

Cynt[®]

moxonidina

FORMA FARMACÊUTICA E APRESENTAÇÕES

CYNT[®] é apresentado em cartuchos contendo 30 comprimidos revestidos de 0,2 mg ou 0,4 mg, administrados por via oral. CYNT[®] 0,2 mg apresenta superfícies convexas, lisas e de coloração rosa clara contendo a inscrição "0,2". CYNT[®] 0,4 mg difere de CYNT[®] 0,2 mg pela coloração rosa opaca e a inscrição "0,4".

USO ADULTO

COMPOSIÇÃO

Cada comprimido revestido de CYNT[®] contém:

Moxonidina 0,2 mg ou 0,4 mg
Excipientes: (lactose monoidratada, povidona, crospovidona, estearato de magnésio, etilcelulose, polietilenoglicol, talco, hidroxipropilmetilcelulose, óxido de ferro vermelho e dióxido de titânio) q.s.p. 1 comprimido revestido

INFORMAÇÕES AO PACIENTE

Ação esperada do medicamento: CYNT[®] é indicado para o tratamento da hipertensão arterial. Os efeitos máximos de redução da pressão arterial surgem dentro da primeira hora após a tomada do comprimido.

Cuidados de armazenamento: CYNT[®] deve ser mantido em sua embalagem original, em temperatura ambiente (entre 15°C e 30°C) e protegido da umidade.

Prazo de validade: CYNT[®] possui prazo de validade de 2 anos (24 meses) a partir da data de fabricação (vide cartucho). Não use medicamento com o prazo de validade vencido.

Gravidez e lactação: Informe seu médico sobre a ocorrência de gravidez na vigência do tratamento ou após o seu término. Informar ao médico se está amamentando.

Cuidados de administração: Siga a orientação do seu médico, respeitando sempre os horários, as doses e a duração do tratamento. Este medicamento deve ser administrado por via oral e não pode ser partido ou mastigado.

Interrupção do tratamento: O tratamento com CYNT[®] não deve ser interrompido abruptamente. Não interromper o tratamento sem o conhecimento do seu médico.

Reações adversas: Informe seu médico sobre o aparecimento de reações desagradáveis. As reações adversas mais frequentes são: boca seca, dor de cabeça, tontura, fraqueza geral e sonolência. Esses sintomas geralmente diminuem após as primeiras semanas de tratamento.

■ "TODO MEDICAMENTO DEVE SER MANTIDO FORA DO ALCANCE DAS CRIANÇAS".

Ingestão concomitante com outras substâncias:

■ A administração concomitante de CYNT[®] com outros medicamentos anti-hipertensivos resulta em aumento da ação anti-hipertensiva, portanto informe seu médico sobre outros medicamentos que esteja tomando.

Devido à falta de experiência terapêutica, o uso da moxonidina junto com antidepressivos tricíclicos, benzodiazepínicos ou álcool deve ser evitado.

CYNT[®] pode ser tomado com ou sem a ingestão de alimentos.

Contra-indicações e precauções: Os pacientes devem evitar dirigir veículos ou operar máquinas durante o tratamento, até que tenham certeza de que seu desempenho não foi afetado. CYNT[®] é contra-indicado em casos de hipersensibilidade conhecida a qualquer um dos componentes da fórmula.

Informe seu médico sobre qualquer medicamento que esteja usando, antes do início ou durante o tratamento.

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

INFORMAÇÕES TÉCNICAS CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS

Descrição

A moxonidina é um agonista seletivo dos receptores imidazolinícos, com ação anti-hipertensiva com fórmula molecular C₉H₁₂ClN₂O.

Apresenta-se como um pó cristalino branco, levemente solúvel em metanol e muito pouco solúvel em água, etanol, acetona, clorofórmio e em diclorometano. Tem ponto de fusão variando de 197° a 205°C (desintegração) e o peso molecular é 241,7.

Propriedades farmacodinâmicas

Em estudos com diferentes animais a moxonidina demonstrou ser um potente agente anti-hipertensivo. Dados experimentais disponíveis sugerem que o local da ação anti-hipertensiva da moxonidina é o sistema nervoso central (SNC). No tronco cerebral, a moxonidina estimula os receptores imidazolinícos de modo seletivo. Estes receptores estão localizados principalmente na medula ventrolateral rostral, a área por excelência responsável pelo controle do sistema nervoso simpático periférico. A estimulação dos receptores imidazolinícos reduz a atividade simpática e a pressão arterial.

A moxonidina diferencia-se de outros anti-hipertensivos simpaticolíticos porque, em comparação com os receptores imidazolinícos, apresenta uma fraca afinidade pelos alfa2 - adrenorreceptores. Esta fraca afinidade pelos alfa2 - adrenorreceptores contribui para explicar a baixa incidência de sedação e secura de boca com a moxonidina. Em humanos, a moxonidina promove uma redução da resistência vascular sistêmica e, conseqüentemente, uma redução da pressão arterial. O efeito anti-hipertensivo da moxonidina foi demonstrado por inúmeros estudos randomizados, duplo-cegos, placebo-controlados.

Em estudo clínico placebo-controlado de dois meses de duração, a moxonidina melhorou a sensibilidade à insulina em 21% em pacientes obesos e em pacientes resistentes à insulina com hipertensão moderada.

Propriedades farmacocinéticas

Após a administração oral, a moxonidina é rápida (t_{max} cerca de 1h) e quase que completamente absorvida pelo trato gastrointestinal. Após um período de 24 horas, 78% da dose total são excretados na urina sob a forma de moxonidina inalterada e 13% da dose excretados como moxonidina desidrogenada. Outros metabólitos encontrados na urina somaram aproximadamente 8% da dose. Em amostras combinadas de plasma humano, apenas a moxonidina desidrogenada foi positivamente identificada. A atividade farmacodinâmica da moxonidina desidrogenada é cerca de 1/10 comparada à moxonidina. A eliminação da moxonidina e seu metabólito é relativamente rápida (meias-vidas terminais de aproximadamente 2,5h e 5 h, respectivamente). Menos de 1% é eliminado nas fezes.

A ligação às proteínas plasmáticas, determinada *in vitro* é de cerca de 7,2%. A ingestão de alimentos não tem influência na farmacocinética da moxonidina.

Não foram observadas mudanças farmacocinéticas relevantes em pacientes hipertensos quando comparados com voluntários sadios. Foram notadas alterações na farmacocinética relacionadas com a idade e são mais provavelmente devidas à redução da atividade metabólica e/ou biodisponibilidade ligeiramente maior em indivíduos geriátricos. Porém, essas diferenças farmacocinéticas não são consideradas clinicamente relevantes.

A eliminação da moxonidina é significativamente correlacionada com o *clearance* de creatinina. Em pacientes com insuficiência renal severa (filtração glomerular < 30 ml/min) as concentrações plasmáticas de equilíbrio e meia-vida terminal são aproximadamente 3 vezes maiores comparadas com pacientes hipertensos com função renal normal (filtração glomerular > 90 ml/min). Em pacientes com insuficiência renal moderada (filtração glomerular 30-60 ml/min) as concentrações plasmáticas de equilíbrio e a meia-vida terminal são aproximadamente 80% e 35% maiores, respectivamente. Em ambos os grupos as concentrações plasmáticas máximas são apenas 50% maiores. Não foi observado acúmulo da droga após múltiplas doses nesses pacientes. Em pacientes com insuficiência renal, a dose deve ser determinada de acordo com as necessidades individuais. Como a moxonidina não é recomendada para crianças, não foram feitos estudos farmacocinéticos nesta subpopulação.

A moxonidina é pouco eliminada por hemodiálise.





INDICAÇÕES

A moxonidina é indicada para o tratamento da hipertensão arterial.

CONTRA-INDICAÇÕES

A moxonidina é contra-indicada nos casos de:

- Hipersensibilidade conhecida a qualquer um dos componentes da fórmula;
- Pacientes com doença do nó sinusal ou bradicardia (frequência cardíaca em repouso < 50 batimentos/minuto).

POSOLOGIA

CYNT® deve ser administrado por via oral.

A dose inicial usual de CYNT® é de 0,2 mg por dia, com uma dose máxima diária de 0,6 mg dividida em duas tomadas (0,4 mg pela manhã e 0,2 mg à noite). A dose única máxima recomendada é de 0,4 mg. Ajustes na dose diária devem ser feitos de acordo com a resposta ao tratamento.

Pacientes com insuficiência renal

Em pacientes com insuficiência renal moderada a grave a dose inicial é de 0,2 mg ao dia. Se necessária e bem tolerada, a dose pode ser aumentada para 0,4 mg ao dia.

Em pacientes submetendo-se à hemodiálise a dose inicial é de 0,2 mg ao dia. Se necessária e bem tolerada, a dose pode ser aumentada para 0,4 mg ao dia.

PRECAUÇÕES E ADVERTÊNCIAS

Se a moxonidina for administrada em combinação com um beta-bloqueador e ambos os tratamentos tiverem de ser descontinuados, o beta-bloqueador deverá ser descontinuado primeiro, e só depois então a moxonidina. O tratamento com moxonidina não deve ser interrompido abruptamente.

CYNT® pode ser tomado com ou sem a ingestão de alimentos.

Efeitos na habilidade de dirigir e operar máquinas

Não existem dados sugerindo que a moxonidina comprometa a habilidade de dirigir ou operar máquinas. Sonolência e tonturas foram relatadas durante a sua utilização. Assim, o paciente deve estar ciente disto durante o desempenho destas tarefas.

Uso pediátrico

A segurança e eficácia da moxonidina não foram estabelecidas para pacientes com menos de 18 anos.

Gravidez e lactação

Não há dados clínicos disponíveis com moxonidina em mulheres grávidas.

Estudos em animais não indicaram efeitos prejudiciais diretos ou indiretos com respeito à gravidez, desenvolvimento embrionário/fetal, parto ou desenvolvimento pós-natal. Porém, deve-se ter precaução quando prescrito a mulheres grávidas.

Não há evidência de carcinogênese, mutagênese e danos à fertilidade baseado em estudos *in vitro* e em animais.

A moxonidina é excretada no leite materno. Mulheres lactantes devem ser alertadas para não amamentarem enquanto estiverem usando a moxonidina ou o tratamento deverá ser interrompido.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Co-administração com outros agentes anti-hipertensivos: a moxonidina foi seguramente administrada com diuréticos tiazídicos e bloqueadores de canais de cálcio. A administração concomitante destes e outros agentes anti-hipertensivos resulta em aumento da ação anti-hipertensiva.

Em voluntários sadios não se observaram interações farmacocinéticas com hidroclorotiazida, glibenclamida (gliburida) ou digoxina.

A moxonidina potencializa moderadamente o comprometimento das funções cognitivas de indivíduos sob tratamento com lorazepam e pode aumentar o efeito sedativo de benzodiazepinas quando administrada concomitantemente. Uma vez que os antidepressivos tricíclicos podem reduzir a eficácia dos agentes anti-hipertensivos de ação central, não se recomenda que antidepressivos tricíclicos sejam administrados concomitantemente a moxonidina. Não foi demonstrada interação farmacodinâmica com a moclobemida.

REAÇÕES ADVERSAS

Sistema nervoso – freqüentes: dores de cabeça, sonolência e vertigem.

Sistema vascular – raras: hipotensão e hipotensão postural.

Sistema gastrointestinal – freqüentes: boca seca.

Gerais – freqüentes: astenia.

Os sintomas geralmente diminuem após as primeiras semanas do tratamento.

SUPERDOSAGEM

Sintomas

Nos poucos casos conhecidos de superdosagem, doses acima de 16 mg foram ingeridas sem ocorrência de eventos fatais.

Os sinais e sintomas incluíram: dores de cabeça, sedação, sonolência, hipotensão, tonturas, fraqueza, bradicardia, boca seca, vômito, fadiga e dores no estômago.

Além disso, baseando-se nos poucos estudos com altas doses em animais, pode ocorrer hipertensão transiente, taquicardia e hiperglicemia.

Tratamento

Não se conhecem antídotos específicos. Em caso de hipotensão, recomenda-se suporte circulatório tais como a administração de fluidos e dopamina. A bradicardia pode ser tratada com atropina.

Antagonistas de alfa-receptores podem diminuir ou neutralizar os efeitos hipertensivos paradoxais da superdose de moxonidina.

PACIENTES IDOSOS

Alterações farmacocinéticas relacionadas à idade foram observadas provavelmente devido à atividade metabólica reduzida e/ou biodisponibilidade ligeiramente maior no idoso. Entretanto, essas diferenças farmacocinéticas não são consideradas como clinicamente relevantes.

“ESTE PRODUTO É UM NOVO MEDICAMENTO E EMBORA AS PESQUISAS TENHAM INDICADO EFICÁCIA E SEGURANÇA QUANDO CORRETAMENTE INDICADO, PODEM OCORRER REAÇÕES ADVERSAS IMPREVISÍVEIS AINDA NÃO DESCRITAS OU CONHECIDAS. EM CASO DE SUSPEITA DE REAÇÃO ADVERSA, O MÉDICO RESPONSÁVEL DEVE SER NOTIFICADO”

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA

Reg. MS.: 1.0082.0167

Farm. Resp.: Dr. Rogério M. Massonetto - CRF-SP nº 22.965

Nº de lote, data de fabricação e de validade: vide cartucho e/ou rótulo.

Fabricado por: ROTTENDORF PHARMA GmbH
Ostenfelder Strasse 51- 61 - Ennigerloh - Alemanha

Embalado e distribuído por:



**Solvay
Farma**

SOLVAY FARMA LTDA.
Rua Salvador Branco de Andrade, 93
Taboão da Serra - SP - Indústria Brasileira
CNPJ: 60.499.639/0001-95

SAC
0800-0141500
www.solvayfarma.com.br

1045112