

INCI name: DESLORATADINE (8-chloro-6,11-dihydro-11-(4-piperidinylidene)-5H-benzo[5,6]cyclohepta[1,2-6]pyridine)

Uso: Interno

Fator de Correção: Não se aplica

Fator de Equivalência: Não se aplica

DESLORATADINA ANTI-HISTAMÍNICO

Os anti-histamínicos constituem uma importante ferramenta no tratamento da rinite alérgica (RA). Entre eles se destaca a desloratadina, o principal metabólito da loratadina (Norman, Dihlmann, e Rabasseda., 2001). Aprovada para uso em dose única diária independentemente da duração ou sazonalidade dos sintomas, a desloratadina é um anti-histamínico-H1 não sedativo de segunda geração (Villa et al., 2012). Estes compostos apresentam elevada potência, efeito de longa duração e efeitos adversos mínimos. Dificilmente atravessam a barreira hematoencefálica e raramente causam sedação (Bousquet, Van Cauwenberge e Khaltaev., 2001)

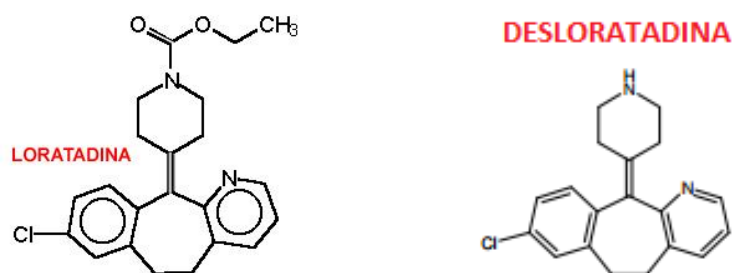


Figura 1: Estruturas loratadina e desloratadina.

Recomendação de uso

A Desloratadina é administrada por via oral, em doses únicas de 5 mg/dia. Em crianças de 2 a 5 anos, pode se administrar 1,25 mg/dia e de 6 a 11 anos 2,5 mg/dia (Buck., 2011).

Aplicações

- ✓ Alívio sintomático de processos alérgicos como rinite e urticária crônica;
- ✓ Rinorréia;
- ✓ Obstrução nasal;
- ✓ Prurido nasal;
- ✓ Espirros.

Vantagens

- ✓ Não causa sonolência;
- ✓ Mais eficaz;
- ✓ Início de ação mais rápida;
- ✓ Duração mais longa;
- ✓ Maior alívio na obstrução nasal.

Mecanismo de ação

Os anti-H1 estão entre os medicamentos mais prescritos no mundo (Simons., 2002). Por terem alta afinidade pelos receptores H1, têm meia vida prolongada, o que lhes possibilita serem administrados em uma ou duas doses diárias (Camelo-Nunes I., 2006).

Sabe-se que os receptores H1 existem em duas isoformas que estão em equilíbrio nas superfícies celulares: uma ativa e outra inativa (Leurs R, Church MK e Taglialatela., 2002). Além disso, possuem um sinal de transdução "agonista-independente", ou seja, que independe da estimulação pela histamina (Leurs R, Church MK e Taglialatela., 2002). Sendo assim, estes receptores encontram-se constitucionalmente na posição "on", ou seja, ativados (Leurs R, Church MK e Taglialatela., 2002). Assim, acredita-se que os anti-H1 inibam essa sinalização constitucional e estabilizem a conformação inativa do receptor, atuando, portanto, como agonistas inversos e não como antagonistas (Leurs R, Church MK e Taglialatela., 2002). Com isso são capazes de diminuir a permeabilidade vascular, a vasodilatação e a secreção glandular, melhorando a coriza nasal, o eritema e edema cutâneo; promover broncodilatação; e reduzir os espirros e o prurido em mucosa nasal e na pele (Simons., 2003).

Além disso, muitos anti-H1, em doses apropriadas, são capazes de inibir a própria ativação mastocitária (Cuss., 1999). Alguns podem regular a expressão e/ou a liberação de citocinas, quimocinas, moléculas de adesão e mediadores inflamatórios (Marshall., 2000; Bousquet, Van Cauwenberge e Khaltaev., 2001).

Assim, as propriedades antialérgicas dos anti-H1 geralmente dizem respeito à sua capacidade de afetar a atividade de mastócitos e basófilos, inibindo a liberação de mediadores pré-formados, como histamina, triptase, leucotrienos e outros (Marshall., 2000).

Comprovação de eficácia

1. Comprovação da ação sobre a Rinite (*in vivo*)

Estudo observacional analisou o uso da desloratadina no tratamento da rinite alérgica em adolescentes e adultos. Os resultados sugerem que a desloratadina na dosagem usual foi eficaz no controle de sinais e sintomas de RA, foi bem tolerada e proporcionou elevados índices de adesão ao esquema de tratamento. Igualmente, foi apontada pela maioria dos pacientes como mais eficaz, com início de ação mais rápido, com duração de ação mais longa e proporcionou maior alívio na obstrução nasal do que a fexofenadina, cetirizina e a loratadina (Solé, Miniti e Jen 2002).

2. Comprovação da ação sobre a Urticária (*in vivo*)

Estudo observou a eficácia clínica e tolerabilidade da desloratadina no tratamento da urticária. Os resultados sugerem que a desloratadina atua significativamente na remissão do prurido, no número e no tamanho das urticas e na melhora da qualidade de vida do paciente (Criado., 2004).

Associações

A desloratadina pode ser associada a ativos que ajudem a fortalecer o sistema imunológico como o **EpiCor®** que também possui ação antialérgica.



Referências bibliográficas

1. ANVISA, Bulário Eletrônico.
2. Bousquet J, Van Cauwenberge P, Khaltaev N; Aria Workshop Group; World Health Organization. Allergic rhinitis and its impact on asthma. *J Allergy Clin Immunol.*;108:S147-334. 2001.
3. Buck ML. Loratadine and desloratadine use in children. *Paediatric Pharmacotherapy.* 17(5):1-5. 2011.
4. Camelo-Nunes IC.; *Jornal de Pediatria - Vol. 82, Nº5(Supl), 2006.*
5. Criado, P.R., Observação clínica da eficácia e tolerabilidade da desloratadina no tratamento da urticária. *rev. bras. med;*61(3):133-139, mar. 2004.
6. Cuss FM. Beyond the histamine receptor: effect of antihistamines on mast cells. *Clin Exp Allergy.* 1999;3:54-9.
7. Leurs R, Church MK, Taglialatela M. H1-antihistamines: inverse agonism, anti-inflammatory actions and cardiac effects. *Clin Exp Allergy.* 2002;32:489-98.
8. Marshall GD Jr. Therapeutic options in allergic disease: antihistamines as systemic antiallergic agents. *J Allergy Clin Immunol.* 106:S303-9.2000.
9. Norman P, Dihlmann A, Rabasseda X. Desloratadine: A preclinical and clinical overview. *Drugs Today (Barc).* 2001 Apr;37(4):215-227.
10. Simons FE. Comparative pharmacology of H1 antihistamines: clinical relevance. *Am J Med.*;113:Suppl 9A:38S-46S. 2002.
11. Simons FE. H1-Antihistamines: more relevant than ever in the treatment of allergic disorders. *J Allergy Clin Immunol.* ;112:S42-52. 2003.
12. SOLÉ, D., MINITI, A., JEN, L. H. Desloratadina no tratamento da rinite alérgica em adolescentes e adultos: uma análise de estudo observacional. *RBM Revista Brasileira de Medicina.* V 59 N 10/11. 2002.
13. SWEETMAN, S.C; et al; MARTINDALE - Guia Completo de Consulta farmacoterapêutica. Barcelona. 2ª Ed. 2005.
14. Villa E, Rogkakou A, Garelli V, Canonica GW. Review of Desloratadine Data Using the ARIA Guidelines. *The World Allergy Organization journal.* 5(Suppl 1):S6-S13. 2012.

Última atualização: 20/07/2017 BM.

