

IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO:**HYPERIUM® 1mg**

rilmenidina 1mg

APRESENTAÇÕES:

Embalagem contendo 15 ou 30 comprimidos de 1mg.

USO ORAL**USO ADULTO ACIMA DE 18 ANOS****COMPOSIÇÃO:**

Cada comprimido de HYPERIUM® (rilmenidina) contém:

dihidrogenofosfato de rilmenidina (DCB 07726).....1,544 mg

correspondente a 1mg de rilmenidina base (DCB 07725)

excipientes q.s.p 1 comprimido

Excipientes: lactose monoidratada, celulose microcristalina, parafina, amidoglicolato de sódio, dióxido de silício, estearato de magnésio, talco, cera branca de abelha, cloreto de metileno.

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

HYPERIUM® (rilmenidina) é indicado para o tratamento da hipertensão arterial.

2. RESULTADOS DE EFICÁCIA

Os benefícios clínicos da rilmenidina no tratamento da hipertensão arterial foram demonstrados através de vários estudos clínicos, desde o lançamento do produto no mercado.

A eficácia e tolerância de HYPERIUM® (rilmenidina) foram avaliadas em estudo de 13 semanas em comparação com metildopa em pacientes com hipertensão leve à moderada. A avaliação foi realizada em monoterapia, e em casos onde a pressão arterial diastólica ultrapassava 90 mmHg era introduzida associação com hidroclorotiazida. Efeitos adversos foram significativamente de menor frequência no grupo tratado com HYPERIUM® (rilmenidina). Neste estudo HYPERIUM® (rilmenidina) levou a um controle efetivo da pressão arterial com uma prevalência muito baixa de efeitos adversos.

Referência Bibliográfica: UK Working Party on Rilmenidina: Rilmenidine in mild to moderate essential hypertension. Current Therapeutic Research. Vol. 47 N° 1, January 1990.

3. CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS**Propriedades Farmacodinâmicas:**

HYPERIUM® (rilmenidina), um composto oxazolinico com propriedades anti-hipertensivas age nas estruturas vasomotoras medulares e periféricas. HYPERIUM® (rilmenidina) possui uma maior seletividade aos receptores imidazolinicos I₁ do que aos receptores cerebrais alfa-2-adrenérgicos, distinguindo-se dos agonistas alfa-2 de referência.

HYPERIUM® (rilmenidina) exerce uma ação anti-hipertensiva dose-dependente, no rato geneticamente hipertenso, que não está associada aos efeitos neurofarmacológicos centrais habitualmente observados nos tratamentos com os agonistas alfa-2, exceto quando em doses superiores à dose anti-hipertensiva nos animais. O efeito sedativo central é notadamente de menor intensidade. Esta dissociação entre a atividade anti-hipertensiva e os efeitos neurofarmacológicos foi confirmada no homem.

HYPERIUM® (rilmenidina) exerce uma atividade anti-hipertensiva dose-dependente sobre a pressão arterial sistólica e diastólica com o paciente na posição deitada ou de pé. Em doses terapêuticas, 1 mg por dia em uma única tomada ou

2 mg por dia em duas tomadas, os estudos duplo-cego versus placebo e produto referência demonstraram a eficácia anti-hipertensiva de HYPERIUM® (rilmenidina) na hipertensão arterial leve ou moderada. Esta eficácia é mantida por um período de 24 horas e durante o esforço. Os resultados foram confirmados em longo prazo sem o desenvolvimento de tolerância.

Na dose de 1 mg por dia, os estudos duplo-cego versus placebo demonstraram que HYPERIUM® (rilmenidina) não modifica os testes de vigilância; a incidência dos efeitos colaterais (sonolência, secura da boca, constipação) não difere dos efeitos do placebo.

Na dose de 2 mg por dia, os estudos duplo-cego versus agonista alfa-2 de referência administrado na dose equi-hipotensiva demonstraram que a incidência dos efeitos colaterais é significativamente inferior em intensidade e em frequência com HYPERIUM® (rilmenidina)

HYPERIUM® (rilmenidina), em doses terapêuticas, respeita a função cardíaca, não provoca retenção hidrosódica e não altera o equilíbrio metabólico, além disso:

- mantém uma atividade anti-hipertensiva significativa 24 horas após sua administração, com redução da resistência periférica total, sem variação do débito cardíaco. Os índices de contratilidade e a eletrofisiologia cardíaca não são alterados;
- respeita a adaptação ao ortostatismo, em particular no idoso, e a adaptação fisiológica da frequência cardíaca ao esforço;
- não induz nenhuma variação do débito sanguíneo renal, da filtração glomerular ou da fração de filtração e não modifica a função renal;
- respeita a glicorregulação, inclusive no paciente diabético insulino-dependente ou não, e não modifica os parâmetros do metabolismo lipídico.

Propriedades Farmacocinéticas:

Absorção:

A absorção da rilmenidina é rápida. A concentração plasmática máxima, de 3,5 ng/mL, é atingida 1,5 a 2 horas após a absorção de uma dose única de 1 mg de HYPERIUM® (rilmenidina). A biodisponibilidade absoluta é de 100%, sem efeito de primeira passagem hepática. As variações interindividuais são pequenas e a ingestão concomitante de alimentos não modifica a biodisponibilidade. A taxa de absorção não varia nas doses terapêuticas recomendadas.

Distribuição:

A ligação às proteínas plasmáticas é inferior a 10% e o volume de distribuição é de 5 L/kg.

Eliminação:

HYPERIUM® (rilmenidina) é fracamente biotransformado. Os metabólitos são detectados sob a forma de traços na urina e são resultado da hidrólise do anel oxazolinico ou de sua oxidação. Estes metabólitos não possuem atividade agonista alfa-2. HYPERIUM® (rilmenidina) é eliminado essencialmente por via renal: 65% da dose administrada é excretada sob a forma inalterada na urina. O clearance renal representa 2/3 do clearance total. A meia-vida de eliminação é de 8 horas e não é modificada pela dose administrada e nem pela administração repetida. A duração da ação farmacológica é longa, a atividade anti-hipertensiva se mantém de forma significativa por 24 horas após a última tomada, no hipertenso tratado com a dose de 1 mg por dia.

Administração repetida:

Na administração repetida, o estado de equilíbrio é atingido desde o terceiro dia. Estudo dos níveis plasmáticos durante 10 dias demonstrou sua estabilidade. O monitoramento em longo prazo das taxas plasmáticas no paciente hipertenso (tratamento durante 2 anos) demonstrou que as concentrações plasmáticas de HYPERIUM® (rilmenidina) permaneceram estáveis.

Pacientes idosos:

Estudos de farmacocinética nos pacientes idosos, com mais de 70 anos, mostram uma meia-vida de eliminação de 12 horas.

Pacientes com insuficiência hepática:

Nos pacientes com insuficiência hepática, a meia-vida de eliminação é de 11 horas.

Pacientes com insuficiência renal:

Nos pacientes com insuficiência renal, tendo em vista a eliminação essencialmente renal do HYPERIUM® (rilmenidina), uma redução da eliminação é observada, proporcionalmente à gravidade da insuficiência renal. Nos

pacientes portadores de uma insuficiência renal grave (clearance da creatinina inferior a 15 mL/min), a meia-vida de eliminação é de aproximadamente 35 horas.

4. CONTRAINDICAÇÕES

HYPERIUM® (rilmenidina) é contraindicado nos seguintes casos:

- hipersensibilidade a qualquer um dos componentes da fórmula;
- estados depressivos graves;
- insuficiência renal grave (clearance da creatinina < 15 mL/min), por precaução, na ausência de estudos atualmente disponíveis.

Este medicamento é contraindicado para uso em crianças.

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

Devido à presença da lactose, este medicamento é contraindicado em casos de galactosemia, síndrome de má absorção de glicose e galactose ou deficiência de lactase.

5. ADVERTÊNCIAS E PRECAUÇÕES

ADVERTÊNCIAS:

Como para todos os anti-hipertensivos, nos pacientes portadores de antecedentes vasculares recentes (AVC, infarto do miocárdio), a administração de HYPERIUM® (rilmenidina) deverá ser feita com acompanhamento médico permanente.

Nos pacientes portadores de insuficiência renal, se o clearance da creatinina for superior a 15 mL/min, nenhuma modificação posológica se faz necessária.

Não interromper bruscamente o tratamento. Diminuir progressivamente a posologia.

PRECAUÇÕES:

Pacientes idosos:

HYPERIUM® (rilmenidina) pode ser administrado no paciente hipertenso idoso.

Efeitos na capacidade de dirigir veículos e operar máquinas:

Os estudos duplo-cego versus placebo não demonstraram qualquer efeito de HYPERIUM® (rilmenidina) sobre a vigilância em doses terapêuticas (1 ou 2 tomadas diárias de 1 mg). No caso de ultrapassar estas doses ou de associação com medicamentos susceptíveis de diminuir a vigilância, é conveniente advertir aos motoristas e aos operadores de máquinas sobre a possibilidade de sonolência.

Gravidez :

Como para qualquer nova molécula, a administração de HYPERIUM® (rilmenidina) deve ser evitada na gestação, embora nenhum efeito teratogênico ou embriotóxico tenha sido observado em estudos com animais.

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

Lactação:

HYPERIUM® (rilmenidina) é excretado no leite, portanto a sua administração é desaconselhada durante o período de amamentação.

Este medicamento é contraindicado para uso em crianças.

Devido a presença da lactose, este medicamento é contraindicado em casos de galactosemia, síndrome de má absorção de glicose e galactose ou deficiência de lactase.

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

6. INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Associações desaconselhadas:

A associação aos IMAO é desaconselhada; a associação aos antidepressivos tricíclicos deve ser considerada com cautela, pois a atividade anti-hipertensiva de HYPERIUM® poderá ser parcialmente antagonizada. O consumo de álcool durante o tratamento é desaconselhado.

Associações possíveis:

A ausência de interação com outros medicamentos permite a prescrição de HYPERIUM® simultaneamente com: antidiabéticos orais, insulina, hipouricemiantes, hipolipemiantes, digoxina, antiarrítmicos, anticoagulantes, analgésicos, anti-inflamatórios, outros anti-hipertensivos (em particular os diuréticos e a dihidralazina, mas também beta-bloqueadores, antagonistas do cálcio, inibidores da enzima de conversão).

7. CUIDADOS DE ARMAZENAMENTO DO MEDICAMENTO

HYPERIUM® (rilmenidina) deve ser guardado na sua embalagem original, em temperatura ambiente (entre 15 e 30°C), protegido da luz e umidade. Nestas condições, este medicamento possui prazo de validade de 24 (vinte e quatro) meses, a partir da data de fabricação.

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

Não use medicamento com o prazo de validade vencido.

Para sua segurança, mantenha o medicamento na embalagem original.

CARACTERÍSTICAS FÍSICAS E ORGANOLÉPTICAS:

HYPERIUM® (rilmenidina) é apresentado sob a forma de comprimidos brancos redondos e biconvexos, apresentando a gravação “H” em ambas as faces. Não apresenta nenhum odor característico.

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 posologia recomendada é de 1 comprimido por dia em uma única tomada pela manhã.

No caso de resultados insatisfatórios após um mês de tratamento, a posologia poderá ser aumentada para 2 comprimidos por dia, em duas tomadas (1 comprimido pela manhã e outro à noite), antes das refeições.

Pela sua boa aceitabilidade clínica e biológica, HYPERIUM® (rilmenidina) pode ser administrado no paciente hipertenso idoso. No paciente portador de insuficiência renal, se o clearance da creatinina for superior a 15 mL/min, nenhuma modificação posológica é necessária, a princípio. O tratamento pode ser mantido indefinidamente.

9. REAÇÕES ADVERSAS

Na dose de 1 mg em uma tomada diária, no decorrer dos estudos controlados, a incidência das reações adversas é comparável às observadas com o placebo. Na dose de 2 mg por dia, os estudos controlados comparativos versus clonidina na dose de 0,15 a 0,30 mg / dia ou alfa-metildopa na dose de 500 a 1000 mg / dia, demonstraram que a incidência das reações adversas com o uso de HYPERIUM® (rilmenidina) foi significativamente inferior àquelas observadas com o uso da clonidina ou da alfa-metildopa. As reações adversas são raras, benignas e transitórias nas doses terapêuticas.

Reações raras ($>1/10.000$ e <1.000):

astenia, palpitações, insônia, sonolência, fadiga ao esforço, gastralgias, secura da boca, diarreia, erupção cutânea.

Reações muito raras (<10.000):

extremidades frias, hipotensão ortostática, distúrbios sexuais, ansiedade, depressão, prurido, edemas, câibras, náuseas, constipação, ondas de calor.

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

Nenhum caso de superdosagem foi relatado até o momento. Os sintomas previstos para um caso de superdosagem seriam uma hipotensão acentuada e distúrbios da vigilância. O tratamento preconizado, além da lavagem gástrica, seria feito com o auxílio dos agentes simpaticomiméticos. HYPERIUM® (rilmenidina) é fracamente dialisável.

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

DIZERES LEGAIS:

MS N° 1.1278.0054

Farm. Responsável: Patrícia Kasesky de Avellar - CRF-RJ n.º 6350

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA

Fabricado por: Les Laboratoires Servier Industrie - 45520 Gidy - França.



Importado e embalado por:

Laboratórios Servier do Brasil Ltda

Estrada dos Bandeirantes, n.º 4211 - Jacarepaguá - 22775-113

Rio de Janeiro - RJ - Indústria Brasileira

C.N.P.J. 42.374.207 / 0001 – 76

Serviço de Atendimento ao Consumidor: 0800 - 7033431

Esta bula foi aprovada pela Anvisa em 15/04/2013.