

Nicord

besilato de anlodipino

Forma farmacêutica e apresentações

Comprimidos de 2,5mg e 10mg: caixa contendo 20 comprimidos.

Comprimidos de 5mg: caixa contendo 10 ou 20 comprimidos.

USO ADULTO / VIA ORAL**Composição**

Cada comprimido de 2,5mg contém:

besilato de anlodipino (equivalente a 2,5mg de anlodipino base) 3,47mg

Excipientes:fosfato de cálcio, croscarmelose sódica, estearato de magnésio

e dióxido de silício 1 comprimido

Cada comprimido de 5mg contém:

besilato de anlodipino (equivalente a 5mg de anlodipino base) 6,94mg

Excipientes:fosfato de cálcio, croscarmelose sódica, estearato de magnésio

e dióxido de silício 1 comprimido

Cada comprimido de 10mg contém:

besilato de anlodipino (equivalente a 10mg de anlodipino base) 13,89mg

Excipientes:fosfato de cálcio, croscarmelose sódica, estearato de magnésio

e dióxido de silício 1 comprimido

INFORMAÇÕES AO PACIENTE***Ação esperada do medicamento***

Tratamento da Hipertensão e Isquemia miocárdica.

Cuidados de armazenamento

Conservar o produto em temperatura ambiente (entre 15°C e 30°C), proteger da luz e da umidade.

Prazo de validade

24 meses após data de fabricação.

Não use medicamentos com o prazo de validade vencido.

Conduta na gravidez e na lactação

A segurança do uso de anlodipino em mulheres grávidas ou em fase de amamentação não está estabelecida.

Informe ao seu médico a ocorrência de gravidez na vigência do seu tratamento ou após seu término.

Informe ao seu médico se estiver amamentando.

Cuidados de administração

Siga a orientação de seu médico, respeitando sempre os horários, as doses e a duração do tratamento.

Interrupção do tratamento

Não interrompa o tratamento sem o conhecimento de seu médico.

Reações adversas

Informe ao médico sobre o aparecimento de reações desagradáveis, tais como dor de cabeça, edema, fadiga, náusea, rubor e tontura.

TODO MEDICAMENTO DEVE SER MANTIDO FORA DO ALCANCE DAS CRIANÇAS.

Ingestão concomitante com outras substâncias

O anlodipino tem sido administrado com segurança com diuréticos tiazídicos, beta-bloqueadores, inibidores da enzima conversora de angiotensina, nitratos de longa ação, nitroglicerina sublingual, drogas antiinflamatórias não esteróides, antibióticos e hipoglicemiantes orais. Estudos têm indicado que a co-administração de anlodipino e digoxina não altera os níveis séricos ou o "clearance" renal da digoxina em voluntários normais, e a co-administração da cimetidina não altera a farmacocinética do anlodipino. Dados "in-vitro" de estudos com plasma humano indicam que o anlodipino não afeta a ligação a proteínas das drogas testadas (digoxina, fenitoína, varfarina ou indometacina).

Contra-indicações e precauções

Contra-indicado para pacientes com hipersensibilidade ao anlodipino.

Deve-se usar com cautela em pacientes com insuficiência hepática e com insuficiência cardíaca congestiva. Pacientes com estenose aórtica severa que usam qualquer vasodilatador periférico podem apresentar, raramente, hipotensão aguda.

Informe ao seu médico sobre qualquer medicamento que esteja usando durante o tratamento com Nicord.

NÃO TOME REMÉDIO SEM O CONHECIMENTO DO SEU MÉDICO, PODE SER PERIGOSO PARA A SAÚDE.

INFORMAÇÕES TÉCNICAS

Características químicas e farmacológicas

O besilato de anlodipino, princípio ativo de Nicord, contém duas cadeias laterais longas no anel dihidropiridínico. Uma delas, a 2-aminoetoximetila, situada na proximidade do nitrogênio do anel dihidropiridínico, por seu efeito estérico protege contra a ação da citocromo P450, enzima responsável pela oxidação do anel dihidropiridínico à piridina correspondente.

O besilato de anlodipino é um antagonista do cálcio (antagonista do íon cálcio ou bloqueador do canal lento) que inibe o influxo transmembrana de íons cálcio para o interior do músculo liso vascular e músculo cardíaco.

Os processos contráteis do músculo cardíaco e do músculo liso vascular são dependentes do movimento de íons cálcio extracelular para o interior destas células através dos canais de íons específicos.

O besilato de anlodipino inibe seletivamente o influxo de íon cálcio através das membranas celulares, com um efeito maior do músculo liso vascular que nas células do músculo cardíaco. Efeitos inotrópicos negativos podem ser detectados "in vitro" mas não têm sido detectados em animais em doses terapêuticas. A concentração de cálcio sérico não é afetada pelo besilato de anlodipino. Dentro da faixa de pH fisiológico, o besilato de anlodipino é um composto ionizado ($pK_a = 8,6$), e sua interação cinética com o receptor de canal de cálcio é caracterizada por uma proporção gradual de associação e dissociação com o receptor do sítio de ligação, resultando em um início gradual de efeito.

O besilato de anlodipino é um vasodilatador arterial periférico que atua diretamente no músculo liso vascular causando uma redução na resistência vascular periférica e redução na pressão sanguínea.

O mecanismo pelo qual o besilato de anlodipino alivia a angina não é totalmente conhecido, mas é considerado o seguinte:

Angina de esforço: em pacientes com a angina de esforço, Nicord reduz a resistência periférica total (afterload) contra o trabalho cardíaco, e reduz o produto frequência cardíaca x pressão e, assim, a demanda miocárdica de oxigênio, em qualquer nível de exercício.

Angina vasoespástica: Nicord bloqueia a constrição e restaura o fluxo sanguíneo nas artérias coronárias e arteríolas em resposta ao cálcio, epinefrina potássica, serotonina e análogo do tromboxano A2 em modelos animais experimentais e em vasos coronários humanos "in vitro". Esta inibição do espasmo coronário é responsável pela eficácia de Nicord na angina vasoespástica (de Prinzmetal ou variante).

A absorção do besilato de anlodipino por via oral é lenta, porém quase completa. A biodisponibilidade é de 60 a 65%, aproximadamente. A taxa de ligação proteica é alta (95 a 98%) e a biotransformação hepática é lenta. A concentração plasmática máxima é atingida em 6 a 9 horas (dose única). A excreção é renal (59 a 62%) e biliar fecal (20 a 25%). A meia-vida de eliminação do besilato de anlodipino é de 35 horas (voluntários sadios) e 48 horas (pacientes hipertensos), 65 horas (idosos) e 60 horas (pacientes com comprometimento hepático).

Indicações

Nicord é indicado como droga de primeira linha no tratamento da hipertensão podendo ser usado na maioria dos pacientes como agente único de controle da pressão sanguínea. Pacientes que não são adequadamente controlados com um único agente anti-hipertensivo podem ser beneficiados com a adição de anlodipino, que tem sido usado em combinação com diuréticos tiazídicos, agentes beta-bloqueadores adrenérgicos ou inibidores da enzima conversora de angiotensina.

Nicord é indicado no tratamento da isquemia miocárdica como droga de primeira linha, devido tanto à obstrução fixa (angina estável) como à vasoespasmos/vasoconstrição (angina de Prinzmetal ou angina variante) da vasculatura coronária. Nicord pode ser usado em situações clínicas sugestivas, mas não confirmadas, de possível componente vasoespástico/vasoconstritor. Nicord pode ser usado, como monoterapia, ou em combinação com outras drogas anti-anginosas em pacientes com angina refratária a nitratos e/ou doses adequadas de beta-bloqueadores.

Contra-indicações

Hipersensibilidade conhecida às dihidropiridinas.

Precauções

Uso na gravidez e lactação

A segurança de anlodipino na gravidez humana ou lactação não está estabelecida. O anlodipino não demonstrou toxicidade em estudos reprodutivos em animais a não ser prolongamento do trabalho de parto em ratos, em níveis de doses cinquenta vezes superiores à dose máxima recomendada em humanos. Desta maneira, o uso na gravidez é recomendado apenas quando não existe alternativa mais segura e quando a doença por si só acarreta risco maior para a mãe do que para o feto. O aleitamento deverá ser interrompido devido ao uso de Nicord.

Uso em idosos

Embora pacientes idosos possam ter concentrações plasmáticas de anlodipino maiores do que indivíduos jovens, as meia-vidas de eliminação terminal são semelhantes. O besilato de anlodipino usado em doses semelhantes em idosos e jovens é igualmente bem tolerado. Desta maneira são recomendados os regimes posológicos normais.

Uso na insuficiência renal

O anlodipino é amplamente metabolizado em metabólitos inativos, com 10% excretados como droga inalterada na urina. Alterações nas concentrações plasmáticas de anlodipino não estão relacionadas com o grau de insuficiência renal. O besilato de anlodipino pode ser empregado em tais pacientes nas doses habituais. O anlodipino não é dializável.

Uso na insuficiência hepática

A meia-vida de eliminação do anlodipino é prolongada em pacientes com insuficiência hepática e

as recomendações posológicas neste caso não estão estabelecidas. Portanto, a droga deve ser administrada com cautela nestes pacientes.

Interações medicamentosas

O anlodipino tem sido administrado com segurança com diuréticos tiazídicos, beta-bloqueadores, inibidores da enzima conversora de angiotensina, nitratos de longa ação, nitroglicerina sublingual, drogas antiinflamatórias não esteróides, antibióticos e hipoglicemiantes orais. Estudos têm indicado que a co-administração de anlodipino e digoxina não altera os níveis séricos ou o "clearance" renal da digoxina em voluntários normais, e a co-administração da cimetidina não altera a farmacocinética do anlodipino. Dados "in-vitro" de estudos com plasma humano indicam que o anlodipino não afeta a ligação a proteínas das drogas testadas (digoxina, fenitoína, varfarina ou indometacina).

Reações adversas

Nicord é bem tolerado. Em estudos clínicos placebo-controlados envolvendo pacientes com hipertensão ou angina, os efeitos colaterais mais comumente observados foram: dor de cabeça, edema, fadiga, náuseas, rubor e tonturas. Não foram observados quaisquer tipos de anormalidades significantes nos testes laboratoriais relacionados ao anlodipino.

Posologia

A introdução de tratamento anti-hipertensivo com produtos antagonistas do íon cálcio deve sempre utilizar a menor dose. A seguir, em prazo de 7 a 14 dias (em média 10 dias), após a reavaliação clínica do paciente e de acordo com a sua resposta terapêutica, inicia-se a titulação de dose. A terapêutica anti-hipertensiva, com o besilato de anlodipino segue os mesmos preceitos. Recomenda-se iniciar o tratamento com 5 mg ao dia, podendo ser aumentado se necessário, para 10 mg ao dia. Indivíduos de baixa estatura, baixo peso, idosos ou com insuficiência hepática, devem começar com 2,5 mg uma vez ao dia. Esta dosagem também é indicada para pacientes submetidos a outra terapia anti-hipertensiva à qual se adiciona o besilato de anlodipino. A dosagem deve ser ajustada segundo as necessidades do paciente.

A dose recomendada para angina crônica estável ou vasoespástica é de 5 a 10 mg. A maioria dos pacientes necessitam de 10 mg para efeito adequado. Quando co-administrado com outras drogas anti-hipertensivas e/ou antianginosas, o besilato de anlodipino tem sido administrado com segurança com tiazídicos, beta-bloqueadores, nitratos e/ou nitroglicerina sublingual.

Superdosagem

Não existem experiências bem documentadas com a superdosagem de anlodipino. Uma vez que a absorção de anlodipino é lenta, em alguns casos lavagem gástrica poderá ser necessária. Os dados disponíveis sugerem que uma superdosagem poderia resultar em excessiva vasodilatação periférica, levando então a uma acentuada e provavelmente prolongada hipotensão sistêmica. Uma hipotensão clinicamente significativa devido à superdosagem de anlodipino requer medida de suporte cardiovascular ativa, incluindo monitorização das funções cardíacas e respiratória, elevação das extremidades, atenção para o volume de fluido circulante e eliminação urinária. Um vasoconstritor pode ser útil na recuperação do tono vascular e pressão sanguínea, desde que o uso do mesmo não seja contra indicado. Uma vez que o anlodipino é altamente ligado à proteínas plasmáticas, a diálise não constitui um benefício para o paciente.

Pacientes idosos

Não existem recomendações especiais desde que observadas as contra-indicações e precauções comuns ao produto.

M.S. 1.0155.0196 • Farm.Resp: Regina H. V. Souza / CRF-SP nº 6394

Marjan Indústria e Comércio Ltda

Rua Gibraltar, 165 - Sto. Amaro / SP • CEP: 04755-070 • Tel. : (11) 5642-9888

CNPJ nº 60.726.692/0001-81

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA