plaquetaria (PAF)*
- *Propiedades adicionales antialérgicas y antiinflamatorias aparte del bloqueo de la histamina y los receptores de PAF*
- *Rápida actividad antihistamínica (15 min) y efecto de larga duración (24 h)*
- *Mejoras significativas en los síntomas nasales*
- *Superioridad clínica en comparación con otros fármacos antihistamínicos de segunda generación*

Dr Negro Alvarez
Febrero 2008

www.alergomurcia.com

Resumen de las características principales

- *No produce alteraciones en las pruebas objetivas de actividad psicomotriz*
- *Sin indicios de actividad anticolinérgica significativa a dosis terapéuticas*
- *Similar perfil de acontecimientos adversos en comparación con antihistamínicos de segunda generación disponibles*
- *Sin indicios de efectos cardíacos negativos (intervalo QTc)*
- *Interacciones pk seguras con fármacos metabolizados por el citocromo P450 (CYP3A4).*
- *Primer antihistamínico con resultados de un estudio de seguridad a largo plazo (12 meses) en PER*