

RESUMO DAS CARACTERÍSTICAS DO MEDICAMENTO

1. NOME DO MEDICAMENTO

Claritine 1 mg/ml xarope

2. COMPOSIÇÃO QUALITATIVA E QUANTITATIVA

Cada ml de xarope contém 1 mg de loratadina.

Excipientes com efeito conhecido:

A quantidade de sacarose no xarope de loratadina é 600 mg/ml. A quantidade de sacarose por cada dose de 5 ml (5 mg) é de 3 grama.

Lista completa de excipientes, ver secção 6.1.

3. FORMA FARMACÊUTICA

Xarope.

Xarope límpido, incolor a amarelo-claro.

4. INFORMAÇÕES CLÍNICAS

4.1 Indicações terapêuticas

Claritine está indicado no tratamento sintomático da rinite alérgica e urticária crónica idiopática em adultos e crianças com idade superior a 2 anos.

4.2 Posologia e modo de administração

Posologia

Adultos e crianças com idade superior a 12 anos: 10 ml (10 mg) de xarope uma vez por dia.

População pediátrica

Crianças com idades compreendidas entre 2 e 12 anos, o ajuste posológico é definido de acordo com o peso:

Peso corporal superior a 30 kg: 10 ml (10 mg) de xarope uma vez por dia.

Peso corporal igual ou inferior a 30 kg: 5 ml (5 mg) de xarope uma vez por dia.

A segurança e eficácia de Claritine em crianças com idade inferior a 2 anos não foram estabelecidas. Não existem dados disponíveis.

Doentes com compromisso hepático

Em doentes com compromisso hepático grave deve administrar-se uma dose inicial menor uma vez que a depuração de loratadina pode apresentar-se diminuída. Recomenda-se administrar uma dose inicial de 10 mg em dias alternados em

adultos e crianças com mais de 30 kg de peso, e em crianças com peso igual ou inferior a 30 kg, recomenda-se administrar 5 ml (5 mg) em dias alternados.

Doentes com compromisso renal

Não é necessário efetuar ajustes posológicos em doentes com insuficiência renal.

Idosos

Não é necessário efetuar ajustes posológicos em idosos.

Modo de administração

Via oral. O xarope pode ser tomado com ou sem alimentos.

4.3 Contraindicações

Hipersensibilidade à substância activa ou a qualquer um dos excipientes mencionados na secção 6.1.

4.4 Advertências e precauções especiais de utilização

Claritine deve ser administrado com precaução em doentes com compromisso hepático grave (ver secção 4.2).

Este medicamento contém sacarose. Doentes com problemas hereditários raros de intolerância à frutose, má absorção da glucose-galactose ou insuficiência de sacarase-isomaltase não devem tomar este medicamento.

A administração de Claritine deve ser suspensa pelo menos 48 horas antes de se proceder a testes cutâneos, uma vez que os anti-histamínicos podem anular ou diminuir quaisquer reações positivas aos indicadores de reatividade dérmica.

4.5 Interações medicamentosas e outras formas de interação

O efeito de Claritine não é potenciado pela administração concomitante de álcool, conforme comprovado em estudos sobre o rendimento psicomotor.

Pode ocorrer interação potencial com todos os inibidores conhecidos dos CYP3A4 e CYP2D6 resultando num aumento dos níveis da loratadina (ver secção 5.2), que pode resultar num aumento de acontecimentos adversos.

Foi notificado o aumento da concentração plasmática de loratadina após uso concomitante com cetoconazol, eritromicina e cimetidina em ensaios clínicos controlados, embora sem alterações clinicamente significativas (incluindo eletrocardiográficas).

População pediátrica

Os estudos de interação só foram efetuados em adultos.

4.6 Fertilidade, gravidez e aleitamento

Gravidez

Uma quantidade elevada de dados em mulheres grávidas (mais de 1000 gravidezes expostas) indicam ausência de malformações ou toxicidade fetal/neonatal com loratadina.

Os estudos em animais não indicam efeitos nefastos diretos ou indiretos no que respeita à toxicidade reprodutiva (ver secção 5.3).

Como medida de precaução, é preferível evitar a utilização de Claritine durante a gravidez.

Amamentação

A loratadina é excretada pelo leite humano. Por conseguinte, o uso de Claritine não é recomendado em mulheres a amamentar.

Fertilidade

Não existem dados disponíveis sobre o efeito na fertilidade masculina e feminina.

4.7 Efeitos sobre a capacidade de conduzir e utilizar máquinas

Em ensaios clínicos que avaliaram a capacidade de conduzir, não foi observada nenhuma limitação nos doentes a tomar loratadina. Os efeitos de Claritine sobre a capacidade de conduzir e utilizar máquinas são nulos ou desprezáveis. Contudo, os doentes devem ser informados sobre o facto de que, muito raramente, alguns indivíduos podem sofrer sonolência, a qual pode afetar a sua capacidade de conduzir e utilizar máquinas.

4.8 Efeitos indesejáveis

Resumo do perfil de segurança

Em ensaios clínicos realizados em adultos e adolescentes em diversas indicações incluindo rinite alérgica (RA) e urticária crónica idiopática (UCI), na dose recomendada de 10 mg por dia, as reações adversas com loratadina foram notificadas em mais 2 % dos doentes em excesso comparativamente com aqueles que receberam placebo. As reações adversas mais frequentemente notificadas com uma percentagem superior comparativamente com o placebo foram sonolência (1,2 %), cefaleia (0,6 %), aumento do apetite (0,5 %) e insónia (0,1 %).

Lista tabelar de reações adversas

As reações adversas notificadas durante o período após a comercialização estão listadas na tabela seguinte, de acordo com o sistema Classes de Sistemas de Órgãos. As frequências definem-se como muito frequentes ($\geq 1/10$); frequentes ($\geq 1/100$, $< 1/10$); pouco frequentes ($\geq 1/1.000$, $< 1/100$), raros ($\geq 1/10.000$, $< 1/1.000$); muito raros ($< 1/10.000$) e desconhecido (não pode ser calculado a partir dos dados disponíveis).

Em cada grupo de frequências, as reações adversas encontram-se listadas por ordem de gravidade decrescente.

Classe de sistema de órgãos	Frequência	Termo experiência adversa
Doenças do sistema imunitário	Muito raros	Reações de hipersensibilidade (incluindo angioedema e anafilaxia)
Doenças do sistema nervoso	Muito raros	Tonturas, convulsões

Cardiopatias	Muito raros	Taquicardia, palpitações
Doenças gastrointestinais	Muito raros	Náuseas, xerostomia, gastrite
Afeções hepatobiliares	Muito raros	Alterações da função hepática
Afeções dos tecidos cutâneos e subcutâneos	Muito raros	Exantema, alopecia
Perturbações gerais e alterações no local de administração	Muito raros	Fadiga

População pediátrica

Em ensaios clínicos numa população pediátrica, de crianças com idades compreendidas entre os 2 e os 12 anos, foram notificadas as seguintes reações adversas frequentes, comparativamente ao placebo: cefaleia (2,7%), nervosismo (2,3%) e fadiga (1%).

Notificação de suspeitas de reações adversas

A notificação de suspeitas de reações adversas após a autorização do medicamento é importante, uma vez que permite uma monitorização contínua da relação benefício-risco do medicamento. Pede-se aos profissionais de saúde que notifiquem quaisquer suspeitas de reações adversas diretamente ao INFARMED I.P.

INFARMED, I.P.

Direção de Gestão do Risco de Medicamentos

Parque da Saúde de Lisboa, Av. Brasil 53

1749-004 Lisboa

Tel: +351 21 798 73 73

Linha do Medicamento: 800222444 (gratuita)

Fax: + 351 21 798 73 97

Sítio da internet:

<http://extranet.infarmed.pt/page.seram.frontoffice.seramhomepage>

E-mail: farmacovigilancia@infarmed.pt

4.9 Sobredosagem

A sobredosagem com a loratadina aumentou a ocorrência de sintomas anticolinérgicos. Foram notificadas sonolência, taquicardia, e cefaleia com a administração de sobredosagens.

Na eventualidade de sobredosagem, deverão ser instituídas medidas sintomáticas gerais e de suporte, e mantidas durante o período de tempo que for necessário. Pode tentar-se a administração de carvão ativado misturado com água. Pode considerar-se efetuar uma lavagem gástrica. A loratadina não é eliminada por hemodiálise e desconhece-se se é eliminada por diálise peritoneal. O doente deverá continuar sob observação médica após o tratamento de urgência.

5. PROPRIEDADES FARMACOLÓGICAS

5.1 Propriedades farmacodinâmicas

Grupo farmacoterapêutico: 10.1.2. Medicação antialérgica. Anti-histamínicos. Antagonistas não sedativos, Código ATC: R06A X13.

Mecanismo de ação

A loratadina, a substância ativa de Claritine, é um anti-histamínico tricíclico com uma atividade seletiva sobre os recetores H1 periféricos.

Efeitos farmacodinâmicos

A loratadina não possui propriedades sedativas ou anticolinérgicas clinicamente significativas na maioria da população e quando utilizada na dosagem recomendada.

Durante o tratamento de longo prazo não ocorreram alterações clinicamente significativas nos sinais vitais, valores dos testes laboratoriais, resultados de exames físicos ou eletrocardiogramas.

A loratadina não possui atividade significativa sobre os recetores-H2. Não inibe a recaptção da norepinefrina e não possui praticamente qualquer influência sobre a função cardiovascular ou sobre a atividade intrínseca do pacemaker cardíaco.

Estudos em pápulas cutâneas com histamina, em humanos, revelaram que após administração de uma dose única de 10mg, os efeitos anti-histamínicos são observáveis em 1 – 3 horas, atingindo o pico 8 – 12 horas depois e com duração de 24 horas. Não existe evidência de tolerância a este efeito após 28 dias da administração de loratadina.

Eficácia e segurança clínicas

Em ensaios clínicos controlados foram tratados com loratadina, comprimidos 10 mg, mais de 10.000 pessoas (idade igual ou superior a 12 anos). Os comprimidos de 10 mg de loratadina, uma vez por dia, revelaram efeito superior ao placebo e semelhante à clemastina na melhoria dos sintomas nasais e não nasais da RA. Nestes estudos, a frequência de ocorrência de sonolência foi inferior com a loratadina que com a clemastina e semelhante à terfenadina e placebo.

Entre estas pessoas (idade igual ou superior a 12 anos), foram sujeitas 1.000 pessoas com UCI nos estudos de controlo com placebo. A dose diária única de 10 mg de loratadina revelou ser superior ao placebo na gestão da UCI, como demonstrado pela redução de sintomas associados: prurido, eritema e urticária. Nestes estudos, a incidência de sonolência com loratadina foi semelhante ao placebo.

População pediátrica

Em ensaios clínicos controlados, foram administradas doses únicas de xarope de loratadina, até 10 mg numa dose diária única, a aproximadamente 200 doentes pediátricos (6 a 12 anos de idade) com rinite alérgica sazonal. Noutro estudo, administrou-se uma dose diária única de xarope de loratadina 5 mg a 60 doentes pediátricos (2 a 5 anos de idade). Não foram observados acontecimentos adversos inesperados.

A eficácia pediátrica foi semelhante à eficácia observada em adultos.

5.2 Propriedades farmacocinéticas

Absorção

A loratadina é rápida e bem absorvida. A ingestão concomitante de alimentos pode atrasar ligeiramente a absorção de loratadina mas sem influenciar o efeito clínico. Os parâmetros de biodisponibilidade da loratadina e do seu metabolito ativo são proporcionais à dose.

Distribuição

A loratadina liga-se fortemente às proteínas plasmáticas (97 % a 99 %) e o seu metabolito ativo principal liga-se moderadamente (73 % a 76 %) às mesmas.

Nos indivíduos saudáveis, as semividas de distribuição plasmática de loratadina e do seu metabolito ativo são de cerca de 1 e 2 horas, respetivamente.

Biotransformação

Após administração oral, a loratadina é rápida e bem absorvida, sofrendo um extenso metabolismo de primeira passagem, sobretudo pelos CYP3A4 e CYP2D6. O metabolito principal - a desloratadina (DL) - é farmacologicamente ativo e responsável por uma grande parte do efeito clínico. A loratadina e DL atingem concentrações plasmáticas máximas (Tmax) entre 1-1,5 horas e 1,5-3,7 horas após a administração, respetivamente.

Eliminação

Aproximadamente 40 % da dose é excretada na urina e 42 % nas fezes, durante um período de 10 dias, e sobretudo na forma de metabolitos conjugados. Aproximadamente 27 % da dose é eliminada na urina durante as primeiras 24 horas. Menos de 1 % da substância ativa é excretada sob a forma ativa não alterada, quer como loratadina, quer como DL.

As médias das semividas de eliminação em indivíduos adultos saudáveis, foram 8,4 horas (limites = 3 a 20 horas) para a loratadina e 28 horas (limites = 8,8 a 92 horas) para o metabolito ativo principal.

Compromisso renal

Nos doentes com compromisso renal crónico registou-se um aumento tanto da AUC como dos níveis plasmáticos pico (Cmax) em relação à loratadina e ao seu metabolito ativo, quando comparados com as AUCs e os níveis plasmáticos pico (Cmax) de doentes com função renal normal. As semividas médias de eliminação da loratadina e do seu metabolito ativo não foram significativamente diferentes das observadas nos indivíduos saudáveis. A hemodiálise não exerce qualquer efeito sobre a farmacocinética da loratadina ou do seu metabolito ativo nos doentes com compromisso renal crónico.

Compromisso hepático

Nos doentes com doença hepática alcoólica crónica, observaram-se valores duas vezes superiores na AUC e nos níveis plasmáticos pico (Cmax) da loratadina, não tendo o perfil farmacocinético do metabolito ativo registado alteração significativa quando comparado com o dos doentes com função hepática normal. As semividas de eliminação da loratadina e do seu metabolito ativo foram de 24 horas e 37 horas, respetivamente, tendo aumentado com a gravidade da doença hepática.

Idosos

O perfil farmacocinético da loratadina e do seu metabolito ativo nos voluntários saudáveis adultos é comparável ao observado nos voluntários saudáveis geriátricos.

5.3 Dados de segurança pré-clínica

Os dados não clínicos não revelam riscos especiais para o ser humano, segundo estudos convencionais de segurança, farmacologia, toxicidade de dose repetida, genotoxicidade e potencial carcinogénico.

Não se observaram efeitos teratogénicos em estudos de toxicidade reprodutiva. Contudo, observou-se um prolongamento do tempo de parto e reduzida viabilidade da prole em ratos com níveis plasmáticos (AUC) 10 vezes superiores aos observados com doses clínicas.

6. INFORMAÇÕES FARMACÊUTICAS

6.1 Lista dos excipientes

Propilenoglicol (E1520)
Glicerina (E422)
Ácido cítrico anidro
Benzoato de sódio (E211)
Sacarose
Essência artificial de pêssego
Água purificada

6.2 Incompatibilidades

Não aplicável.

6.3 Prazo de validade

24 meses.

Após a primeira abertura do frasco, o xarope é estável durante 1 mês.

6.4 Precauções especiais de conservação

O medicamento não necessita de quaisquer precauções especiais de conservação. Não congelar. Manter o frasco dentro da embalagem exterior para proteger da luz.

6.5 Natureza e conteúdo do recipiente

Frascos de vidro âmbar de 60, 70, 100 ou 120 ml com uma tampa de polipropileno inviolável, resistente à abertura por crianças. Está incluída uma colher-medida de plástico de 5 ml.

É possível que não sejam comercializadas todas as apresentações.

6.6 Precauções especiais de eliminação e manuseamento

Qualquer medicamento não utilizado ou resíduos devem ser eliminados de acordo com as exigências locais.

7. TITULAR DA AUTORIZAÇÃO DE INTRODUÇÃO NO MERCADO

Bayer Portugal Lda.
Rua Quinta do Pinheiro, 5
2794-003 Carnaxide

8. NÚMERO(S) DA AUTORIZAÇÃO DE INTRODUÇÃO NO MERCADO

N.º de registo: 9777912 – 100 ml xarope, 1 mg/ml, frasco de vidro âmbar

9. DATA DA PRIMEIRA AUTORIZAÇÃO/RENOVAÇÃO DE AUTORIZAÇÃO DE INTRODUÇÃO NO MERCADO

Data da primeira autorização: 18 de abril 1991
Data da última renovação: 02 de outubro de 2009

10. DATA DA REVISÃO DO TEXTO

05/2016

RESUMO DAS CARACTERÍSTICAS DO MEDICAMENTO

1. NOME DO MEDICAMENTO

Claritine 10 mg comprimidos

2. COMPOSIÇÃO QUALITATIVA E QUANTITATIVA

Cada comprimido contém 10 mg de loratadina.

Excipientes com efeito conhecido:

A quantidade de lactose mono-hidratada nos comprimidos de 10 mg de loratadina é 71,3 mg.

Lista completa de excipientes, ver secção 6.1.

3. FORMA FARMACÊUTICA

Comprimido.

Comprimido oval de cor branca a esbranquiçada, com matraz e cápsula, ranhurado e com impressão "10" de um lado e liso do outro.

A ranhura do comprimido destina-se apenas a facilitar a divisão, para ajudar a deglutição, e não para dividir em doses iguais.

4. INFORMAÇÕES CLÍNICAS

4.1 Indicações terapêuticas

Claritine está indicado no tratamento sintomático da rinite alérgica e urticária crónica idiopática em adultos e crianças com idade superior a 2 anos com peso corporal superior a 30 Kg.

4.2 Posologia e modo de administração

Posologia

Adultos e crianças com idade superior a 12 anos: 10 mg uma vez por dia (um comprimido uma vez por dia).

População pediátrica

Crianças com idades compreendidas entre 2 e 12 anos:

Peso corporal superior a 30 kg: 10 mg uma vez por dia (um comprimido uma vez por dia).

Peso corporal igual ou inferior a 30 kg: A dosagem de 10 mg comprimidos não é adequada para crianças com peso corporal igual ou inferior a 30 kg. Existem outras formulações mais apropriadas para crianças com idades compreendidas entre os 2 e 12 anos, com peso igual ou inferior a 30 kg.

A segurança e eficácia de Claritine em crianças com idade inferior a 2 anos não foram estabelecidas. Não existem dados disponíveis.

Doentes com compromisso hepático

Em doentes com compromisso hepático grave deve administrar-se uma dose inicial menor uma vez que a depuração de loratadina pode apresentar-se diminuída. Recomenda-se administrar uma dose inicial de 10 mg em dias alternados em adultos e crianças com mais de 30 kg de peso.

Doentes com compromisso renal

Não é necessário efetuar ajustes posológicos em doentes com insuficiência renal.

Idosos

Não é necessário efetuar ajustes posológicos em idosos.

Modo de administração

Via oral. O comprimido pode ser tomado com ou sem alimentos.

4.3 Contraindicações

Hipersensibilidade à substância ativa ou a qualquer um dos excipientes mencionados na secção 6.1.

4.4 Advertências e precauções especiais de utilização

Claritine deve ser administrado com precaução em doentes com compromisso hepático grave (ver secção 4.2).

Este medicamento contém lactose. Doentes com problemas hereditários raros de intolerância à galactose, deficiência de lactase de Lapp ou má absorção de glucose-galactose não devem tomar este medicamento.

A administração de Claritine deve ser suspensa pelo menos 48 horas antes de se proceder a testes cutâneos, uma vez que os anti-histamínicos podem anular ou diminuir quaisquer reações positivas aos indicadores de reatividade dérmica.

4.5 Interações medicamentosas e outras formas de interação

O efeito de Claritine não é potenciado pela administração concomitante de álcool, conforme comprovado em estudos sobre o rendimento psicomotor.

Pode ocorrer interação potencial com todos os inibidores conhecidos dos CYP3A4 e CYP2D6 resultando num aumento dos níveis da loratadina (ver secção 5.2), que pode resultar num aumento de acontecimentos adversos.

Foi notificado o aumento da concentração plasmática de loratadina após uso concomitante com cetoconazol, eritromicina e cimetidina em ensaios clínicos controlados, embora sem alterações clinicamente significativas (incluindo eletrocardiográficas).

População pediátrica

Os estudos de interação só foram efetuados em adultos.

4.6 Fertilidade, gravidez e aleitamento

Gravidez

Uma quantidade elevada de dados em mulheres grávidas (mais de 1000 gravidezes expostas) indicam ausência de malformações ou toxicidade fetal/neonatal com loratadina.

Os estudos em animais não indicam efeitos nefastos diretos ou indiretos no que respeita à toxicidade reprodutiva (ver secção 5.3).

Como medida de precaução, é preferível evitar a utilização de Claritine durante a gravidez.

Amamentação

A loratadina é excretada pelo leite humano. Por conseguinte, o uso de Claritine não é recomendado em mulheres a amamentar.

Fertilidade

Não existem dados disponíveis sobre o efeito na fertilidade masculina e feminina.

4.7 Efeitos sobre a capacidade de conduzir e utilizar máquinas

Em ensaios clínicos que avaliaram a capacidade de conduzir, não foi observada nenhuma limitação nos doentes a tomar loratadina. Os efeitos de Claritine sobre a capacidade de conduzir e utilizar máquinas são nulos ou desprezáveis. Contudo, os doentes devem ser informados sobre o facto de que, muito raramente, alguns indivíduos podem sofrer sonolência, a qual pode afetar a sua capacidade de conduzir e utilizar máquinas.

4.8 Efeitos indesejáveis

Resumo do perfil de segurança

Em ensaios clínicos realizados em adultos e adolescentes em diversas indicações incluindo rinite alérgica (RA) e urticária idiopática crónica (UCI), na dose recomendada de 10 mg por dia, as reações adversas com loratadina foram notificadas em mais 2 % dos doentes em excesso comparativamente com aqueles que receberam placebo. As reações adversas mais frequentemente notificadas com uma percentagem superior comparativamente com o placebo foram sonolência (1,2 %), cefaleia (0,6 %), aumento do apetite (0,5 %) e insónia (0,1 %).

Lista tabelar de reações adversas

As reações adversas notificadas durante o período após a comercialização estão listadas na tabela seguinte, de acordo com o sistema Classes de Sistemas de Órgãos. As frequências definem-se como muito frequentes ($\geq 1/10$); frequentes ($\geq 1/100$, $< 1/10$); pouco frequentes ($\geq 1/1.000$, $< 1/100$), raros ($\geq 1/10.000$, $< 1/1.000$); muito raros ($< 1/10.000$) e desconhecido (não pode ser calculado a partir dos dados disponíveis).

Em cada grupo de frequências, as reações adversas encontram-se listadas por ordem de gravidade decrescente.

Classe de sistema de órgãos	Frequência	Termo experiência adversa
Doenças do sistema imunitário	Muito raros	Reações de hipersensibilidade (incluindo angioedema e anafilaxia)

Doenças do sistema nervoso	Muito raros	Tonturas, convulsões
Cardiopatias	Muito raros	Taquicardia, palpitações
Doenças gastrointestinais	Muito raros	Náuseas, xerostomia, gastrite
Afeções hepatobiliares	Muito raros	Alterações da função hepática
Afeções dos tecidos cutâneos e subcutâneos	Muito raros	Exantema, alopecia
Perturbações gerais e alterações no local de administração	Muito raros	Fadiga

População pediátrica

Em ensaios clínicos numa população pediátrica, de crianças com idades compreendidas entre os 2 e os 12 anos, foram notificadas as seguintes reações adversas frequentes, comparativamente ao placebo: cefaleia (2,7%), nervosismo (2,3%) e fadiga (1%).

Notificação de suspeitas de reações adversas

A notificação de suspeitas de reações adversas após a autorização do medicamento é importante, uma vez que permite uma monitorização contínua da relação benefício-risco do medicamento. Pede-se aos profissionais de saúde que notifiquem quaisquer suspeitas de reações adversas diretamente ao INFARMED I.P.

INFARMED, I.P.

Direção de Gestão do Risco de Medicamentos

Parque da Saúde de Lisboa, Av. Brasil 53

1749-004 Lisboa

Tel: +351 21 798 73 73

Linha do Medicamento: 800222444 (gratuita)

Fax: + 351 21 798 73 97

Sítio da internet:

<http://extranet.infarmed.pt/page.seram.frontoffice.seramhomepage>

E-mail: farmacovigilancia@infarmed.pt

4.9 Sobredosagem

A sobredosagem com a loratadina aumentou a ocorrência de sintomas anticolinérgicos. Foram notificadas sonolência, taquicardia, e cefaleia com a administração de sobredosagens.

Na eventualidade de sobredosagem, deverão ser instituídas medidas sintomáticas gerais e de suporte, e mantidas durante o período de tempo que for necessário. Pode tentar-se a administração de carvão ativado misturado com água. Pode considerar-se efetuar uma lavagem gástrica. A loratadina não é eliminada por hemodiálise e desconhece-se se é eliminada por diálise peritoneal. O doente deverá continuar sob observação médica após o tratamento de urgência.

5. PROPRIEDADES FARMACOLÓGICAS

5.1 Propriedades farmacodinâmicas

Grupo farmacoterapêutico: 10.1.2. Medicação antialérgica. Anti-histamínicos. Anti-histamínicos não sedativos.

Código ATC: R06A X13.

Mecanismo de ação

A loratadina, a substância ativa de Claritine, é um anti-histamínico tricíclico com uma atividade antagonista seletiva sobre os receptores H1 periféricos.

Efeitos farmacodinâmicos

A loratadina não possui propriedades sedativas ou anticolinérgicas clinicamente significativas na maioria da população e quando utilizada na dosagem recomendada.

Durante o tratamento de longo prazo não ocorreram alterações clinicamente significativas nos sinais vitais, valores dos testes laboratoriais, resultados de exames físicos ou eletrocardiogramas.

A loratadina não possui atividade significativa sobre os receptores-H2. Não inibe a recaptção da norepinefrina e não possui praticamente qualquer influência sobre a função cardiovascular ou sobre a atividade intrínseca do pacemaker cardíaco.

Estudos em pápulas cutâneas com histamina, em humanos, revelaram que após administração de uma dose única de 10mg, os efeitos anti-histamínicos são observáveis em 1 – 3 horas, atingindo o pico 8 – 12 horas depois e com duração de 24 horas. Não existe evidência de tolerância a este efeito após 28 dias da administração de loratadina.

Eficácia e segurança clínicas

Em ensaios clínicos controlados foram tratados com loratadina, comprimidos 10 mg, mais de 10.000 pessoas (idade igual ou superior a 12 anos). Os comprimidos de 10 mg de loratadina, em dose única, revelaram efeito superior ao placebo e semelhante à clemastina na melhoria dos sintomas nasais e não nasais da RA. Nestes estudos, a frequência de ocorrência de sonolência foi inferior com a loratadina que com a clemastina e semelhante à terfenadina e placebo.

Entre estas pessoas (idade igual ou superior a 12 anos), foram sujeitas 1.000 pessoas com UCI nos estudos de controlo com placebo. A dose diária única de 10 mg de loratadina revelou ser superior ao placebo na gestão da UCI, como demonstrado pela redução de sintomas associados: prurido, eritema e urticária. Nestes estudos, a incidência de sonolência com loratadina foi semelhante ao placebo.

População pediátrica

Em ensaios clínicos controlados, foram administradas doses únicas de xarope de loratadina, até 10 mg numa dose diária única, a aproximadamente 200 doentes pediátricos (6 a 12 anos de idade) com rinite alérgica sazonal. Noutro estudo, administrou-se uma dose diária única de xarope de loratadina 5 mg a 60 doentes pediátricos (2 a 5 anos de idade). Não foram observados acontecimentos adversos inesperados.

A eficácia pediátrica foi semelhante à eficácia observada em adultos.

5.2 Propriedades farmacocinéticas

Absorção

A loratadina é rápida e bem absorvida. A ingestão concomitante de alimentos pode atrasar ligeiramente a absorção de loratadina mas sem influenciar o efeito clínico. Os parâmetros de biodisponibilidade da loratadina e do seu metabolito são proporcionais à dose.

Distribuição

A loratadina liga-se fortemente às proteínas plasmáticas (97 % a 99 %) e o seu metabolito ativo principal, desloratadina (DL) liga-se moderadamente (73 % a 76 %) às mesmas.

Nos indivíduos saudáveis, as semividas de distribuição plasmática de loratadina e do seu metabolito ativo são de cerca de 1 e 2 horas, respetivamente.

Biotransformação

Após administração oral, a loratadina é rápida e bem absorvida, sofrendo um extenso metabolismo de primeira passagem, sobretudo pelos CYP3A4 e CYP2D6. O metabolito principal - a desloratadina (DL) - é farmacologicamente ativo e responsável por uma grande parte do efeito clínico. A loratadina e DL atingem concentrações plasmáticas máximas (Tmax) entre 1-1,5 horas e 1,5-3,7 horas após a administração, respetivamente.

Eliminação

Aproximadamente 40 % da dose é excretada na urina e 42 % nas fezes, durante um período de 10 dias, e sobretudo na forma de metabolitos conjugados. Aproximadamente 27 % da dose é eliminada na urina durante as primeiras 24 horas. Menos de 1 % da substância ativa é excretada sob a forma ativa não alterada, quer como loratadina, quer como DL.

As médias das semividas de eliminação em indivíduos adultos saudáveis, foram 8,4 horas (limites = 3 a 20 horas) para a loratadina e 28 horas (limites = 8,8 a 92 horas) para o metabolito ativo principal.

Compromisso renal

Nos doentes com compromisso renal crónico registou-se um aumento tanto da AUC como dos níveis plasmáticos pico (Cmax) em relação à loratadina e ao seu metabolito ativo, quando comparados com as AUCs e os níveis plasmáticos pico (Cmax) de doentes com função renal normal. As semividas médias de eliminação da loratadina e do seu metabolito ativo não foram significativamente diferentes das observadas nos indivíduos saudáveis. A hemodiálise não exerce qualquer efeito sobre a farmacocinética da loratadina ou do seu metabolito ativo nos doentes com compromisso renal crónico.

Compromisso hepático

Nos doentes com doença hepática alcoólica crónica, observaram-se valores duas vezes superiores na AUC e nos níveis plasmáticos pico (Cmax) da loratadina, não tendo o perfil farmacocinético do metabolito ativo registado alteração significativa quando comparado com o dos doentes com função hepática normal. As semividas de eliminação da loratadina e do seu metabolito foram de 24 horas e 37 horas, respetivamente, tendo aumentado com a gravidade da doença hepática.

Idosos

O perfil farmacocinético da loratadina e do seu metabolito ativo nos voluntários saudáveis adultos é comparável ao observado nos voluntários saudáveis geriátricos.

5.3 Dados de segurança pré-clínica

Os dados não clínicos não revelam riscos especiais para o ser humano, segundo estudos convencionais de segurança, farmacologia, toxicidade de dose repetida, genotoxicidade e potencial carcinogénico.

Não se observaram efeitos teratogénicos em estudos de toxicidade reprodutiva. Contudo, observou-se um prolongamento do tempo de parto e reduzida viabilidade da prole em ratos com níveis plasmáticos (AUC) 10 vezes superiores aos observados com doses clínicas.

6. INFORMAÇÕES FARMACÊUTICAS

6.1 Lista dos excipientes

Lactose mono-hidratada
Amido de milho
Estearato de magnésio

6.2 Incompatibilidades

Não aplicável.

6.3 Prazo de validade

36 meses

6.4 Precauções especiais de conservação

O medicamento não necessita de quaisquer precauções especiais de conservação.

6.5 Natureza e conteúdo do recipiente

Fita blister consistindo numa folha de alumínio de 20 µm com revestimento a quente de vinil e filme de cloreto de polivinil (PVC) transparente e limpo de 250 µm ou um filme de cloreto de polivinil (PVC) transparente e limpo de 250 com revestimento de cloreto de polivinilideno (PVdC).

Embalagens de 2, 5, 7, 10, 14, 15, 20, 21, 28, 30, 50, 60 ou 100 comprimidos.

É possível que não sejam comercializadas todas as apresentações.

6.6 Precauções especiais de eliminação e manuseamento

Qualquer medicamento não utilizado ou resíduos devem ser eliminados de acordo com as exigências locais.

7. TITULAR DA AUTORIZAÇÃO DE INTRODUÇÃO NO MERCADO

Bayer Portugal Lda.
Rua Quinta do Pinheiro, 5
2794-003 Carnaxide

8. NÚMERO(S) DA AUTORIZAÇÃO DE INTRODUÇÃO NO MERCADO

N.º de registo: 9702407 – 20 comprimidos, 10 mg, blister PVC/alumínio

9. DATA DA PRIMEIRA AUTORIZAÇÃO/RENOVAÇÃO DA AUTORIZAÇÃO DE INTRODUÇÃO NO MERCADO

Data da primeira autorização: 02 de fevereiro 1989
Data da última renovação: 25 de setembro de 2009

10. DATA DA REVISÃO DO TEXTO

05/2016