



cloridrato de selegilina

Medicamento genérico
Lei nº 9.787, de 1999

5mg
Comprimidos

USO ORAL
USO ADULTO

FORMA FARMACÊUTICA E APRESENTAÇÃO

Comprimidos com 5 mg de cloridrato de selegilina. Embalagem com 30 unidades.

COMPOSIÇÃO

Cada comprimido contém:
cloridrato de selegilina 5 mg
excipientes q.s.p. 1 comprimido
(lactose monoidratada, ácido cítrico, celulose microcristalina, estearato de magnésio)

INFORMAÇÕES AO PACIENTE

Ação esperada do medicamento: Melhora dos sintomas da Doença de Parkinson.

Cuidados de armazenamento: Conservar em temperatura ambiente, entre 15°C e 30°C. Proteger da luz e umidade.

Prazo de validade: Desde que respeitados os cuidados de armazenamento, o produto apresenta uma validade de 36 meses a contar da data de sua fabricação. Não devem ser utilizados produtos fora do prazo de validade, pois podem trazer prejuízos à saúde.

ESTE MEDICAMENTO NÃO DEVE SER UTILIZADO SE O PRAZO DE VALIDADE ESTIVER VENCIDO.

Gravidez e lactação: Informe seu médico da 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 duração do tratamento.

Interrupção do tratamento: Não interromper o tratamento sem o conhecimento do seu médico.

Reações adversas: Informe seu médico o aparecimento de reações desagradáveis.

São raras as reações ao medicamento. As reações adversas do cloridrato de selegilina em monoterapia, até hoje assinaladas, são: insônia, vertigens ou tonturas, cefaléias, náuseas e outras alterações gastrointestinais; hipotensão ao levantar-se, agitação, movimentos lentos, delírios, pressão alta, desmaio, alterações da micção e aumento da próstata.

Aumento dos movimentos involuntários, arritmia, episódios novos ou recorrentes de angina, edema dos membros inferiores, queda de cabelos, perda de peso e nervosismo, ansiedade, obstipação, letargia, distonia, sudorese, sangramento gastrointestinal, asma, diplopia, fotossensibilidade.

TODO MEDICAMENTO DEVE SER MANTIDO FORA DO ALCANCE DAS CRIANÇAS.

Ingestão concomitante com outras substâncias: Doses altas de cloridrato de selegilina (acima de 10 mg/dia) interagem com a tiramina presente em alguns alimentos (carne defumada, queijos [exceto cottage ou cream cheese], fígado, feijão tipo fava, molho de soja, levedo, banana, figo, uva passa, salame, pepperoni, salsicha, iorgute, aves, cerveja, vinho, licores e bebidas com cafeína: café, chá preto, chocolate, refrigerantes tipo cola), podendo causar crise hipertensiva súbita e severa.

Verifique com seu médico a necessidade ou não de fazer a dieta.

Contra-indicações e precauções: O produto é contra-indicado para pacientes com conhecida hipersensibilidade ao cloridrato de selegilina, e para pacientes que recebem meperidina e outros opiáceos.

Em pacientes idosos, as reações adversas ocorrem com maior frequência. Não há dados que justifiquem o reajuste de dose.

Não utilizar o produto no tremor essencial e Coreia de Huntington, que são síndromes não relacionadas à falta de dopamina.

Durante o tratamento aconselha-se efetuar controles periódicos da função hepática.

Não deve ser utilizado à noite, pois pode produzir insônia.

Deve ser usado com cautela em pacientes com problemas de rim e fígado pelo efeito acumulativo.

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

Embora seja indicado para uma doença que atinge pessoas, em geral, acima dos 50 anos, o produto não deverá ser utilizado em mulheres grávidas ou na lactação, pois a segurança do cloridrato de selegilina não foi estabelecida nessas situações.

Uso pediátrico: Segurança e indicações para crianças abaixo de 12 anos não foram estabelecidas.

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

INFORMAÇÕES TÉCNICAS

CARACTERÍSTICAS

O cloridrato de selegilina é um antiparkinsoniano. O nome químico do cloridrato de selegilina é benzenoetanamina, N, alfa-dimetil-propilni-cloridrato, (R) – N – Alfa-dimetil-N2 propilfenetilamina cloridrato, e possui massa molecular de 223,74. O cloridrato de cloridrato de selegilina é um pó cristalino branco, inodoro, levemente solúvel em água, clorofórmio e metanol.

MECANISMO DE AÇÃO

1 - Ação anti-MAO (monoaminoxidase) potente e seletiva sobre a MAO-B, demonstrada "in vitro" e "in vivo", através da inibição de oxidação da benzilamina, da feniletilamina e da dopamina em concentrações que não influenciam significativamente o metabolismo da serotonina.

2 - Um efeito importante é aquele sobre a dopamina, em relação às aplicações terapêuticas da substância. Foi demonstrado em animais e no ser humano que o cloridrato de selegilina aumenta os níveis cerebrais de dopamina, seja através da inibição do metabolismo, seja pela inibição da recaptação (reabsorção) da dopamina. Portanto, o cloridrato de selegilina apresenta uma ação ativadora das vias dopaminérgicas da substância nigra estriada, resultando um complemento com relação à ação da levodopa.

3 - O cloridrato de selegilina no cérebro corrige a atividade excessiva da MAO-B e, dessa forma, a diminuição da dopamina. Esta diminuição é ocasionada seja pela destruição dos neurônios, onde a dopamina é sintetizada, seja pela proliferação substitutiva das células da glia, que ocasionam um aumento da atividade da MAO-B.

4 - Diferentemente dos IMAO clássicos, reduz a liberação de noradrenalina ao nível do tecido cerebral. Além disso, inibe o "uptake" de noradrenalina marcada com isótopo radioativo, em locais do tecido.

5 - O efeito estimulante do cloridrato de selegilina em ratos corrobora seu mecanismo de agonismo dopaminérgico.

6 - Nas fases iniciais da doença (parkinsonismo - primeira fase), o uso do cloridrato de selegilina, na forma de monoterapia, pode ser eficaz do ponto de vista clínico na melhoria da sintomatologia dos pacientes e sobre a diminuição da progressão da doença, retardando de maneira significativa a necessidade do uso da levodopa, segundo alguns estudos.

7 - O tratamento de cloridrato de selegilina em associação com a levodopa está particularmente indicado nos pacientes que, durante o tratamento com doses elevadas de levodopa, apresentem fenômenos de flutuações ("on-off"), discinesias e acinesias.

O sal possibilita reduzir, em média, 30% das doses de levodopa necessárias para controle da sintomatologia; assim sendo, colabora para que não apareça a eventual síndrome do tratamento prolongado com a levodopa ("long-term levodopa syndrome").

FARMACOCINÉTICA

Somente informações preliminares a respeito dos detalhes do comportamento farmacocinético do cloridrato de selegilina e seus metabólitos estão disponíveis.

O cloridrato de selegilina é rapidamente absorvido (cerca de 73% da dose é absorvida), atingindo a concentração máxima no plasma (pico plasmático) após 0,5 a 2 horas da sua administração. Após a administração de uma dose oral de 10 mg de cloridrato de selegilina em 12 indivíduos saudáveis, os níveis séricos de cloridrato de selegilina não-metabolizado estavam abaixo do limite de detecção (menos de 10 ng/ml).

O cloridrato de selegilina é rapidamente metabolizado. Três metabólitos, N-desmetildeprenil (o principal metabólito com meia-vida de 2 horas), amfetamina (meia-vida de 17,7 horas) e a metanfetamina (meia-vida de 20,5 horas), foram encontrados no sangue e na urina. Passadas 48 horas, 45% da dose administrada apareceu na urina na forma dos três metabólitos. O cloridrato de selegilina inalterado não foi encontrado na urina.

A taxa de reposição de MAO-B, após a interrupção do uso da selegilina, dependerá da velocidade da síntese proteica de novas moléculas da enzima, mas não há dados disponíveis sobre essa velocidade.

INDICAÇÕES

Está indicado para o tratamento da Doença de Parkinson Idiopática em combinação com L-Dopa ou L-Dopa + carbidopa.

No tratamento da Síndrome Psicorgânica primária.

CONTRA-INDICAÇÕES

Absolutas: Hipersensibilidade individual demonstrada ao produto, e uso concomitante de meperidina e possivelmente outros opiáceos.

Relativas: O cloridrato de selegilina não deverá ser administrado em pacientes com:

- *Movimentos involuntários anormais, na fase "on".*
- *Psicose grave ou demência profunda.*
- *Úlcera péptica ativa.*
- *Outras doenças extrapiramidais, tais como: tremor essencial (hereditário), discinesia tardia e Coreia de Huntington.*
- *Gravidez e amamentação.*

PRECAUÇÕES E ADVERTÊNCIAS

Não utilizar o produto no tremor essencial e Coreia de Huntington, que são síndromes não relacionadas à falta de dopamina.

FORMATO: 150 x 210 mm
COR: Pantone 2945
CODIGO: 2074001

FINALIZAÇÃO: ABERTA
MODELO DE BULA: 2slgco2
SUBSTITUI O CÓDIGO: 6207 (2074000)



Durante o tratamento aconselha-se efetuar controles periódicos da função hepática.

Deve ser evitado a associação com antidepressivos tricíclicos e inibidores seletivos da recaptação da serotonina (ISRS). Deve-se observar um intervalo de 14 dias entre a descontinuação da selegilina e esses agentes. Para se introduzir a selegilina após a interrupção da fluoxetina (ISRS), deve-se observar um intervalo de 6 semanas.

Não deve ser utilizado à noite, pois pode produzir insônia.

Em associação com a levodopa, observa-se um aumento das reações adversas desta, o que recomenda a redução de dose da levodopa. Recomenda-se não superar a dose diária de 10 mg para evitar o risco da aparição dos efeitos decorrentes da inibição da MAO-A.

Gravidez e lactação: Embora seja indicado para uma doença que atinge pessoas, em geral, acima dos 50 anos, o produto não deverá ser utilizado em mulheres grávidas ou na lactação, pois a segurança do cloridrato de selegilina não foi estabelecida nessas situações.

Uso pediátrico: A segurança e a eficácia em crianças não foram ainda estabelecidas.

Deve ser usado com cautela em nefropatas e hepatopatas.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

O cloridrato de selegilina potencializa os efeitos adversos da levodopa.

A dose de levodopa deve ser reduzida 2 a 3 dias após o início do cloridrato de selegilina.

Interage com meperidina, difenoxilato, outros opiáceos, levando a complicações severas.

É contra-indicado em associação com antidepressivos tricíclicos, carbamazepina, anfetaminas, bupropiona, amoxapina e inibidores seletivos da recaptação da serotonina.

Interage com:

- Alitretamina (antineoplásico), aumentando o risco de hipertensão ortostática.
- Beta-agonistas, aumentando o risco de taquicardia, agitação e tremores.
- Contraceptivos orais, aumentando a biodisponibilidade da selegilina (o que aumenta o risco de efeitos colaterais).
- Buspirona, causando crise hipertensiva.
- Dopamina, epinefrina e isoproterenol, causando aumento dos efeitos hipertensivos.
- Efedrina e pseudoefedrina, causando hipertensão severa, hipertermia e cefaléia.
- Ginseng, aumentando a agitação.
- Opióides, fenobarbital e derivados, causando depressão do SNC.
- Citalopram, sertralina, fluoxetina, fluvoxamina, paroxetina, fluoralamina, clovoxamina, dextfenfluramina, morfina/dextrometofano, femoxetina, fenfluramina

e imipramina causam toxicidade do SNC e síndrome serotoninérgica (hipertensão, hipertermia, espasmos musculares, alteração do estado mental).

- Tramadol, causando bloqueio no metabolismo das aminas.
- Triptofan, causando delírios e síndrome serotoninérgica.
- Brimovidina e fenilzina, por causarem crise hipertensiva.
- Isometileno, por causar cefaléia severa, crise hipertensiva e arritmias cardíacas.
- Ciproheptadina, por intensificar e prolongar os efeitos anticolinérgicos.

Interações alimentares: Doses altas de cloridrato de selegilina (20 mg) interagem com a tiramina presente em alguns alimentos (queijo, vinho, licores, peixes, leveduras, etc.), podendo causar crise hipertensiva súbita e severa.

O uso associado com agentes antidiabéticos pode aumentar a tolerância à glicose.

REAÇÕES ADVERSAS

O cloridrato de selegilina aumenta os efeitos colaterais doses-dependentes da levodopa, ou L-Dopa + carbidopa, que desaparecem após a diminuição da dose. Quando tiver sido determinada a dose ideal da levodopa, os efeitos colaterais do tratamento em associação serão, geralmente, inferiores àqueles da levodopa usada isoladamente.

Os efeitos colaterais do cloridrato de selegilina em monoterapia, até hoje assinalados, são: insônia, vertigens ou tonturas, cefaléias, náuseas e outras alterações gastrointestinais, hipotensão ortostática, agitação, bradicinesia, coréias, delírios, confusão, hipertensão, síncope, alterações miccionais e anorgasmia, fotossensibilidade.

Também podem causar o aumento dos movimentos involuntários, arritmia, episódios novos ou recorrentes de angina, edema periférico, queda de cabelos, perda de peso e nervosismo, ansiedade, obstipação, letargia, distonia, sudorese, sangramento gastrointestinal, asma, diplopia, visão noturna, anorexia, hipertrofia de próstata, dispnéia.

Alterações de exames laboratoriais:

- O cloridrato de selegilina pode causar aumento das enzimas hepáticas.
- Inibidores da monoaminoxidase interferem nos testes do ácido vanilmandélico (VMA): diminuem a excreção urinária do ácido vanilmandélico, produzindo valores falsamente baixos do ácido vanilmandélico.

POSOLOGIA E ADMINISTRAÇÃO

Em associação com a levodopa ou com as associações da levodopa + inibidores da descarboxilase: posologia inicial de 1/2 ou 1 comprimido ao dia, pela manhã ou em duas administrações diárias. Nos pacientes que apresentam discinesias, acinesias e fenômenos de flutuações ("on-off"), a dose de manutenção geralmente é de dois comprimidos ao dia. Após 2 a 3 dias, pode-se reduzir a dose de levodopa ou L-Dopa + carbidopa.

Para aqueles pacientes que recebem doses máximas de levodopa e inibidor periférico sem obter benefícios terapêuticos satisfatórios, agregar cloridrato de selegilina diretamente ao tratamento usual do paciente com o mesmo esquema anterior.

Caso haja excessivos efeitos adversos da L-Dopa, reduzir esta à medida que se chega à dose ótima de cloridrato de selegilina. Doses maiores que 10 mg/dia não são mais eficazes e podem levar a reações hipertensivas mediadas pela tiramina.

Uso pediátrico: Posologia e indicações para crianças abaixo de 12 anos ainda não foram estabelecidas.

Uso em idosos: Não há dados que justifiquem o reajuste de dose nessa população.

SUPERDOSE

Quadro clínico (sintomas e sinais):

Não foram relatados casos de superdose com cloridrato de selegilina, se usado de acordo com a posologia indicada.

Observou-se, porém, que alguns indivíduos expostos à dose de 600 mg/dia apresentaram agitação psicomotora e depressão. Sendo IMAO o produto, pode-se esperar quadro clínico semelhante aos dos outros IMAO.

Tratamento:

No caso deste evento, providenciar imediata hospitalização. Aconselha-se a indução do vômito somente se a ingestão for recente; então, realizar lavagem gástrica.

Os parâmetros hemodinâmicos, respiratórios e de temperatura corporal deverão ser monitorizados, desde que constatado o evento durante pelo menos 48 horas após o episódio haver ocorrido.

PACIENTES IDOSOS

Em pacientes idosos, efeitos colaterais ocorrem com maior frequência. Não há dados que justifiquem o reajuste de dose.

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA SÓ PODE SER VENDIDO COM RETENÇÃO DA RECEITA

MS - 1.1213.0266

Farmacêutico Responsável:
Alberto Jorge Garcia Guimarães
CRF-SP nº 12.449

Nº do lote, data de fabricação e validade:
vide cartucho.

Fabricado por:
TEVA Pharmaceutical Industries Ltd.
GRUPO TEVA - P.O. Box 3190
Kfar Sava 44 102 - Israel



Biosintética

Cuidados pela vida

Importado e embalado por:
BIOSINTÉTICA FARMACÊUTICA LTDA.
Av. das Nações Unidas, 22.428
São Paulo - SP

CNPJ nº 53.162.095/0001-06
Indústria Brasileira

BIOTEVA é Marca Registrada da
TEVA Pharmaceutical

Biosintética Assistance:
0800-0151036

www.biosintetica.com.br

Cód. Laetus nº 175

2074001