

ACTIFEDRIN®

Farmoquímica S/A

Comprimido / Xarope

2,5 mg + 60 mg / 0,25 mg/mL + 6 mg/mL

ACTIFEDRIN®

cloridrato de triprolidina + cloridrato de pseudoefedrina

APRESENTAÇÕES:

Comprimido – cloridrato de triprolidina 2,5 mg + cloridrato de pseudoefedrina 60 mg - embalagem contendo blíster com 20 comprimidos.

Xarope – cloridrato de triprolidina 0,25 mg/mL + cloridrato de pseudoefedrina 6 mg/mL - embalagem contendo frasco com 100 mL. Contém um copo dosador

VIA ORAL

USO ADULTO E PEDIÁTRICO ACIMA DE 12 ANOS (comprimido)

USO ADULTO E PEDIÁTRICO ACIMA DE 2 ANOS (xarope)

COMPOSIÇÃO:

Cada comprimido contém:

cloridrato de triprolidina 2,5 mg

cloridrato de pseudoefedrina..... 60 mg

Excipientes: lactose monoidratada, amido, estearato de magnésio, povidona e água.

Cada mL do xarope contém:

cloridrato de triprolidina 0,25 mg

cloridrato de pseudoefedrina..... 6 mg

Excipientes: sacarose, sorbitol, metilparabeno, benzoato de sódio, corante amarelo quinoleína, hidróxido de sódio e água.

INFORMAÇÕES TÉCNICAS AOS PROFISSIONAIS DE SAÚDE:**1. INDICAÇÕES**

Actifedrin® é indicado no alívio sintomático das rinites.

2. RESULTADOS DE EFICÁCIA

Num estudo duplo-cego, randomizado e controlado por placebo, em que participaram 466 indivíduos, foi testada a eficácia da triprolidina e a pseudoefedrina, isoladamente ou em combinação, no alívio dos sintomas do resfriado comum. Durante o estudo, 199 sujeitos relataram um total de duzentos e quarenta e três episódios de resfriado. Os sujeitos foram orientados a registrar a gravidade de doze sintomas associados ao resfriado durante o tratamento e, separadamente, a gravidade de sete sintomas que representavam efeitos indesejáveis do tratamento ou serviriam como um índice de sugestibilidade. Os

pacientes foram solicitados a avaliar globalmente a melhora dos sintomas durante o tratamento e a responder se eles imaginavam ter tomado placebo. O estudo mostrou que uma maioria significativa de indivíduos se beneficiou do tratamento com pseudoefedrina e com a combinação pseudoefedrina mais triprolidina, e quase a metade não se beneficiou com o uso do triprolidina isoladamente, embora isto não tivesse atingido o nível de significância ($p < 0,01$) requerido para dados subjetivos. ⁽¹⁾

Um estudo duplo-cego, paralelo, controlado por placebo, foi realizado com 151 pacientes para avaliar a eficácia da combinação triprolidina mais pseudoefedrina no tratamento de rinites alérgicas. A rinite alérgica foi definida com base na congestão nasal coexistente e escores de um agregado complexo de sintomas, como: espirros, rinorreia, lacrimejamento, prurido nos olhos, nariz e garganta. Os resultados mostraram que a combinação triprolidina mais pseudoefedrina foi mais eficaz do que cada droga usada isoladamente no alívio dos sintomas de rinite alérgica sazonal. ⁽²⁾

A capacidade da triprolidina 2,5 mg e pseudoefedrina 60 mg, isoladamente e em combinação, para proteção contra um aumento na resistência da via aérea nasal (NAR) após provocação com histamina foi determinada em dezoito indivíduos com alergia a pólen de gramínea. O estudo foi conduzido fora da estação de polinização usando um desenho duplo-cego, placebo controlado e cruzado. A administração prévia de pseudoefedrina 60 mg e triprolidina 2,5 mg, isoladamente ou em combinação, foi superior ao placebo na redução do aumento na NAR após teste de provocação nasal com histamina a 1 %. Contudo, as medidas da NAR com pseudoefedrina 60 mg mais triprolidina 2,5 mg não se diferenciaram daquelas com pseudoefedrina e triprolidina, usadas isoladamente. ⁽³⁾

1 – Bye CE, Cooper J, Empey DW, Fowle ASE, Hughes DTD, Letley E and O'Grady J. Effects of pseudoephedrine and triprolidina, alone and in combination, on symptoms of common cold. *British Medical Journal*, 1980 19 July; 281(6234):189-90.

2 – Diamond L, Gerson K, Cato A, Peace K and Perkins G. An evaluation of triprolidina and pseudoephedrine in the treatment of allergic rhinitis. *Annals of Allergy*, 1981 August;47:87-91.

3 – Empey DW, Frosolono MF, Hughes DTD e Perkins JG. Comparison of pseudoephedrine and triprolidina, alone and in combination in preventing nasal congestion in subjects with allergic rhinitis using nasal histamine challenge. *Br. J. clin. Pharmacol.* 1984;18:86-89.

3. CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS

FARMACODINÂMICA

A triprolidina é um anti-histamínico antagonista H1, membro da classe química dos derivados da propilamina (alquilamina). Como tal, é considerado relativamente menos sedativo do que os anti-histamínicos tradicionais das classes dos derivados da etanolamina, fenotiazina e etilenodiamina. Acredita-se que o mecanismo de ação da triprolidina, como o de todos os anti-histamínicos, envolva o

bloqueio competitivo dos sítios receptores H1, impedindo que a histamina se combine com estes sítios receptores e exerça seus efeitos usuais nas células-alvo.

A pseudoefedrina (um estereoisômero da efedrina) é um agente simpaticomimético que estimula diretamente os receptores alfa-adrenérgicos da mucosa respiratória, causando vasoconstrição, e os beta-adrenérgicos, causando relaxamento brônquico e aumento na frequência e contractilidade cardíaca. Por suas características farmacológicas, tem sido usada com maior frequência em preparações orais para alívio da congestão nasal.

Após a administração de uma dose de Actifedrin®, o tempo estimado para início da ação terapêutica é de uma a duas horas.

FARMACOCINÉTICA

cloridrato de triprolidina

- Absorção

Quando administrada por via oral, a triprolidina é rapidamente absorvida no trato gastrointestinal.

Tempo para concentração sérica máxima: aproximadamente duas horas.

- Metabolismo

Extensivamente metabolizada no fígado.

Um derivado carboxilado é responsável por cerca da metade da dose excretada na urina.

- Excreção

Urina (aproximadamente 1% na forma inalterada).

Meia-vida de eliminação: aproximadamente duas horas.

cloridrato de pseudoefedrina

- Absorção

Quando administrada por via oral, a pseudoefedrina é rapidamente absorvida.

Tempo para concentração sérica máxima:

- crianças: aproximadamente duas horas;

- adultos: uma a três horas (dose dependente).

- Distribuição

- Crianças: aproximadamente 2,5 L/kg.

- Adultos: 2,64-3,51 L/kg.

- Metabolismo

Hepático (<1%).

Sofre n-demetilação a norpseudoefedrina (ativo).

- Excreção

Urina (43% a 96% como droga não modificada e 1% a 6% como norpseudoefedrina).

Excreção dependente do pH e da taxa de fluxo urinário. A urina alcalina diminui a eliminação da pseudoefedrina. Assim, a meia-vida de eliminação pode variar da seguinte forma:

- crianças: aproximadamente três horas (pH da urina ~6,5);
- adultos: nove a dezesseis horas (pH da urina 8); três a seis horas (pH 5).

4. CONTRAINDICAÇÕES

- Pacientes com hipertensão arterial ou doença arterial coronariana.
- Pacientes que estejam tomando ou que tenham tomado antidepressivos nas duas semanas precedentes.
- Pacientes em tratamento com medicamentos a base de furazolidona.
- Gravidez.
- Lactação.
- Hipersensibilidade a algum componente da fórmula.

Categoria X de risco na gravidez: Em estudos em animais e mulheres grávidas, o fármaco provocou anomalias fetais, havendo clara evidência de risco para o feto que é maior do que qualquer benefício possível para a paciente.

Este medicamento não deve ser utilizado por mulheres grávidas ou que possam ficar grávidas durante o tratamento.

Este medicamento é contraindicado para uso por lactantes.

Este medicamento (comprimido) é contraindicado para menores de 12 anos.

Este medicamento (xarope) é contraindicado para menores de 2 anos.

5. ADVERTÊNCIAS E PRECAUÇÕES

- Actifedrin[®] pode causar sonolência e comprometer o desempenho em testes de vigilância auditiva.
- Actifedrin[®] deve ser usado com cuidado em pacientes com hipertensão, doença cardíaca, diabetes, hipertireoidismo, glaucoma ou hipertrofia da próstata.
- Deve-se tomar cuidado quando houver a presença de insuficiência renal ou hepática grave.

Idosos

Não existem estudos específicos com Actifedrin[®] em pacientes idosos. Contudo, a experiência indica que a dose preconizada para adultos mais jovens é apropriada também para idosos. Recomenda-se controlar a função renal e/ou hepática e adotar precaução no caso de insuficiência grave destas funções.

Efeitos sobre a capacidade de dirigir veículos e operar máquinas

Não se deve dirigir automóveis ou operar máquinas até que sejam determinadas as respostas ao medicamento.

Atenção: Este medicamento (xarope) contém açúcar, portanto, deve ser usado com cautela em portadores de Diabetes.

Este medicamento pode causar doping.

6. INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

- O uso concomitante de Actifedrin[®] com outros descongestionantes, moderadores do apetite e estimulantes psíquicos do tipo anfetamina pode, ocasionalmente, causar uma elevação na pressão arterial.
- Actifedrin[®] pode alterar a ação de alguns medicamentos anti-hipertensivos que contêm bretílio, betanidina, guanetidina, debrisoquina, metildopa e os alfa e betabloqueadores.
- O uso concomitante de Actifedrin[®] com álcool ou outros sedativos deve ser evitado.

7. CUIDADOS DE ARMAZENAMENTO DO MEDICAMENTO

Cuidados de conservação

Actifedrin[®] deve ser conservado em temperatura ambiente (entre 15°C e 30°C), em sua embalagem original.

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

- Comprimido: comprimidos circulares, praticamente brancos, biconvexos, sulcados em uma das faces. Livre de partículas estranhas. Odor característico.
- Xarope: líquido límpido, amarelo. Livre de partículas estranhas. Odor e sabor característicos.

Antes de usar, observe o aspecto do medicamento.

Todo medicamento deve ser mantido fora do alcance das crianças.

8. POSOLOGIA E MODO DE USAR

COMPRIMIDO

Adultos e crianças acima de 12 anos de idade devem tomar um comprimido, via oral, três a quatro vezes ao dia.

Este medicamento deve ser usado em estados agudos e, no máximo, por três a cinco dias.

XAROPE

- Adultos e crianças acima de 12 anos de idade: tomar 10 mL de xarope, via oral, três a quatro vezes ao dia.
- Crianças entre 6 e 12 anos de idade: tomar 5 mL de xarope, via oral, três a quatro vezes ao dia.
- Crianças entre 2 e 5 anos de idade: tomar 2,5 mL de xarope, via oral, três a quatro vezes ao dia.

Este medicamento deve ser usado em estados agudos e, no máximo, por três a cinco dias.

9. REAÇÕES ADVERSAS

As seguintes reações adversas, listadas por sistema corporal, foram associadas ao tratamento com Actifedrin®, mas a frequência destas não pôde ser estabelecida:

- cardiovascular: taquicardia ou ritmo cardíaco irregular, elevação da pressão arterial;
- sistema nervoso central: sonolência, tontura, fadiga, cefaleia, insônia, nervosismo, estimulação transitória, zumbido nos ouvidos, ansiedade, visão borrada, tremores, convulsões;
- gastrointestinal: dor abdominal, aumento do apetite, constipação, náusea, ganho de peso, xerostomia, sensação de secura na garganta;
- geniturinário: disúria, retenção urinária;
- neuromuscular e esquelético: artralgia, fraqueza;
- respiratório: faringite, espessamento das secreções brônquicas, sensação de falta de ar;
- outras: diaforese, equimoses ou sangramento fácil.

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

10. SUPERDOSE

Em casos de superdosagem podem ocorrer sintomas como sonolência, perda temporária e completa da sensibilidade e do movimento, tontura, fraqueza, falta de ar passageira, ressecamento da pele e mucosas, taquicardia, pressão alta, irritabilidade, convulsões e dificuldade de micção. Nestes casos, o paciente deve ser imediatamente encaminhado ao um serviço médico de emergência, onde receberá a assistência adequada.

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

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA

MS: 1.0390.0155

Farm. Resp:

Dra. Marcia Weiss I. Campos

CRF-RJ nº 4499

Registrado por:

FARMOQUÍMICA S/A

Av. José Silva de Azevedo Neto, 200, Bloco 1,

1º andar, salas 101 a 104 e 106 a 108.

Rio de Janeiro – RJ

CNPJ: 33.349.473/0001-58



Fabricado por:

FARMOQUÍMICA S/A

Rua Viúva Cláudio, 300

Rio de Janeiro - RJ

CNPJ: 33.349.473/0003-10

Indústria brasileira



Esta bula foi aprovada pela ANVISA em 30/04/2015.



Anexo B
Histórico de Alteração da Bula

Dados da submissão eletrônica			Dados da petição/notificação que altera bula				Dados das alterações de bulas		
Data do expediente	No. expediente	Assunto	Data do expediente	Nº do expediente	Assunto	Data de aprovação	Itens de bula	Versões (VP/VPS)	Apresentações relacionadas
30/06/2014	0512118/14-3	(10458) – Medicamento Novo – Inclusão Inicial de Texto de Bula – RDC 60/12	30/06/2014	0512118/14-3	(10458) – Medicamento Novo – Inclusão Inicial de Texto de Bula – RDC 60/12	-	Adequação à RDC 47/2009	VP e VPS	- 2,5 MG + 60 MG COM CT BL AL PLAS INC X 20 - 6 MG/ML + 0,25 MG/ML XPE CT FR VD AMB X 100 ML
03/10/2014	0884323/14-6	(10451) – Medicamento Novo – Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	03/10/2014	0884323/14-6	(10451) – Medicamento Novo – Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	-	Revisão da área médica	VP e VPS	- 2,5 MG + 60 MG COM CT BL AL PLAS INC X 20 - 6 MG/ML + 0,25 MG/ML XPE CT FR VD AMB X 100 ML
30/04/2015	-	(10451) – Medicamento Novo – Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	30/04/2015	-	(10451) – Medicamento Novo – Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	-	Inclusão de apresentação	VP e VPS	6 MG/ML + 0,25 MG/ML XPE CT FR VD AMB X 100 ML + COP