

## FORMA FARMACÉUTICA E APRESENTAÇÃO

Xarope: 1 frasco com 100 ml.  
USO PEDIÁTRICO OU ADULTO  
USO ORAL

## COMPOSIÇÃO

Cada ml do xarope contém:

loratadina ..... 1 mg  
veículo q.s.p. ....  
(ácido cítrico, benzoato de sódio, glicerol, propilenoglicol, sacarose, aroma de pêssego e água deionizada).

## INFORMAÇÕES AO PACIENTE

- **Ação esperada do medicamento:** loratadina é indicada para o alívio dos sintomas associados com rinite alérgica (por exemplo: febre do feno), como: coceira nasal, nariz escorrendo (coriza), espirros, ardor e coceira nos olhos. Este medicamento é também indicado para o alívio dos sinais e sintomas de urticária e outras alergias da pele.
- **Cuidados de armazenamento:** conservar o produto em temperatura ambiente (entre 15 e 30°C).
- **Prazo de validade:** 24 meses a partir da data de fabricação, que pode ser verificado na embalagem externa do produto. Não use o medicamento com o prazo de validade vencido.

• **Gravidez e lactação:** informe seu médico a ocorrência de gravidez durante o tratamento ou após o seu término. Informe ao médico se está amamentando.

### Uso durante a gravidez e lactação (amamentação)

Não está estabelecido se o uso de loratadina pode acarretar riscos durante a gravidez ou lactação. Portanto, o medicamento só deverá ser utilizado se os benefícios potenciais para a mãe justificarem o risco potencial para o feto.

Considerando que a loratadina é excretada no leite materno e devido ao aumento de risco do uso de anti-histamínicos por crianças, particularmente por recém-nascidos e prematuros, deve-se optar ou pela descontinuação da lactação ou pela interrupção do uso do produto.

- **Cuidados de administração:** siga a orientação do seu médico, respeitando sempre os horários, as doses e a duração do tratamento. Se você esquecer de tomar uma dose na hora certa, tome-a assim que possível e, depois, reajuste os horários de acordo com a última dose tomada, continuando o tratamento de acordo com os novos horários programados. Não tome duas doses de uma só vez.
- **Interrupção do tratamento:** não interrompa o tratamento sem o conhecimento do seu médico.

• **Reações adversas:** informe seu médico o aparecimento de reações desagradáveis como cansaço ou dor de cabeça. Os efeitos mais comuns são: dor de cabeça, cansaço, perturbação estomacal, nervosismo e erupções da pele. Em casos raros, perda de cabelo, reações alérgicas severas e problemas de fígado foram relatados.

"TODO MEDICAMENTO DEVE SER MANTIDO FORA DO ALCANCE DAS CRIANÇAS."

• **Utilização com outras substâncias:** informe seu médico sobre qualquer medicamento que esteja usando, antes do início, ou durante o tratamento. Comunique seu médico se você for fazer algum teste de pele para detectar alergia. O tratamento com loratadina deverá ser suspenso dois dias antes da execução do teste, pois este medicamento poderá afetar os resultados. A loratadina não tem mostrado efeito aditivo com bebidas alcoólicas.

• **Contra-indicações e Precauções:** o produto é contra-indicado a pacientes alérgicos à loratadina ou a outros componentes da formulação (veja **Composição**).

Este medicamento não deve ser utilizado por crianças menores de 2 anos de idade. Se você está grávida ou amamentando, se você é alérgico a sulfatos, conservantes ou corantes de comidas ou se você tem doença no fígado, procure seu médico. Caso você tenha alguma doença no fígado ou insuficiência renal crônica, a dose inicial deverá ser diminuída para 10 ml (10 mg) em dias alternados. Neste caso, procure seu médico.

"Durante o tratamento, o paciente não deve dirigir veículos ou operar máquinas, pois sua habilidade e atenção podem estar prejudicadas".

"Atenção diabéticos: contém açúcar."

**Este medicamento não contém corantes.**

"NÃO TOMAR REMÉDIO SEM O CONHECIMENTO DO SEU MÉDICO. PODE SER PERIGOSO PARA A SAÚDE."

## INFORMAÇÕES TÉCNICAS

### CARACTERÍSTICAS

A loratadina é um anti-histamínico tricíclico potente, de ação prolongada, com atividade seletiva, antagonista, nos receptores H<sub>1</sub> periféricos. A loratadina é rapidamente absorvida no tubo digestivo, após a ingestão oral. As concentrações plasmáticas máximas são atingidas em 1 hora, e sua meia-vida é de 17 a 24 horas. A loratadina é metabolizada no fígado, de forma intensa, em descarboetoxiloratadina, que é o metabólito ativo. Sua ligação a proteínas plasmáticas é de 97 a 99%, e a do metabólito ativo é de 73 a 76%. A insuficiência renal não modifica de forma significativa a farmacocinética da loratadina. Em caso de insuficiência hepática, há modificação dos parâmetros farmacocinéticos, e a dose de loratadina deve ser diminuída.

Nos pacientes idosos, não há necessidade de alteração da dose, pois os parâmetros farmacocinéticos não se modificam de forma significativa.

### ESTUDOS DE FARMACOLOGIA CLÍNICA

*Supressão de Pápulas Cutâneas Induzidas pela Histamina*

A atividade anti-histamínica e o perfil de dose-resposta da loratadina foram avaliados

em estudos de farmacologia clínica utilizando um modelo de supressão de pápulas cutâneas induzidas pela histamina.

Dois estudos randomizados e cegos avaliaram os efeitos de supressão de pápulas da loratadina em doses orais únicas que variaram de 10 a 160 mg. Nessas doses, a loratadina demonstrou um rápido início de ação; a supressão das pápulas ocorreu em um prazo de uma hora após o tratamento. Além disso, todas as doses foram significativamente mais eficazes que o placebo na supressão da formação de pápulas cutâneas induzidas pela histamina (P igual a 0,001).

Em um terceiro estudo randomizado e duplo-cego, os efeitos supressores da loratadina sobre a formação de pápulas induzidas pela histamina foram medidos em doses que variaram de 10 a 40 mg administrados por via oral, duas vezes por dia (2 x/dia) durante 28 dias. A supressão de pápulas foi observada em um prazo de duas horas após a primeira dose de cada tratamento e permaneceu constante durante todo o período de estudo (28 dias). Além disso, todos os três esquemas de dosagem foram significativamente mais eficazes que o placebo na supressão da formação de pápulas (P menor que 0,05); os efeitos de supressão estavam relacionados à dose.

Um estudo randomizado, cruzado bidirecional em pacientes pediátricos comparou a atividade da loratadina em xarope, da terfenadina em suspensão e do placebo na redução de pápulas e rubores induzidos pela histamina. Nesse estudo, doses únicas de 10 mg de loratadina em xarope e de 60 mg de terfenadina em suspensão foram comparáveis na redução das pápulas e rubores induzidos pela histamina e ambos os tratamentos foram significativamente mais eficazes que o placebo.

### FARMACOCINÉTICA CLÍNICA

Nos seres humano, a disposição farmacocinética e metabólica da loratadina com <sup>3</sup>H e <sup>14</sup>C foi investigada em voluntários normais saudáveis, após doses orais únicas. O perfil farmacocinético da loratadina e do seu metabólito ativo, porém menos relevante, a descarboetoxiloratadina, foi avaliada após doses únicas e múltiplas administradas em voluntários normais saudáveis e após doses únicas em voluntários geriátricos saudáveis e em voluntários com comprometimento renal ou hepático. Além disso, foram determinados a proporcionalidade de dose, a biodisponibilidade, a extensão da excreção em leite de mulheres em lactação, o efeito da alimentação sobre a absorção, e a ligação da loratadina às proteínas plasmáticas.

A via metabólica da loratadina nos seres humano é qualitativamente semelhante àquela nos animais. Após uma administração oral, a loratadina é bem absorvida e quase totalmente metabolizada.

Em indivíduos adultos normais, as meias-vidas médias de eliminação foram de 8,4 horas (variando de 3 a 20 horas) para a loratadina e de 28 horas (variando de 8,8 a 92 horas) para a descarboetoxiloratadina, o principal metabólito ativo. Em quase todos os pacientes, a exposição (AUC) ao metabólito foi maior que a exposição ao composto original.

Aproximadamente 40% da dose é excretada na urina e 41% nas fezes durante um período de 10 dias. Aproximadamente 27% da dose é eliminada na urina durante as primeiras 24 horas.

Os resultados dos estudos de ligação a proteínas plasmáticas revelaram que a loratadina está altamente ligada às proteínas plasmáticas humanas (97% a 99%); a descarboetoxiloratadina está moderadamente ligada (73% a 76%).

Em indivíduos idosos (66 a 78 anos de idade), a AUC e o pico dos níveis plasmáticos (C<sub>max</sub>) da loratadina e do seu metabólito foram aproximadamente 50% maiores que nos indivíduos mais jovens.

Em pacientes com comprometimento renal crônico (depuração de creatinina menor que 30 ml/min), tanto a AUC quanto o pico dos níveis plasmáticos (C<sub>max</sub>) aumentaram em média aproximadamente 73% para a loratadina e 120% para o metabólito, em comparação com as AUCs e os picos de níveis plasmáticos (C<sub>max</sub>) de pacientes com função renal normal. As meias-vidas médias de eliminação da loratadina (7,6 horas) e do seu metabólito (23,9 horas) não foram significativamente diferentes daquelas observadas em indivíduos normais. A hemodilise não apresenta um efeito sobre a farmacocinética da loratadina ou do seu metabólito em indivíduos com comprometimento renal crônico.

Em pacientes com doença hepática alcoólica crônica, a AUC e o pico dos níveis plasmáticos (C<sub>max</sub>) da loratadina foram o dobro, ao passo que o perfil farmacocinético do metabólito ativo não foi significativamente alterado em relação àquela de pacientes com função hepática normal. As meias-vidas de eliminação da loratadina e do seu metabólito foram de 24 horas e 37 horas, respectivamente, e aumentaram com o aumento da gravidade da doença hepática.

Nos seres humano, os parâmetros de biodisponibilidade da loratadina e da descarboetoxiloratadina são proporcionais à dose. Os estudos de biodisponibilidade demonstraram a bioequivalência da loratadina administrada por via oral em forma de cápsula, comprimido, suspensão, solução e xarope.

A ingestão concomitante de alimento com a loratadina pode retardar ligeiramente a absorção (em aproximadamente uma hora), mas sem afetar significativamente a AUC. Do mesmo modo, o efeito clínico não é significativamente influenciado.

A loratadina e a descarboetoxiloratadina são eliminadas no leite de mulheres em lactação, com as concentrações no leite sendo semelhantes às concentrações plasmáticas. Cerca de 48 horas após a administração da dose, somente 0,029% da dose de loratadina é eliminada no leite na forma de descarboetoxiloratadina e loratadina sem alteração.

### AVALIAÇÃO DE SEGURANÇA

Os resultados de três estudos de farmacologia clínica de dose única indicam que a loratadina, em doses variando de 10 a 160 mg, foi segura e bem tolerada nos voluntários saudáveis. Cefaleia foi a reação adversa mais frequentemente relatada, ocorrendo

aproximadamente na mesma frequência que no grupo do placebo. Sedação foi relatada em 2% a 6% dos indivíduos que receberam as dosagens maiores de loratadina (40, 80 e 160 mg), em 6% dos indivíduos no grupo do placebo e em 13% daqueles que receberam o anti-histaminico sedativo maleato de clorfeniramina. Além do mais, nos estudos de doses múltiplas (10, 20 e 40 mg 2x/dia durante 28 dias), 8% dos indivíduos em um único grupo de esquema de dosagem de loratadina relataram sedação em comparação com 8% e 67% nos grupos do placebo e da clorfeniramina, respectivamente.

Em um estudo de segurança de longo prazo com voluntários normais do sexo masculino que receberam 40 mg de loratadina 1x/dia durante 13 semanas, a tolerância foi boa e não houve alterações clínicas fora do comum nos valores de testes laboratoriais, eletrocardiogramas ou exames físicos. Ao contrário de outros agentes catiônicos anfílicos, a loratadina não induziu fofosfolipose, e as únicas reações adversas relacionadas à droga relatadas foram soluços e cefaléia.

Um perfil farmacocinético semelhante foi demonstrado em pacientes de 1 a 2 anos de idade que receberam uma dose única contendo 2,5 mg de loratadina, em comparação com crianças mais velhas e adultos que receberam a dose recomendada apropriada do medicamento.

#### Perfil de Segurança com Esquema de Doseagem de 10 mg:

Nos estudos clínicos que utilizaram um esquema de doseagem da loratadina 10 mg 1x/dia em pacientes adultos com rinite alérgica sazonal, as reações adversas mais frequentemente relatadas foram fadiga (6%), sedação (5%), cefaléia (3%) e boca seca (3%). Essas reações, entretanto, também ocorreram nos grupos do placebo e dos comparativos aproximadamente na mesma frequência. Todas as outras reações adversas relatadas ocorreram em 2% ou menos dos pacientes.

## INDICAÇÕES

O produto está indicado para o alívio dos sintomas associados com rinite alérgica tais como: coriza, espirros e prurido nasal, ardor e prurido ocular. Os sinais e sintomas oculares e nasais são rapidamente aliviados após administração oral do produto. O medicamento está também indicado para o alívio dos sinais e sintomas de urticária e outras afecções dermatológicas alérgicas.

## CONTRA-INDICAÇÕES

A loratadina está contra-indicada em pacientes que tenham demonstrado hipersensibilidade ou idiossincrasia a seus componentes.

## PRECAUÇÕES E ADVERTÊNCIAS

A segurança e eficácia de loratadina em crianças abaixo de 2 anos ainda não foi estabelecida.

Pacientes com hepatopatia grave devem iniciar o tratamento com doses baixas de loratadina, uma vez que eles podem ter uma depuração reduzida de loratadina; uma dose inicial de 5 ml (5 mg) diários ou de 10 ml (10 mg) em dias alternados é recomendada.

O tratamento com loratadina xarope para pacientes diabéticos deve ser avaliado pelo médico, visto que a quantidade de sacarose presente em 5 ml (5 mg) de loratadina xarope é de 3 g.

### Uso durante a gravidez e lactação

Não está estabelecido se o uso de loratadina pode acarretar riscos durante a gravidez ou lactação. Portanto, o medicamento só deverá ser utilizado se os benefícios potenciais para a mãe justificarem o risco potencial para o feto. Considerando que a loratadina é excretada no leite materno e devido ao aumento de risco do uso de anti-histaminicos por crianças, particularmente por recém-nascidos e prematuros, deve-se optar ou pela descontinuação da lactação ou pela interrupção do uso do produto. Categoria B para gravidez segundo o FDA.

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

**"Durante o tratamento, o paciente não deve dirigir veículos ou operar máquinas, pois sua habilidade e atenção podem estar prejudicadas."**

**"Atenção: este medicamento contém açúcar, portanto, deve ser usado com cautela em portadores de diabetes."**

## INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Quando administrado concomitantemente com álcool, loratadina não exerce efeitos potencializadores, como foi demonstrado através de avaliações em estudos de desempenho psicomotor.

Um aumento nas concentrações plasmáticas de loratadina tem sido reportado em estudos clínicos controlados, após o uso concomitante com cetoconazol, eritromicina ou cimetidina, porém sem mudanças clinicamente significativas (incluindo eletrocardiografia). Outros medicamentos conhecidos inibidores do metabolismo hepático devem ser co-administrados com cautela, até que estudos definitivos de interação possam ser completados.

## REAÇÕES ADVERSAS

A loratadina não apresenta propriedades sedativas clinicamente significantes quando utilizada na dose recomendada de 10 mg diários. As reações adversas reportadas comumente incluem fadiga, cefaléia,

sonolência, boca seca, transtornos gastrointestinais, tais como náusea e gastrite e também manifestações alérgicas cutâneas (exantema ou rash). A incidência de reações adversas com loratadina xarope tem sido comparável à do placebo. Em estudos clínicos pediátricos controlados, a incidência de cefaléia, sedação, nervosismo, relacionada ao tratamento, foi similar à do placebo, além do que tais eventos foram raramente relatados.

## ALTERAÇÕES DE EXAMES LABORATORIAIS

O tratamento com anti-histaminicos deverá ser suspenso aproximadamente 48 horas antes de se efetuar qualquer tipo de prova cutânea, já que os anti-histaminicos podem impedir ou diminuir as reações que, de outro modo, seriam positivas e portanto, indicativa de reatividade dérmica.

## POSOLOGIA

### Crianças de 2 a 12 anos:

Peso corporal abaixo de 30 kg: 5 ml (5 mg) de loratadina xarope uma vez por dia

Peso corporal acima de 30 kg: 10 ml (10 mg) de loratadina xarope uma vez ao dia

**Adultos e crianças acima de 12 anos:** 10 ml (10 mg) de loratadina xarope uma vez ao dia

**Insuficiência hepática ou renal crônica:** a dose inicial deverá ser diminuída para 10 ml (10 mg) em dias alternados.

No caso de esquecimento de alguma dose, oriente seu paciente a tomar a medicação assim que possível e a manter o mesmo horário da aplicação do medicamento pelo restante do tratamento.

## SUPERDOSE

Sonolência, taquicardia e cefaléia têm sido reportadas com dosagens excessivas. Uma única ingestão de 160 mg de loratadina não produziu efeitos adversos. Em caso de superdose, o tratamento, que deverá ser imediatamente iniciado, é sintomático e coadjuvante.

**Tratamento:** o paciente deverá ser induzido ao vômito, ainda que tenha ocorrido êmese espontânea. O vômito induzido farmacologicamente, através da administração de xarope de ipecacuanha, é o método preferido. Entretanto, não deverão ser induzidos ao vômito pacientes com diminuição do nível da consciência.

A ação da ipecacuanha é facilitada com atividade física e administração de 240 a 360 mililitros de água. Caso não ocorra êmese nos 15 minutos seguintes à administração de ipecacuanha, a dose deverá ser repetida. Deverão ser tomadas precauções contra a aspiração, principalmente em crianças. Após a êmese, pode-se tentar a absorção do restante do fármaco que ainda estiver no estômago, com a ajuda de carvão ativado administrado sob a forma de suspensão em água. Caso o vômito não tenha sido obtido, ou esteja o mesmo contra-indicado, deverá realizar-se lavagem gástrica. O agente preferido para lavagem gástrica em crianças é a solução salina fisiológica. Em adultos, poderá ser usada água corrente; entretanto, antes de proceder-se à instilação seguinte, deverá ser retirado o maior volume possível do líquido já administrado.

Os agentes catiônicos salinos atraem água para os intestinos por osmose e, portanto, podem ser valiosos por sua ação diluente rápida do conteúdo intestinal. A loratadina não é significativamente depurada por hemodiálise. Após administrar-se tratamento de emergência, o paciente deve permanecer sob observação clínica.

## PACIENTES IDOSOS

Nos pacientes idosos, não há necessidade de alteração da dose, pois os parâmetros farmacocinéticos não se modificam de forma significativa. Devem-se seguir as mesmas orientações dadas aos adultos.

## "SIGA CORRETAMENTE O MODO DE USAR, NÃO DESAPARECENDO OS SINTOMAS PROCURE ORIENTAÇÃO MÉDICA."

Data de fabricação, prazo de validade e nº do lote: vide cartucho.

Farm. Resp.: Dra. Miriam Onoda Fujisawa - CRF-SP nº 10.640

MS - 1.0181.0343

**Medley.**

Medley S.A. Indústria Farmacêutica  
Rua Macedo Costa, 55 - Campinas - SP  
CNPJ 50.929.710/0001-79 - Indústria Brasileira



Serviço de  
Informações Medley  
0800 7298000  
www.medley.com.br