

RUPATADINA

Nº 6 / 2004

Antagonista de la histamina, con actividad selectiva sobre los receptores H1 periféricos, de acción prolongada y no sedante.

MECANISMO DE ACCIÓN

Se ha propuesto un mecanismo de acción doble: por un lado actúa como un antagonista de los receptores H1 de la histamina y además ha demostrado que bloquea los receptores del factor activador de las plaquetas (FAP). El FAP, al igual que la histamina provoca broncoconstricción y aumento de la permeabilidad vascular, interviniendo como mediador en los procesos inflamatorios, pudiendo ser el responsable de las manifestaciones de la hiperreactividad bronquial. Este doble mecanismo proporcionaría a rupatadina una mayor eficacia clínica respecto a los fármacos que presentan una acción antihistamínica aislada; sin embargo *la relevancia clínica de este hecho está todavía por confirmar.* (1,2,3,4)

INDICACIONES (1)

La rupatadina está aprobada en España para el tratamiento de los síntomas asociados a la rinitis alérgica estacional y perenne.



POSOLOGÍA

- **Adultos y adolescentes mayores de 12 años:** 10 mg (un comprimido) una vez al día, con o sin alimentos.
- **Mayores de 65 años:** debe utilizarse con precaución aunque no es necesario reducir la dosis.
- **Niños:** no se ha establecido la seguridad ni la eficacia en pacientes menores de 12 años.
- **Pacientes con insuficiencia renal o hepática:** no se recomienda su administración. (1)

FARMACOCINÉTICA

Tras su administración oral se absorbe rápidamente, alcanzando su concentración plasmática máxima antes de una hora ($t_{max}=0,75$). La absorción es prácticamente completa, uniéndose a proteínas plasmáticas en un 99%; la ingesta de alimentos no afecta su absorción. Se metaboliza a nivel hepático por el citocromo P-450 y presenta una semivida de 5,9 horas eliminándose el 35% en orina y el 61% en heces. (1,5,6)

EFFECTOS SECUNDARIOS

Los efectos adversos más frecuentes (1-10%) con rupatadina son astenia, fatiga y somnolencia; con menor frecuencia (0,1-1%) aparecen sequedad de boca, faringitis, dispepsia, aumento de apetito y rinitis. (1)

En la escasa información clínica disponible, el efecto adverso más frecuente fueron las cefaleas con una incidencia del 16% al 23,4%. (7)

Por el momento, no se ha observado alargamiento del intervalo QT del electrocardiograma; en este aspecto tan solo se dispone de un abstract que presenta datos de 290 personas sanas y 790 pacientes tratados con dosis de 2 y 80 mg durante 4 semanas, en los que no se observaron alteraciones. (8)

INTERACCIONES

No se recomienda el uso de rupatadina junto con **ketoconazol** o **eritromicina** (6) (la administración concomitante aumenta 10 veces y 2-3 veces respectivamente la exposición sistémica a rupatadina) y en general con **otros inhibidores del isoenzima CYP3A4** (antifúngicos azólicos, claritromicina, nefazodona e inhibidores de la proteasa).

Alcohol: a la dosis de 10 mg, rupatadina no potencia los efectos del alcohol. Sin embargo a la dosis de 20 mg sí se observa esta potenciación.

Como ocurre con otros antihistamínicos no pueden excluirse interacciones con otros fármacos **depresores del Sistema Nervioso central.** (1)



CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

- Debe utilizarse con precaución en pacientes ancianos.
- Dado que no hay experiencia clínica en pacientes con insuficiencia renal o hepática y menores de 12 años, no se recomienda su uso.
- Se debe advertir a los pacientes que deberán tener precaución al conducir o manejar maquinaria.
- No hay datos clínicos sobre la exposición de rupatadina durante el embarazo ni la lactancia, por lo que no se debería utilizar rupatadina a menos que los potenciales efectos beneficiosos para la madre justifiquen el riesgo potencial para el feto o lactante. (1,2)

EFICACIA

- Rupatadina ha sido comparado con **loratadina**, **ebastina** y **placebo** pero por el momento se disponen de pocos ensayos clínicos publicados de forma completa. La mayoría de los datos clínicos disponibles con rupatadina están publicados en forma de abstracts.
- Se ha comparado 10 mg de rupatadina con 10 mg de **ebastina** respectivamente y frente a placebo en **rinitis alérgica estacional** (7,9) mostrando una eficacia superior a placebo y no encontrando diferencias significativas en la puntuación media total de los síntomas diarios (mTDSS) entre ambos fármacos.

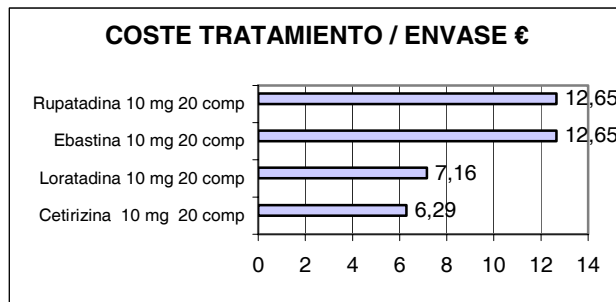
- Por otra parte, en un trabajo en el que se analizaron los resultados de 10 ensayos clínicos realizados con rupatadina frente a placebo en [rinitis alérgica estacional y perenne](#), se observaron mejoras estadísticamente significativas frente a placebo en la reducción de los síntomas diarios de la rinitis alérgica estacional y un aumento de los días sin síntomas o con síntomas leves en la rinitis perenne. (10)
- Finalmente en un ensayo clínico publicado con rupatadina (20 y 10 mg) frente a loratadina (10 mg) en [rinitis alérgica estacional](#) no se observaron diferencias significativas en la puntuación media total de los síntomas diarios (mTDSS) y concluye que 10 mg de rupatadina es suficiente para el control de los síntomas. (11)

CONCLUSIONES

1. Rupatadina es un nuevo antihistamínico anti H1, recientemente comercializado para el tratamiento de la rinitis alérgica estacional y perenne.
2. El doble mecanismo de acción que presenta (antagonista de la histamina y del factor de la activación plaquetaria), podría proporcionarle una mayor eficacia clínica respecto a otros antihistamínicos; sin embargo la importancia clínica de este hecho no ha sido establecida.
3. En los pocos datos clínicos publicados no ha mostrado una eficacia superior a otros antihistamínicos H1 cuyo perfil de eficacia y seguridad es mejor conocido con un menor coste y mayor experiencia de uso.

BIBLIOGRAFÍA

1. Ficha Técnica RUPAFIN®. Laboratorios Uriach. AGEMED Mº de Sanidad y Consumo 2004
2. Merlos M. Rupatadine, a new non-sedating antihistamine and PAF antagonist. Meth Find Esper Clin Pharmacol 2002;24 (SupplA):37
3. Merlos M, Giral M, Balsar D, Ferrando R, Queralt M, Puigdemont A, Garcia-Rafanell J, Forn J. Rupatadine, a new potent, orally active dual antagonist of histamine and platelet-activating factor (PAF). Pharmacol Exp Ther 1997; 280 (1):114-21
4. Caballero R, Valenzuela C, Longobardo M, Tamargo J, Delpon E. Effects of rupatadine, a new dual antagonist of histamine and platelet-activating factor receptors on human cardiac kv1.5 channels. Br J Pharmacol 1999 Nov, 128 (5):1071-81
5. Rupatadina. Nuevo Medicamento a examen. Comité de Evaluación de Nuevos Medicamentos. Departamento de Sanidad 2003, Nº 79
6. Izquierdo I, Merlos M, Garcia Rafanell J. Rupatadine: a new selective histamine H1 receptor and platelet-activating factor (PAF) antagonist. A review of pharmacological profile and clinical management of allergic rhinitis. Drugs of Today 2003, 39 (6):451-68
7. Izquierdo I, Lurigados C, Pérez I, Forn J. Rupatadine exhibits a better profile than ebastine in patients with seasonal allergic rhinitis (abstract). Allergy Immunol 2001; 56 (suppl 68):200
8. Izquierdo I, Pérez I, Villa M, Giral M., Merlos M, Forn J. Lack of electrocardiographic effects of rupatadine, new non-sedating selective histamine H1-receptor and PAF antagonist (abstract). Allergy Immunol 2001; 56 (Suppl 68):200-1
9. Guadano EM, Serra- Batlles J, Meseguer J, Castillo JA, De Molina M, Valero A, Picado C. Rupatadina 10 mg and ebastine 10 mg in seasonal allergic rhinitis: a comparison study. Allergy 2004; 59 (7):766-71
10. Pérez I, De la Cruz G, Villa M, Izquierdo I. Rupatadine in allergic rhinitis: pooled analysis of efficacy data; Allergy Immunol 2002; 57 (Suppl 73) :245
11. Saint-Martin F, Dumur J P, Pérez I, Izquierdo I. A randomized, double-blind, parallel-group study, comparing the efficacy and safety of rupatadine (20 and 10 mg), a new PAF and H1 receptor-specific histamine antagonist, to loratadine 10 mg in the treatment of seasonal allergic rhinitis. J Investig Allergol Clin Immunol 2004; 14 (1):34-40



Coste calculado con la especialidad de menor precio o precio menor si existe.

PRESENTACIONES COMERCIALES	PVP (€)	Dispensación
Alergoliber® 10 mg 20 comprimidos	12,65	Receta médica
Rinialer® 10 mg 20 comprimidos	12,65	
Rupafin® 10 mg 20 comprimidos	12,65	

Fuente: Nomenclator SIFARCAN Mayo 2004

POTENCIAL TERAPÉUTICO



NULO O PEQUEÑO

INDICE ANUAL:

Hoja Nº1: Insulina Glargina.
 Hoja Nº2: Nuevos Principios Activos 2003
 Hoja Nº3: Racecadotril
 Hoja Nº4: Ezetimiba
 Hoja Nº5: Escitalopram

◆ La información que se presenta es la disponible actualmente, siendo susceptible de futuras modificaciones en función de los avances científicos que se produzcan.

Comité Editorial: SERVICIO CÁNTABRO DE SALUD

ISSN: 1576-8287

Dep. Legal: SA 166-2000

<http://www.scsalud.es/publicaciones/>

Autores:

Gutiérrez Pérez I*, Sangrador Rasero A*, Casado Casuso S*
 * Farmacéutica de Atención Primaria.