

RIMPAL®**LERCANIDIPINA****COMPOSICIÓN:**

Cada comprimido recubierto de Rimpal® 10 contiene:
 Lercanidipina HCl10,0 mg.
 Excipientes.....C.S.

Cada comprimido recubierto de Rimpal® 20 contiene:
 Lercanidipina HCl20,0 mg.
 Excipientes.....C.S.

Mecanismo de acción:

La lercanidipina es un antagonista del calcio del grupo de las dihidropiridinas, que inhibe selectivamente el flujo de entrada de calcio a través de la membrana del músculo liso cardíaco y principalmente del vascular. El mecanismo de su efecto antihipertensivo se debe a un efecto relajante directo sobre el músculo liso vascular, reduciendo así la resistencia periférica total. A pesar de su corta vida media, la lercanidipina está dotada de una actividad antihipertensiva prolongada, ya que su coeficiente de partición de membrana es elevado y carece de efectos inotrópicos negativos por su elevada selectividad vascular. Dado que la vasodilatación inducida por la lercanidipina tiene un inicio gradual, raramente se ha observado hipotensión aguda con taquicardia refleja en pacientes hipertensos y no se han registrado efectos significativos en el electrocardiograma. La actividad antihipertensiva de lercanidipina se debe principalmente a su enantiómero (S).

Farmacocinética:

La lercanidipina tiene una buena absorción luego de su administración oral, siendo su concentración plasmática máxima a la 1,5 a 3 horas de su administración. La biodisponibilidad de la lercanidipina aumenta unas 4 veces cuando se administra con alimentos grasos; por ende, se recomienda administrar el fármaco al menos 15 minutos antes de las comidas. La lercanidipina se une en un 98% a proteínas plasmáticas, por lo tanto, la cantidad de droga libre puede aumentar en estados de hipoproteinemia. Se ha determinado que la vida media terminal es de 8 a 10 horas; pero debido a la elevada vida media de la droga en la bicapa lipídica, su duración

de acción es de 24 horas. Ante la administración repetitiva no se ha observado acumulación. Se metaboliza a nivel hepático dando principalmente metabolitos inactivos, de los cuales el 50% aparecen en la orina. No se observó alteración de los parámetros farmacocinéticos en pacientes ancianos o en pacientes con insuficiencia hepática o renal leve a moderada.

Los pacientes con disfunción hepática y renal grave o dependientes de diálisis mostraron niveles más altos (alrededor del 70%) del medicamento.

Indicaciones:

Tratamiento de la hipertensión arterial solo o acompañado de otros medicamentos antihipertensivos.

Posología:

La dosis diaria inicial recomendada es de 1 comprimido de lercanidipina de 10 mg, 15 minutos antes del desayuno.

El máximo efecto antihipertensivo se obtiene al cabo de 2 semanas de comenzado el tratamiento. En caso de no observarse respuesta satisfactoria luego de las primeras 2 semanas de tratamiento, la dosis podrá aumentarse a 20 mg/día. En pacientes con hipertensión más severa o refractaria, se podrá asociar con otro agente antihipertensivo (diurético, beta-bloqueante o inhibidor de la enzima convertidora).

-Dosis mínimas y máximas: en algunos pacientes se han observado respuestas favorables con la dosis de 5 mg/día (dosis mínima).

En pacientes con hipertensión más severa o refractaria, se ha utilizado dosis de hasta 30 a 40 mg/día (dosis máximas).

Posología en poblaciones especiales

-Ancianos: Aunque los datos farmacocinéticos y la experiencia clínica sugieren que no es necesario un ajuste de la dosis, se recomienda precaución cuando se inicia el tratamiento en ancianos.

-Niños y adolescentes: No se recomienda el uso de la lercanidipina en niños y adolescentes menores de 18 años, ya que no hay experiencia clínica.

-Insuficiencia renal y hepática: Se debe tener especial cuidado al iniciar el tratamiento en pacientes con alteración de la función hepática o renal de leve a moderada.

Aunque la pauta posológica recomendada habitualmente puede ser tolerada por estos subgrupos de población, se debe tener precaución al aumentar la dosis a 20 mg/día.

No se recomienda el uso de lercanidipina en pacientes con insuficiencia hepática o con insuficiencia renal severa (aclaramiento de creatinina <30 ml/min).

Modo de uso:

Los comprimidos deben tomarse por vía oral con un vaso de agua, al menos 15 minutos antes de la comidas.

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a las dihidropiridinas o a la lercanidipina o a cualquiera de los excipientes. Pacientes con obstrucción severa del tracto de salida del ventrículo izquierdo, insuficiencia cardiaca congestiva no tratada, angina

inestable, período inmediato (1°mes) postinfarto de miocardio. Pacientes con insuficiencia hepática o renal severa (<10 ml/min clearance). Administración conjunta con inhibidores potentes del CYP3A4. Embarazo y lactancia.

Reacciones adversas:

Los estudios clínicos publicados han demostrado que la lercanidipina es muy bien tolerada, siendo baja la incidencia de los efectos adversos por vasodilatación brusca o

excesiva que se observan comúnmente con los antagonistas cálcicos. Las reacciones adversas más frecuentes incluyen rubor, edema, taquicardia, y mareos, cuya incidencia aumenta

cuando se utiliza inicialmente la dosis de 20 mg/día.

Por este motivo se recomienda comenzar con la dosis de 10 mg/día y luego aumentar si fuese necesario. Otros efectos adversos han sido raros y no claramente relacionados con el fármaco. Si bien no se ha reportado con la lercanidipina, con otras dihidropiridinas se ha observado hiperplasia gingival, dolor precordial y angina de pecho. Ocasionalmente pueden manifestarse: vértigos, somnolencia, fatiga, dolores musculares, trastornos gastrointestinales (náuseas, dispepsias, vómitos, epigastralgia y diarrea), aumento de las transaminasas hepáticas, aumento del volumen de orina y/o de la frecuencia miccional.

Precauciones y advertencias:

Al igual que con otros antagonistas cálcicos dihidropiridínicos, la lercanidipina se debe administrar con precaución a pacientes con enfermedad del nódulo sinusal o deterioro de la función sistólica del ventrículo izquierdo. El médico tratante deberá realizar los ajustes de dosis correspondiente en el caso de

pacientes con disfunción hepática leve o moderada. Se recomienda especial atención en pacientes con isquemia cardiaca. Muy raramente pueden manifestarse aumento de la frecuencia, duración y severidad de episodios anginosos agudos en pacientes con angor preexistente. La lercanidipina no debe ingerirse con jugo de pomelo y debe evitarse el consumo de bebidas alcohólicas durante el tratamiento con dicho fármaco.

Uso durante el embarazo y lactancia

-Embarazo: No existen datos adecuados sobre el uso de lercanidipina en mujeres embarazadas. Los datos preclínicos no proporcionan evidencia de un efecto teratogénico en ratas y en conejos, y la función reproductora en la rata no se vio alterada. Dado que se ha observado que otras dihidropiridinas son teratogénicos en animales, lercanidipina no debe administrarse durante el embarazo o en mujeres en edad fértil, a menos que utilicen un método anticonceptivo eficaz.

- Lactancia: Debido a la elevada lipofilia de lercanidipina, es de esperar que pase a la leche materna. Por tanto, no debe administrarse en mujeres durante el periodo de lactancia.

Efectos sobre la conducción de vehículos y utilización de máquinas: No existen contraindicaciones especiales referentes al manejo o a la utilización de máquinas durante el empleo de lercanidipina. Sin embargo, debe tenerse precaución debido a que puede producir mareo, astenia,

fatiga y muy raramente somnolencia.

Uso en niños: No se recomienda el uso de esta droga en menores de 18 años, debido a que no existe experiencia con su utilización hasta la fecha.

Uso en pacientes ancianos: La lercanidipina en las dosis habituales, ha demostrado ser eficaz y bien tolerada en la población añosa. No obstante, al igual que con cualquier otro fármaco antihipertensivo que se utilice en esta población, se recomienda precaución al iniciar el tratamiento antihipertensivo.

Restricciones de uso:

Este producto se debe administrar con restricción en pacientes con antecedentes de insuficiencia renal y hepática, insuficiencia cardiaca, enfermedad isquémica coronaria, disfunción del ventrículo izquierdo.

Interacciones:

Como la lercanidipina se metaboliza en el hígado por el sistema CYP 3A4, se debe tener precaución y ajustar la dosis cuando se administre con inductores (por ejemplo: difenilhidantoína, carbamazepina y rifampicina) y otras

sustancias (sustratos), que se metabolizan por el mismo sistema, como ser: terfenadina, astemizol, ciclosporina, amiodarona, quinidina, diazepam, midazolam, propranolol y metoprolol. Se observaron interacciones farmacológicas con cimetidina en dosis superiores a 800 mg. Se deberá evitar el uso concomitante con antimicóticos orales (ej: ketoconazol o itraconazol), antibióticos del tipo macrólidos (ej: eritromicina, claritromicina, troleandomicina, etc.), y antivirales orales para el tratamiento de la infección por HIV (ej: ritonavir). Cuando se administren inductores del sistema, puede ser necesario aumentar la dosis de lercanidipina y cuando se administren inhibidores y otros sustratos del sistema puede ser necesario disminuir la dosis. La co-administración de lercanidipina con ciclosporina triplica el incremento en los niveles plasmáticos de lercanidipina e incrementa en un 21% la biodisponibilidad de ciclosporina. Por lo tanto la ciclosporina y la lercanidipina no deben ser administradas juntas. Se recomienda que la lercanidipina y la simvastatina sean administradas en forma separada. Los pacientes tratados con lercanidipina y digoxina de forma concomitante, deben ser estrechamente monitorizados, debido a los efectos tóxicos de la digoxina. La lercanidipina es sensible a la inhibición del metabolismo por el zumo de pomelo, con una consiguiente elevación en su disponibilidad sistémica y un aumento de su efecto hipotensor. Por lo tanto, la lercanidipina no debe tomarse con jugo de pomelo. El alcohol debe ser evitado, mientras se esta tomando lercanidipina, debido a que el mismo puede potenciar el efecto vasodilatador de medicamentos antihipertensivos.

Sobredosis:

No hay casos reportados de sobredosis con lercanidipina. No obstante, ante una sobredosis son de esperar hipotensión, taquicardia o bradicardia y deterioro de la conciencia. Ante esta eventualidad se recomienda apoyo y control de signos vitales durante por lo menos 24 horas, debido a la prolongada duración de la acción de la lercanidipina. No se tiene información sobre el valor de la diálisis. Ya que el medicamento es altamente lipofílico, es muy probable que sus concentraciones plasmáticas no sean una

buena guía para determinar la duración de periodo de riesgo y la diálisis puede no resultar eficaz. En caso de sobredosis recurrir al Centro Nacional de Toxicología en Emergencias Médicas sito en Gral. Santos y Teodoro S. Mongelós - Tel.: (595-21) 220 418.

Presentación:

Cajas conteniendo 30 comprimidos recubiertos.

Almacenar a temperatura ambiente (15° - 30°C).

Mantener fuera del alcance de los niños.



ETICOS®

Elaborado por

Laboratorio de Productos ETICOS C.E.I.S.A.

Atilio Galfre N° 151 y Calle 1- San Lorenzo, Paraguay

Tel.: (595-21) 521 390 (R.A.) Fax: (595-21) 521 389

laboratorio@eticos.com.py - www.eticos.com.py

D.T.: Q.F. Myriam Cabriza de Paredes - Reg. N° 2837

Autorizado en Paraguay por el M.S.P. y B.S.