

desloratadina

Aché Laboratórios Farmacêuticos S.A.

Xarope

0,5 mg/ml

**BULA PARA PROFISSIONAL DE SAÚDE**

**Bula de acordo com a Resolução-RDC nº 47/2009**

**I- IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO**

**desloratadina**

Medicamento Genérico Lei nº 9.787, de 1999

**APRESENTAÇÕES**

Xarope de 0,5 mg/mL: embalagens contendo 1 frasco com 60 ou 100 mL + seringa dosadora.

**USO ORAL**

**USO ADULTO E PEDIÁTRICO ACIMA DE 6 MESES**

**COMPOSIÇÃO**

Cada mL de desloratadina xarope contém:

desloratadina.....0,5 mg

Excipientes: ácido cítrico, benzoato de sódio, citrato de sódio di-hidratado, edetato dissódico di-hidratado, glicerol, propilenoglicol, sucralose, aroma de tutti-frutti e água purificada

**II- INFORMAÇÕES TÉCNICAS AOS PROFISSIONAIS DE SAÚDE**

**1. INDICAÇÕES**

A desloratadina é indicada para o alívio dos sintomas da rinite alérgica como: espirro, rinorreia, prurido e congestão nasal, prurido ocular, lacrimejamento e vermelhidão dos olhos, prurido do palato e tosse.

A desloratadina também é indicada para o alívio dos sinais e sintomas da urticária.

**2. RESULTADOS DE EFICÁCIA**

Além das classificações estabelecidas de sazonal e perene, a rinite alérgica pode ser classificada alternativamente como rinite alérgica intermitente e rinite alérgica persistente de acordo com a duração dos sintomas. A rinite alérgica intermitente é definida como a presença de sintomas por menos de 4 dias por semana ou menos de 4 semanas por ano. A rinite alérgica persistente é definida como a presença de sintomas por 4 dias ou mais por semana e por mais de 4 semanas durante o ano.

Em dois estudos de 4 semanas em pacientes com rinite alérgica (RA) e asma concomitante, a desloratadina foi eficaz na redução dos sintomas de RA e asma, reduzindo o uso de beta 2-agonista e sem ação adversa sobre o VEF1. A melhoria nos sintomas, sem nenhuma diminuição na função pulmonar, sustenta a segurança da administração de desloratadina a pacientes com RA sazonal e asma leve a moderada concomitante.

A urticária idiopática crônica foi estudada como modelo clínico de todas as formas de urticária, uma vez que a fisiopatologia subjacente é similar, independentemente da etiologia e, pelo fato de os pacientes poderem ser mais facilmente recrutados prospectivamente. Já que a liberação de histamina é um fator causal comum, espera-se que a desloratadina seja eficaz em proporcionar alívio sintomático para as outras formas, além da urticária idiopática crônica, conforme aconselhado nas diretrizes clínicas.

A desloratadina foi eficaz no alívio do desconforto da rinite alérgica, como demonstrado pelo escore total do questionário de qualidade de vida das rinoconjuntivites. A grande melhora foi demonstrada nos domínios relacionados a situações rotineiras e atividades diárias limitadas pelos sintomas.

**Referências bibliográficas:**

- C98-001 Dose-Ranging Study of SCH 34117 in the Treatment of Patients with Seasonal Allergic Rhinitis
- C98-223 The Efficacy and Safety of SCH 34117 in the Treatment of Subjects with Seasonal Allergic Rhinitis
- C98-224 Efficacy and Safety of SCH 34117 in Subjects with Seasonal Allergic Rhinitis
- C98-225 Efficacy and Safety of SCH 34117 in Subjects with Seasonal Allergic Rhinitis (Four Weeks of Treatment)

**3. CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS**

A desloratadina é um antagonista não sedante da histamina, de ação prolongada, com potente atividade antagonista seletiva dos receptores H1 periféricos da histamina. A desloratadina tem demonstrado atividades antialérgica, anti-histamínica e anti-inflamatória.

Além da atividade anti-histamínica, a desloratadina tem demonstrado atividades antialérgica e anti-inflamatória em vários estudos *in vitro* (a maioria conduzida em células de origem humana) e *in vivo*. Estes estudos têm demonstrado que a desloratadina inibe a grande cascata de eventos que inicia e propaga a inflamação alérgica, entre eles:

- Liberação das citocinas pró-inflamatórias, dentre elas IL-4, IL-6, IL-8, IL-13;
- Liberação de importantes quimocinas pró-inflamatórias, como RANTES (regulador da atividade normal de célula T expressa e secretada);
- Produção do ânion superóxido pelos neutrófilos polimorfonucleares ativadas;
- Adesão e quimiotaxia de eosinófilos;
- Expressão de moléculas de adesão, como a P-selectina;
- Liberação de histamina, prostaglandina (PGD<sub>2</sub>) e leucotrieno (LTC<sub>4</sub>), dependentes da IgE;
- Resposta broncoconstritora alérgica aguda e tosse alérgica em modelos animais.

**Propriedades farmacodinâmicas:** após administração oral, a desloratadina bloqueia seletivamente os receptores H1 periféricos, uma vez que a droga é efetivamente excluída da entrada do sistema nervoso central (SNC).

A segurança de desloratadina xarope foi demonstrada em três estudos pediátricos. Crianças com idades de 6 meses a 11 anos com histórico comprovado de rinite alérgica (RA) ou urticária idiopática crônica (UIC), que foram candidatas à terapia anti-histamínica, receberam uma dose diária de 1 mg (6 a 11 meses de idade), 1,25 mg (1 a 5 anos de idade) ou 2,5 mg (6 a 11 anos de idade). O tratamento foi bem tolerado, conforme documentado por exames laboratoriais clínicos, sinais vitais e dados sobre intervalos eletrocardiográficos, incluindo QTc. Quando administrada nas doses recomendadas, a atividade farmacocinética da desloratadina foi comparável nas populações pediátrica e adulta. Portanto, como o tratamento da RA/UIC e o perfil da desloratadina são semelhantes em pacientes adultos e pediátricos, dados de eficácia da desloratadina em adultos podem ser extrapolados para a população pediátrica.

Em um estudo com doses múltiplas, com administração diária de até 20 mg de desloratadina, durante 14 dias, não foram observados efeitos cardiovasculares estatística ou clinicamente significantes. Em um estudo farmacológico em que a desloratadina foi

administrada numa dose de 45 mg diariamente (nove vezes a dose clínica), durante dez dias, não foi observado prolongamento do intervalo QTc.

A desloratadina não penetra facilmente no sistema nervoso central. Na dose recomendada de 5 mg diários, não houve incidência excessiva de sonolência em comparação ao placebo. Até na dose de 7,5 mg diários, a desloratadina não afetou o desempenho psicomotor nos estudos clínicos.

Em uma dose única de 5 mg, a desloratadina não interferiu nas medidas de avaliação sobre desempenho em voos, incluindo exacerbação da sonolência subjetiva ou tarefas relativas ao voo.

Não foram observadas alterações clinicamente significativas nas concentrações plasmáticas da desloratadina, nos estudos de interações farmacológicas de doses múltiplas realizados com cetoconazol, eritromicina, azitromicina, fluoxetina e cimetidina.

Nos estudos farmacológicos clínicos, a administração concomitante de álcool não aumentou o prejuízo do desempenho induzido pelo álcool e nem a sonolência. Não houve diferenças significativas nos resultados de testes psicomotores entre os grupos que receberam a desloratadina e o placebo administrados isoladamente ou com álcool.

**Propriedades farmacocinéticas:** concentrações plasmáticas de desloratadina podem ser detectadas dentro de 30 minutos após sua administração. A desloratadina é bem absorvida com pico de concentração plasmática obtida aproximadamente após 3 horas, a meia-vida da fase terminal é de aproximadamente 27 horas. O nível de acúmulo de desloratadina foi consistente com a sua meia-vida (aproximadamente 27 horas) e com a frequência de dose de uma vez ao dia. Em adultos e adolescentes, a biodisponibilidade foi proporcional em relação à dose na faixa de 5 mg até 20 mg.

A desloratadina é moderadamente ligada às proteínas plasmáticas (83% - 87%). Não há evidência clinicamente relevante de acúmulo da droga após doses únicas diárias de desloratadina (5 mg a 20 mg) durante 14 dias.

A enzima responsável pelo metabolismo da desloratadina ainda não foi identificada e, portanto, não se pode excluir totalmente a possibilidade de algumas interações com outras drogas. Estudos *in vivo* com inibidores da CYP3A4 e CYP2D6 específicos demonstraram que estas enzimas não são importantes no metabolismo da desloratadina. A desloratadina não inibe a CYP3A4 e CYP2D6 e também não é substrato nem inibidor da glicoproteína-P.

Em um estudo de dose única com 7,5 mg de desloratadina, não houve efeito da alimentação (café da manhã altamente gorduroso e calórico) na distribuição da desloratadina.

Em uma única dose, em um ensaio cruzado com desloratadina, as formulações comprimido e xarope foram bioequivalentes e não foram afetadas pela presença de alimentação.

Em estudos separados de dose única, dentro das doses recomendadas, pacientes pediátricos tiveram valores de AUC e C<sub>máx</sub> de desloratadina comparáveis aos dos adultos que receberam 5 mg de desloratadina xarope.

#### 4. CONTRAINDICAÇÕES

**Este medicamento é contraindicado para uso por pacientes com hipersensibilidade à substância ativa ou a qualquer um dos seus componentes.**

#### 5. ADVERTÊNCIAS E PRECAUÇÕES

De acordo com estudos clínicos, este medicamento tem pouca ou nenhuma influência sobre a capacidade de dirigir veículos e operar máquinas. Os pacientes devem ser informados de que a maioria das pessoas não apresenta sonolência com o uso deste medicamento. No entanto, como existe uma variação individual da resposta a todos os medicamentos, é recomendado aconselhar os pacientes a não realizar atividades que exigem agilidade mental, como dirigir um carro ou operar máquinas, até que eles tenham estabelecido a sua própria resposta ao medicamento.

#### Uso durante a gravidez e a lactação

Categoria C.

**Este medicamento não deve ser utilizado por mulheres grávidas sem orientação médica ou do cirurgião-dentista.**

Não foram observados efeitos da desloratadina sobre a fertilidade em ratas, em uma exposição 34 vezes maior que a exposição em ser humano na dose clínica recomendada. Não foram observados efeitos teratogênicos, nem mutagênicos nos estudos realizados em animais com a desloratadina. Como não há dados clínicos de gestantes expostas à desloratadina, o uso de desloratadina durante a gravidez não foi estabelecido. A desloratadina não deve ser usada durante a gravidez, a não ser que os benefícios potenciais sejam maiores que o risco.

A desloratadina é excretada no leite materno. Desse modo, o uso de desloratadina não é recomendado para mulheres que estejam amamentando.

#### Uso em crianças

A eficácia e segurança da desloratadina não foram estabelecidas em crianças menores de 6 meses de idade.

Desloratadina Xarope: a eficácia e segurança da desloratadina não foram estabelecidas em crianças menores de 6 meses de idade.

Desloratadina deve ser administrada com cautela em pacientes com histórico médico ou familiar de convulsões. Em particular, crianças jovens podem ser mais suscetíveis ao desenvolvimento de novas convulsões sob tratamento com desloratadina. Os profissionais de saúde podem considerar a descontinuação de desloratadina em pacientes que apresentem convulsão durante o tratamento.

**Não contém açúcar.**

#### 6. INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não foram observadas interações medicamentosas clinicamente significativas com desloratadina nos estudos clínicos.

Não houve alteração na disponibilidade da desloratadina na presença de alimentos ou suco de grapefruit.

A desloratadina administrada concomitantemente com álcool não potencializa os efeitos prejudiciais sobre o desempenho causados pelo álcool.

#### 7. CUIDADOS DE ARMAZENAMENTO DO MEDICAMENTO

Conservar em temperatura ambiente (entre 15 e 30°C). Proteger da luz e umidade.

Desde que respeitados os cuidados de armazenamento, o medicamento apresenta uma validade de 24 meses a contar da data de sua fabricação.

**Número de lote e datas de fabricação e validade: vide embalagem.**

**Não use medicamento com o prazo de validade vencido. Guarde-o em sua embalagem original.**

**Características físicas e organolépticas:** solução incolor, pouco viscosa e com odor característico de tutti frutti.

**Antes de usar, observe o aspecto do medicamento.**

**TUDO MEDICAMENTO DEVE SER MANTIDO FORA DO ALCANCE DAS CRIANÇAS.**

## 8. POSOLOGIA E MODO DE USAR

Em crianças de 6 a 11 meses de idade: 2 mL (1 mg) de desloratadina uma vez por dia, independentemente da alimentação, para alívio dos sintomas associados com a rinite alérgica (incluindo rinite alérgica intermitente e persistente) e urticária. Para uso oral.

Em crianças de 1 a 5 anos de idade: 2,5 mL (1,25 mg) de desloratadina uma vez por dia, independentemente da alimentação, para alívio dos sintomas associados com a rinite alérgica (incluindo rinite alérgica intermitente e persistente) e urticária. Para uso oral.

Crianças de 6 a 11 anos de idade: 5 mL (2,5 mg) de desloratadina uma vez por dia, independentemente da alimentação, para alívio dos sintomas associados com a rinite alérgica (incluindo rinite alérgica intermitente e persistente) e urticária. Para uso oral.

Adultos e adolescentes (maior ou igual a 12 anos de idade): 10 mL (5 mg) de desloratadina uma vez por dia, independentemente da alimentação, para alívio dos sintomas associados com a rinite alérgica (incluindo rinite alérgica intermitente e persistente) e urticária.

Rinite alérgica intermitente: presença dos sintomas durante menos de 4 dias por semana ou por menos de 4 semanas por ano. O paciente deve ser tratado de acordo com a avaliação do histórico da doença do paciente e o tratamento pode ser descontinuado após a resolução dos sintomas e reiniciado com o reaparecimento dos mesmos.

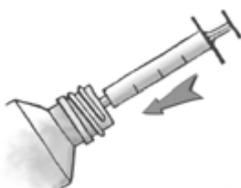
Rinite alérgica persistente: presença de sintomas durante 4 dias ou mais por semana por mais de 4 semanas ao ano. Pode ser proposto tratamento contínuo aos pacientes durante períodos de exposição aos alérgenos.

O paciente deve ser orientado a utilizar desloratadina conforme indicado.

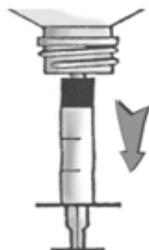
O paciente deve ser aconselhado a não aumentar a dose ou a frequência da dose, uma vez que não há estudos que demonstrem aumento da efetividade em doses maiores e sonolência pode ocorrer.

### Instruções de uso da seringa dosadora:

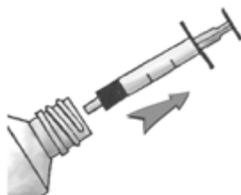
1. Adaptar a seringa dosadora no adaptador de frasco (fig. 1).



2. Virar o frasco e aspirar à medida desejada. Puxar cuidadosamente o êmbolo, medindo a quantidade exata em mL, conforme a posologia recomendada pelo seu médico (fig. 2).



3. Retirar a seringa dosadora (fig. 3).



4. Esvaziar a seringa dosadora lentamente na boca, com a cabeça inclinada para trás. (fig. 4).



5. Tampar o frasco sem retirar o adaptador. (fig. 5).



6. Lavar bem a seringa dosadora com água corrente.

Observações: O adaptador e a seringa dosadora são de uso exclusivo para administração de desloratadina por via oral. O manuseio da seringa dosadora deve ser feito somente por adultos.

#### 9. REAÇÕES ADVERSAS

Em um estudo clínico em uma população pediátrica, desloratadina xarope foi administrada a um total de 246 crianças com idade de 6 meses a 11 anos. A incidência global de eventos adversos foi semelhante para os grupos desloratadina e placebo. Em crianças de 6 a 23 meses, os eventos adversos mais frequentes relatados, superiores ao do placebo foram: diarreia (3,7%), febre (2,3%) e insônia (2,3%).

Outras reações adversas podem ocorrer com o uso de desloratadina.

Muito raras (ocorrem em até 0,01% dos pacientes que utilizam este medicamento): casos de reações de hipersensibilidade (incluindo anafilaxia e erupções cutâneas), taquicardia, palpitações, convulsões, hiperatividade psicomotora, sonolência, enzimas hepáticas e bilirrubina elevadas, hepatite, aumento do apetite, alucinações, dor abdominal, náusea, vômitos, dispepsia e mialgia; Frequência desconhecida: alteração de comportamento, agressividade, prolongamento do intervalo QT, fotossensibilidade e astenia.

**Em casos de eventos adversos, notifique pelo Sistema VigiMed, disponível no Portal da Anvisa.**

#### 10. SUPERDOSE

De acordo com o verificado no uso pós comercialização, o perfil de eventos adversos associados à superdose é similar àquele observado com doses terapêuticas, embora a magnitude dos efeitos possa ser maior.

##### Tratamento

Em caso de superdose, considerar as medidas estabelecidas para remoção de substâncias ativas não absorvidas. O tratamento auxiliar dos sintomas é recomendado.

A desloratadina não é eliminada via hemodiálise. Não se sabe se é eliminada via diálise peritoneal.

##### Sintomas

Em um ensaio clínico de dose múltipla, em que até 45 mg de desloratadina foram administrados (nove vezes a dose clínica), não foram observados efeitos clinicamente relevantes.

##### População pediátrica

De acordo com o verificado no uso pós comercialização, o perfil de eventos adversos associados à superdose é similar àquele observado com doses terapêuticas, embora a magnitude dos efeitos possa ser maior.

**Em caso de intoxicação ligue para 0800 722 6001, se você precisar de mais orientações.**

### III- DIZERES LEGAIS

MS – 1.0573.0616

Farmacêutica Responsável: Gabriela Mallmann – CRF-SP nº 30.138

Registrado por:

**Aché Laboratórios Farmacêuticos S.A.**  
Av. Brigadeiro Faria Lima, 201 – 20º andar  
São Paulo – SP  
CNPJ 60.659.463/0029-92  
Indústria Brasileira

Fabricado por:

**Aché Laboratórios Farmacêuticos S.A.**  
Guarulhos – SP

Siga corretamente o modo de usar, não desaparecendo os sintomas procure orientação médica.



Histórico de Alterações da Bula

Dados da submissão eletrônica			Dados da petição/notificação que altera a bula				Dados das alterações de bulas		
Data do expediente	Nº do expediente	Assunto	Data do expediente	Nº do expediente	Assunto	Data de aprovação	Itens de bula	Versões (VP/VPS)	Apresentações relacionadas
25/09/2014	0800974/14-1	10459 - Inclusão Inicial de Texto de Bula – RDC 60/12	NA	NA	NA	NA	Adequação ao medicamento referência	VP/VPS	Xarope 0,5 mg/mL
29/10/2014	0970196/14-6	10452 - GENÉRICO – Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	NA	NA	NA	NA	Informações ao paciente / Informações técnicas aos Profissionais de saúde.	VP/VPS	Xarope 0,5 mg/mL
13/09/2018	0894633/18-7	10452 - GENÉRICO – Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	NA	NA	NA	NA	<p><b>VP</b></p> <p>2. COMO ESTE MEDICAMENTO FUNCIONA? 4. O QUE DEVO SABER ANTES DE USAR ESTE MEDICAMENTO? 6. COMO DEVO USAR ESTE MEDICAMENTO? 8. QUAIS OS MALES QUE ESTE MEDICAMENTO PODE ME CAUSAR? 9. O QUE FAZER SE ALGUÉM USAR UMA QUANTIDADE MAIOR DO QUE A INDICADA DESTE MEDICAMENTO?</p> <p><b>VPS</b></p> <p>5. ADVERTÊNCIAS E PRECAUÇÕES 8. POSOLOGIA E MODO DE USAR 9. REAÇÕES ADVERSAS 10. SUPERDOSE</p>	VP/VPS	Xarope 0,5 mg/mL
11/10/2018	0988947/18-7	10452 - GENÉRICO – Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	NA	NA	NA	NA	Apresentações	VP/VPS	Xarope 0,5 mg/mL

Dados da submissão eletrônica			Dados da petição/notificação que altera a bula				Dados das alterações de bulas		
Data do expediente	Nº do expediente	Assunto	Data do expediente	Nº do expediente	Assunto	Data de aprovação	Itens de bula	Versões (VP/VPS)	Apresentações relacionadas
28/05/2019	0475348/19-8	10452 - GENÉRICO – Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	05/12/2018	1199003/18-1	1959 – GENÉRICO – Solicitação de Transferência de Titularidade de Registro (Incorporação de Empresa)	28/01/2019	<b>VP</b> III – DIZERES LEGAIS <b>VPS</b> 9. REAÇÕES ADVERSAS III – DIZERES LEGAIS	VP/VPS	Xarope 0,5 mg/mL
08/10/2020	3459587/20-2	10452 - GENÉRICO – Notificação de Alteração de Texto de Bula – publicação no bulário - RDC 60/12	NA	NA	NA	NA	Apresentações	VP/VPS	Xarope 0,5 mg/mL
06/04/2021	1316100/21-8	10452 - GENÉRICO – Notificação de Alteração de Texto de Bula – publicação no bulário - RDC 60/12	21/12/2020	4519883/20-7	11184 - GENÉRICO - Solicitação de alteração de categoria de venda	09/03/2021	<b>VP</b> 1. PARA QUE ESTE MEDICAMENTO É INDICADO? 4. O QUE DEVO SABER ANTES DE USAR ESTE MEDICAMENTO? 6. COMO DEVO USAR ESTE MEDICAMENTO? 8. QUAIS OS MALES QUE ESTE MEDICAMENTO PODE ME CAUSAR? DIZERES LEGAIS <b>VPS</b> 5. ADVERTÊNCIAS E PRECAUÇÕES 8. POSOLOGIA E MODO DE USAR 9. REAÇÕES ADVERSAS III. DIZERES LEGAIS	VP/VPS	Xarope 0,5 mg/mL
25/06/2021	2464291/21-8	10452 - GENÉRICO – Notificação de Alteração de Texto de Bula – publicação no bulário - RDC 60/12	NA	NA	NA	NA	<b>VP</b> 3. QUANDO NÃO DEVO TOMAR ESTE MEDICAMENTO?	VP/VPS	Xarope 0,5 mg/mL

Dados da submissão eletrônica			Dados da petição/notificação que altera a bula				Dados das alterações de bulas		
Data do expediente	Nº do expediente	Assunto	Data do expediente	Nº do expediente	Assunto	Data de aprovação	Itens de bula	Versões (VP/VPS)	Apresentações relacionadas
07/12/2021	4874618/21-9	10452 – GENÉRICO – Notificação de Alteração de Texto de Bula – publicação no bulário - RDC 60/12	NA	NA	NA	NA	<p><b>VP</b></p> <p>4. O QUE DEVO SABER ANTES DE USAR ESTE MEDICAMENTO?</p> <p><b>VPS</b></p> <p>5. ADVERTÊNCIAS E PRECAUÇÕES</p>	VP/VPS	Xarope 0,5 mg/mL
10/06/2022	-	10452 – GENÉRICO – Notificação de Alteração de Texto de Bula – publicação no bulário - RDC 60/12	NA	NA	NA	NA	<p><b>VP</b></p> <p>1.PARA QUE ESTE MEDICAMENTO É INDICADO?</p> <p>4.O QUE DEVO SABER ANTES DE USAR ESTE MEDICAMENTO?</p> <p>9. O QUE FAZER SE ALGUÉM USAR UMA QUANTIDADE MAIOR DO QUE A INDICADA DESTE MEDICAMENTO?</p> <p><b>VPS</b></p> <p>1. INDICAÇÕES</p> <p>3.CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS</p>	VP/VPS	Xarope 0,5 mg/mL