

Talerc

Aché Laboratórios Farmacêuticos S.A.
comprimido revestido
10 mg e 20 mg

BULA PARA PROFISSIONAL DE SAÚDE

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

I- IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO

TALERC

cloridrato de epinastina

APRESENTAÇÕES

Comprimido revestido de 10 mg: embalagens com 10 comprimidos.

Comprimido revestido de 20 mg: embalagem com 10 comprimidos.

USO ORAL

USO ADULTO E PEDIÁTRICO ACIMA DE 12 ANOS

COMPOSIÇÃO

Cada comprimido de TALERC 10 mg contém:

cloridrato de epinastina 10 mg

Excipientes: lactose monoidratada, amido, povidona, dióxido de silício, estearato de magnésio, hipromelose, eudragit, macrogol, talco, dióxido de titânio e sílica.

Cada comprimido de TALERC 20 mg contém:

cloridrato de epinastina 20 mg

Excipientes: lactose monoidratada, amido, povidona, dióxido de silício, estearato de magnésio, hipromelose, eudragit, macrogol, talco, dióxido de titânio e sílica.

II- INFORMAÇÕES TÉCNICAS AOS PROFISSIONAIS DE SAÚDE

1. INDICAÇÕES

Este medicamento é destinado à profilaxia e tratamento sintomático da rinite alérgica e de patologias dermatológicas alérgicas com prurido, tais como urticária e eczemas/dermatites.

2. RESULTADOS DE EFICÁCIA

No artigo de revisão de Keni Tasaka (2000), foi avaliada a eficácia da epinastina em paciente com eczema/dermatite (125 pacientes), prurigo (56) e prurido cutâneo (56) em um estudo simples-cego, multicêntrico, de 2 semanas. A porcentagem de pacientes que obtiveram resposta “significativa e moderada” foi de 71,3%, 63,3% e 75,5% nessas patologias, respectivamente. Sendo que os autores do estudo concluíram que a epinastina apresentava alta eficácia clínica sobre as diversas dermatites alérgicas.

Um estudo clínico que examinou o efeito inibitório da epinastina oral na reação de erupção cutânea com inchaço e vermelhidão induzida por histamina através de iontoforese verificou que a ação terapêutica desta droga apresentou eficácia terapêutica em duas horas e prolongou-se durante 24 horas. Ainda, a sensação de coceira induzida pela histamina foi completamente inibida após duas horas de tratamento.

Em um estudo que avaliou o efeito da epinastina no tratamento da rinite alérgica perene de 198 pacientes verificou-se que o tratamento foi capaz de abolir os sintomas da rinite alérgica após a primeira semana de tratamento.

Pacientes pediátricos acometidos por dermatite atópica tratados com epinastina na forma de xarope confirmaram que não ocorreu nenhuma reação adversa relacionada com a medicação após 12 semanas de tratamento e apresentaram abolição dos sintomas e manutenção da melhora após 4 semanas de tratamento.

A eficácia do tratamento com epinastina e sua segurança foi verificada também em 63 pacientes com alergia nasal decorrente do pólen. Neste estudo, o tratamento preventivo iniciou-se para um

primeiro grupo durante período de polinização e para um segundo grupo após o seu término e a intensidade dos sintomas da alergia nasal foi verificada. Como resultado, a intensidade dos sintomas foi leve durante o período de tratamento no grupo tratado durante o início do período de polinização quando comparado ao grupo tratado após este mesmo período. A intensidade da melhora dos sintomas foi de 70% no grupo tratado durante a polinização e 30% no segundo grupo. Apenas 1,59% dos pacientes apresentaram reações adversas, estabelecendo assim, a ótima tolerabilidade deste tratamento.

A eficácia e a segurança do tratamento com epinastina no combate da urticária crônica também foi extensivamente avaliado. De forma geral, estes estudos apresentam uma melhora significativa e acentuada nos sintomas de prurido e erupções. A porcentagem de pacientes que não apresentou nenhuma reação adversa relacionada ao tratamento durante este estudo foi entre 96,7% e 98,2%. Segundo os autores, o tratamento com epinastina apresentou um excelente efeito anti-prurítico. Ainda, é relatado na literatura que o tratamento com a epinastina é eficaz em combater os sintomas de Psoríase com prurido e erupções, rinite alérgica sazonal e perenal e asma brônquica.

Referências Bibliográficas:

Furue M., Terao H., Koga T. Effects of cetirizine and epinastine on the skin response to histamine iontophoresis. *Journal of dermatological science* 25, 59-63; 2001.

Borrego C.P., López-Pérez G., Monje S.J.J.L., Díaz G.S., Villarreal C.J., Arroyo D.C., Henkel D.R., Ayala S.C. Estudio comparativo de la eficacia y seguridad de epinastina versus loratadina en el tratamiento de pacientes con rinitis alérgica. *Alergia, asma e inmunologia pediátricas*. Vol 7, n° 3., mayo-junio 1998.

Harada S. Phase III open-labelled study of epinastine hydrochloride dry syrup in paediatric patients with atopic dermatitis. Evaluation of safety for 3 months of administration. *Journal of clinical therapeutics & Medicines*, vol 19, n° 11, pp 1307-1325; 2003.

Endo T., Moriyama H., Ymagaguchi N., Katayama N., Seki., Tetsuro., Saneyoshi K., Udagawa H. Clinical evaluation of efficacy of epinastine hydrochloride (Alesion) for initial treatment of cedar pollinosis: Comparison with administration after scattering of pollen. *Otorhinolaryngology* 38(6), 800-817, 1995.

Tasaka K. Epinastine: An update of its pharmacology, metabolism, clinical efficacy and tolerability in the treatment of allergic diseases. *Drugs of today*, 36(11): 735-757; 2000.

3. CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS

TALERC é um agente antialérgico. Apresenta atividade bloqueadora dos receptores H1, antagonizando assim os efeitos da histamina. Além disso, inibe a liberação de histamina e de SRS-A (substância de reação lenta da anafilaxia), um efeito antagonista sobre outros mediadores químicos, tais como leucotrienos C4, PAF (fator ativador de plaquetas) e serotonina. Os seus efeitos antiinflamatórios e antialérgicos foram claramente demonstrados em estudos pré-clínicos. A epinastina transpõe apenas em grau muito limitado a barreira hematoencefálica, sendo assim praticamente isenta de efeitos sobre o Sistema Nervoso Central. Demonstrou-se em estudos clínicos a utilidade de TALERC administrado por via oral em dose única diária na rinite alérgica e nas patologias dermatológicas pruriginosas.

Após administração oral, as concentrações plasmáticas máximas são obtidas após 1,7 a 3,2 horas. A meia-vida de eliminação plasmática é de 7 a 13 horas. A biodisponibilidade do cloridrato de epinastina após absorção pelo trato gastrointestinal é de 40% aproximadamente e dessa forma, não existe importante efeito de primeira passagem. Existe uma relação linear entre concentrações plasmáticas e doses administradas. Um estudo em voluntários sadios indicou que a absorção da epinastina pode diminuir cerca de 30 a 40% se administrada com alimento. A ligação com proteínas plasmáticas é de aproximadamente 64%.

Após administração oral de epinastina marcada radioativamente, 25% foram eliminados pela urina e 70% pelas fezes. A substância foi eliminada predominantemente na forma inalterada.

A parcela de metabólitos foi pequena. Além disso, em microsossomos hepáticos humanos produziu-se somente uma quantidade ínfima do metabólito (1-hidroxi epinastina). A depuração renal foi elevada, cerca de 520 ml/min.

Estudos pré-clínicos realizados com ratos demonstraram uma distribuição muito pequena no SNC e na barreira placentária. Contudo, a droga foi encontrada no leite materno.

Além das altas concentrações no trato gastrointestinal e nos principais órgãos de depuração, encontraram-se concentrações relativamente altas na hipófise, nas glândulas salivares, no pâncreas e na mucosa gastrointestinal.

4. CONTRAINDICAÇÕES

TALERC é contraindicado para uso por pacientes com hipersensibilidade conhecida à epinastina e/ou aos excipientes da sua fórmula.

Este medicamento é contraindicado para menores de 12 anos.

5. ADVERTÊNCIAS E PRECAUÇÕES

TALERC deve ser administrado com cautela em pacientes com distúrbios hepáticos ou histórico dos mesmos.

Em estudos específicos, TALERC usado nas doses recomendadas não prejudicou a capacidade de dirigir veículos. Mesmo assim, os pacientes devem ser advertidos para serem cautelosos quando forem dirigir veículos ou operar máquinas.

Categoria de risco na gravidez: C.

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

A segurança do uso de TALERC em gestantes não foi estabelecida. Por esse motivo, não se recomenda o uso do produto durante a gravidez. De acordo com dados pré-clínicos, TALERC passa para o leite materno, não devendo ser usado, assim, por mulheres que estejam amamentando.

6. INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não existem evidências suficientes na literatura de ocorrência de interações clinicamente relevantes entre os componentes do TALERC com outros medicamentos.

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 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.

TALERC comprimidos revestidos possui a forma redonda, biconvexa, de cor variando de branco a amarelo.

Antes de usar, observe o aspecto do medicamento.

Todo medicamento deve ser mantido fora do alcance das crianças.

8. POSOLOGIA E MODO DE USAR

A via de administração é oral.

Os comprimidos revestidos devem ser tomados com meio copo de água e não devem ser mastigados.

Patologias dermatológicas alérgicas:

Adultos: 20 mg, uma vez ao dia.

Rinite alérgica:

Acima de 12 anos e Adultos: 10 a 20 mg, uma vez ao dia. A dose deve ser ajustada individualmente, de acordo com a gravidade dos sintomas.

O limite máximo diário é de 40 mg.

Este medicamento não deve ser partido, aberto ou mastigado.

9. REAÇÕES ADVERSAS

A literatura cita as seguintes reações adversas, sem frequência conhecida:

SNC: tontura, sonolência, fadiga e cefaleia.

Pele e anexos: reações alérgicas (por exemplo, erupção cutânea, urticária, eritema), prurido, edema (face, membros, etc).

Trato gastrointestinal: desconforto gastrointestinal e sintomas relacionados, boca seca, estomatite.

Fígado: elevação dos testes de função hepática, icterícia. Casos isolados de hepatite e piora dos distúrbios hepáticos já existentes.

Trato urinário: sintomas similares à cistite incluindo polaciúria e hematúria.

Sistema cardiovascular: palpitação.

Em casos de eventos adversos, notifique ao Sistema de Notificações em Vigilância Sanitária- NOTIVISA, disponível em <http://www.anvisa.gov.br/hotsite/notivisa/index.htm>, ou para a Vigilância Sanitária Estadual ou Municipal.

10. SUPERDOSE

Como ocorre com outros antagonistas H1, não se pode excluir a possibilidade de uma superdose prolongar o intervalo QTc, com potencial subsequente para geração de arritmias.

Embora não se tenha relatado isto em associação com TALERC, deve-se instituir a monitorização por ECG em caso de superdosagem.

Em caso de superdose, a conduta a ser adotada é a lavagem gástrica e/ou diurese forçada, além de tratamento sintomático.

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

III- DIZERES LEGAIS

MS - 1.0573.0364

Farmacêutico Responsável: Gabriela Mallmann - CRF-SP nº 30.138

Aché Laboratórios Farmacêuticos S.A.

Via Dutra, km 222,2

Guarulhos – SP

CNPJ 60.659.463/0001-91

Indústria Brasileira

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

Esta bula foi aprovada pela Anvisa em 27/06/2014



Talerc

Aché Laboratórios Farmacêuticos S.A.

xarope

10 mg/5 ml

BULA PARA PROFISSIONAL DE SAÚDE

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

I- IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO**TALERC****cloridrato de epinastina****APRESENTAÇÕES**

Xarope 10 mg/5 ml: frasco com 50 ml + copo-medida

USO ORAL**USO ADULTO E PEDIÁTRICO ACIMA DE 6 ANOS****COMPOSIÇÃO**

Cada 5 ml de TALERC xarope contém:

cloridrato de epinastina..... 10 mg

Excipientes: glicirrizinato de amônio, fosfato de sódio monobásico di-hidratado, carmelose sódica, essência de cereja, essência de mentol, propilenoglicol, água purificada, sorbitol e hidróxido de sódio.

II- INFORMAÇÕES TÉCNICAS AOS PROFISSIONAIS DE SAÚDE**1. INDICAÇÕES**

Este medicamento é destinado à profilaxia e tratamento sintomático da rinite alérgica e de patologias dermatológicas alérgicas com prurido, tais como urticária e eczemas/dermatites.

2. RESULTADOS DE EFICÁCIA

No artigo de revisão de Keni Tasaka (2000), foi avaliada a eficácia da epinastina em paciente com eczema/dermatite (125 pacientes), prurigo (56) e prurido cutâneo (56) em um estudo simples-cego, multicêntrico, de 2 semanas. A porcentagem de pacientes que obtiveram resposta “significativa e moderada” foi de 71,3%, 63,3% e 75,5% nessas patologias, respectivamente. Sendo que os autores do estudo concluíram que a epinastina apresentava alta eficácia clínica sobre as diversas dermatites alérgicas.

Um estudo clínico que examinou o efeito inibitório da epinastina oral na reação de erupção cutânea com inchaço e vermelhidão induzida por histamina através de iontoforese verificou que a ação terapêutica desta droga apresentou eficácia terapêutica em duas horas e prolongou-se durante 24 horas. Ainda, a sensação de coceira induzida pela histamina foi completamente inibida após duas horas de tratamento.

Em um estudo que avaliou o efeito da epinastina no tratamento da rinite alérgica perene de 198 pacientes verificou-se que o tratamento foi capaz de abolir os sintomas da rinite alérgica após a primeira semana de tratamento.

Pacientes pediátricos acometidos por dermatite atópica tratados com epinastina na forma de xarope confirmaram que não ocorreu nenhuma reação adversa relacionada com a medicação após 12 semanas de tratamento e apresentaram abolição dos sintomas e manutenção da melhora após 4 semanas de tratamento.

A eficácia do tratamento com epinastina e sua segurança foi verificada também em 63 pacientes com alergia nasal decorrente do pólen. Neste estudo, o tratamento preventivo iniciou-se em um primeiro grupo durante período de polinização e um segundo grupo após o seu término e a intensidade dos sintomas da alergia nasal foi verificada. Como resultado, a intensidade dos sintomas foi leve durante o período de tratamento no grupo tratado durante o início do período de polinização quando comparado ao grupo tratado após este mesmo período. A intensidade da melhora dos sintomas foi de 70% no grupo tratado durante a polinização e 30% no segundo grupo. Apenas 1,59% dos pacientes apresentaram reações adversas, estabelecendo assim, a ótima tolerabilidade deste tratamento.

A eficácia e a segurança do tratamento com epinastina no combate da urticária crônica também foi extensivamente avaliado. De forma geral, estes estudos apresentam uma melhora significativa e acentuada nos sintomas de prurido e erupções. A porcentagem de pacientes que não apresentou nenhuma reação adversa relacionada ao tratamento durante este estudo foi entre 96,7% e 98,2%. Segundo os autores, o tratamento com epinastina apresentou um excelente efeito anti-prurítico. Ainda, é relatado na literatura que o tratamento com a epinastina é eficaz em combater os sintomas de Psoríase com prurido e erupções, rinite alérgica sazonal e perenal e asma brônquica.

Referências Bibliográficas:

- Furue M., Terao H., Koga T. Effects of cetirizine and epinastine on the skin response to histamine iontophoresis. *Journal of dermatological science* 25, 59-63; 2001.
- Borrego C.P., López-Pérez G., Monje S.J.J.L., Díaz G.S., Villarreal C.J., Arroyo D.C., Henkel D.R., Ayala S.C. Estudio comparativo de la eficacia y seguridad de epinastina versus loratadina en el tratamiento de pacientes con rinitis alérgica. *Alergia, asma e inmunologia pediátricas*. Vol 7, n° 3., mayo-junio 1998.
- Harada S. Phase III open-labelled study of epinastine hydrochloride dry syrup in paediatric patients with atopic dermatitis. Evaluation of safety for 3 months of administration. *Journal of clinical therapeutics & Medicines*, vol 19, n° 11, pp 1307-1325; 2003.
- Endo T., Moriyama H., Ymagaguchi N., Katayama N., Seki., Tetsuro., Saneyoshi K., Udagawa H. Clinical evaluation of efficacy of epinastine hydrochloride (Alesion) for initial treatment of cedar pollinosis: Comparison with administration after scattering of pollen. *Otorhinolaryngology* 38(6), 800-817, 1995.
- Tasaka K. Epinastine: An update of its pharmacology, metabolism, clinical efficacy and tolerability in the treatment of allergic diseases. *Drugs of today*, 36(11): 735-757: 2000.

3. CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS

TALERC é um agente antialérgico. Apresenta atividade bloqueadora dos receptores H1, antagonizando assim os efeitos da histamina. Além disso, inibe a liberação de histamina e de SRS-A (substância de reação lenta da anafilaxia), um efeito antagonista sobre outros mediadores químicos, tais como leucotrienos C4, PAF (fator ativador de plaquetas) e serotonina. Os seus efeitos antiinflamatórios e antialérgicos foram claramente demonstrados em estudos pré-clínicos. A epinastina transpõe apenas em grau muito limitado a barreira hematoencefálica, sendo assim praticamente isenta de efeitos sobre o Sistema Nervoso Central. Demonstrou-se em estudos clínicos a utilidade de TALERC administrado por via oral em dose única diária na rinite alérgica e nas patologias dermatológicas pruriginosas.

Após administração oral, as concentrações plasmáticas máximas são obtidas após 1,7 a 3,2 horas. A meia-vida de eliminação plasmática é de 7 a 13 horas. A biodisponibilidade do cloridrato de epinastina após absorção pelo trato gastrointestinal é de 40% aproximadamente e dessa forma, não existe importante efeito de primeira passagem. Existe uma relação linear entre concentrações plasmáticas e doses administradas. Um estudo em voluntários sadios indicou que a absorção da epinastina pode diminuir cerca de 30 a 40% se administrada com alimento. A ligação com proteínas plasmáticas é de aproximadamente 64%.

Após administração oral de epinastina marcada radioativamente, 25% foram eliminados pela urina e 70% pelas fezes. A substância foi eliminada predominantemente na forma inalterada.

A parcela de metabólitos foi pequena. Além disso, em microsomos hepáticos humanos produziu-se somente uma quantidade ínfima do metabólito (1-hidroxi epinastina). A depuração renal foi elevada, cerca de 520 ml/min.

Estudos pré-clínicos realizados com ratos demonstraram uma distribuição muito pequena no SNC e na barreira placentária. Contudo, a droga foi encontrada no leite materno.

Além das altas concentrações no trato gastrointestinal e nos principais órgãos de depuração, encontraram-se concentrações relativamente altas na hipófise, nas glândulas salivares, no pâncreas e na mucosa gastrointestinal.

4. CONTRAINDICAÇÕES

TALERC é contraindicado para uso por pacientes com hipersensibilidade conhecida à epinastina e/ou aos excipientes da sua fórmula.

Este medicamento é contraindicado para menores de 6 anos.

5. ADVERTÊNCIAS E PRECAUÇÕES

TALERC deve ser administrado com cautela em pacientes com distúrbios hepáticos ou histórico dos mesmos.

Em estudos específicos, TALERC usado nas doses recomendadas não prejudicou a capacidade de dirigir veículos. No entanto, os pacientes devem ser advertidos para serem cautelosos ao dirigir veículos ou operar máquinas.

Categoria de risco na gravidez: C.

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

A segurança do uso de TALERC em gestantes não foi estabelecida. Por esse motivo, não se recomenda o uso do produto durante a gravidez. De acordo com dados pré-clínicos, TALERC passa para o leite materno, não devendo ser usado, assim, por mulheres que estejam amamentando.

6. INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não existem evidências suficientes na literatura de ocorrência de interações clinicamente relevantes entre os componentes do TALERC com outros medicamentos.

Evite a ingestão de bebida alcoólica durante o tratamento.

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 18 meses a contar 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.

TALERC xarope apresenta-se na forma de líquido levemente viscoso, incolor a levemente amarelado com odor característico de cereja.

Antes de usar, observe o aspecto do medicamento.

Todo medicamento deve ser mantido fora do alcance das crianças.

8. POSOLOGIA E MODO DE USAR

A via de administração é oral.

Rinite alérgica:

Crianças de 6 a 12 anos: 5 a 10 mg (2,5 ml a 5 ml), uma vez ao dia.

Acima de 12 anos e Adultos: 10 a 20 mg (5 ml a 10 ml), uma vez ao dia. A dose deve ser ajustada individualmente, de acordo com a gravidade dos sintomas.

Patologias dermatológicas alérgicas:

Adultos: 20 mg (10 ml), uma vez ao dia.

O limite máximo diário é de 40 mg.

9. REAÇÕES ADVERSAS

A literatura cita as seguintes reações adversas, sem frequência conhecida:

SNC: tontura, sonolência, fadiga e cefaléia.

Pele e anexos: reações alérgicas (por exemplo, erupção cutânea, urticária, eritema), prurido, edema (face, membros, etc).

Trato gastrointestinal: desconforto gastrointestinal e sintomas relacionados, boca seca, estomatite.

Fígado: elevação dos testes de função hepática, icterícia. Casos isolados de hepatite e piora dos distúrbios hepáticos já existentes.

Trato urinário: sintomas similares à cistite incluindo polaciúria e hematúria.

Sistema cardiovascular: palpitação.

Em casos de eventos adversos, notifique ao Sistema de Notificações em Vigilância Sanitária-NOTIVISA, disponível em <http://www.anvisa.gov.br/hotsite/notivisa/index.htm>, ou para a Vigilância Sanitária Estadual ou Municipal.

10. SUPERDOSE

Como ocorre com outros antagonistas H1, não se pode excluir a possibilidade de uma superdose prolongar o intervalo QTc, com potencial subsequente para geração de arritmias.

Embora não se tenha relatado isto em associação com TALERC, deve-se instituir a monitorização por ECG em caso de superdosagem.

Em caso de superdose, a conduta a ser adotada é a lavagem gástrica e/ou diurese forçada, além de tratamento sintomático.

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

III- DIZERES LEGAIS

MS - 1.0573.0364

Farmacêutica Responsável: Gabriela Mallmann - CRF-SP 30.138

Aché Laboratórios Farmacêuticos S.A.

Via Dutra, km 222,2

Guarulhos – SP

CNPJ 60.659.463/0001-91

Indústria Brasileira

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

Esta bula foi aprovada pela Anvisa em 27/06/2014

