

# RILMENIDINA

La rilmenidina es un fármaco antihipertensivo de la familia de las oxazolinas, que actúa simultáneamente sobre los centros vasomotores bulbares y el sistema periférico, posee una mayor selectividad hacia los receptores de imidazolininas tipo I y II que hacia los alfa-2 adrenorreceptores cerebrales, lo que la distingue de los alfa-2 agonistas de referencia.

La estimulación de los receptores imidazolina-2 parece proveer un efecto neuroprotectivo en la isquemia cerebral, en tanto que su acción vasodilatadora es dosis-dependiente y radica en la reducción de la resistencia vascular periférica a través de la inhibición del sistema nervioso adrenérgico.

Cabe señalar que en el paciente hipertenso, tratado con 1 mg diario de rilmenidina, la duración de la acción farmacológica es más prolongada y la actividad antihipertensiva se mantiene de manera significativa durante las 24 horas consecutivas a la última toma. En cambio en la administración repetida, el estado de equilibrio se alcanza desde el 3er. día. La vigilancia a largo plazo de las tasas plasmáticas en el paciente hipertenso tratado durante 2 años, ha establecido que las concentraciones plasmáticas de rilmenidina siguen siendo estables.

Los estudios farmacocinéticos en pacientes de más de 70 años de edad muestran una semivida de eliminación de la rilmenidina de 12 horas; en el paciente insuficiente hepático la semivida de eliminación es de 11 horas, en tanto que en el paciente insuficiente renal a causa de su eliminación esencialmente renal, se observa un enlentecimiento de la eliminación del fármaco, proporcional al grado de la insuficiencia renal. En los pacientes con una insuficiencia renal severa o sea con un clearance de creatinina inferior a 15 ml/min, la semivida de eliminación es de unas 35 horas. Se presenta en forma de comprimidos.



## Dosis y Administración:

**Dosis recomendada:** 1 comprimido por día en una sola toma por la mañana.

Si la respuesta es insuficiente al cabo de un mes de tratamiento: se puede aumentar la dosis a 2 comprimidos diarios, en 2 tomas (1 comprimido por la mañana y otro por la noche), antes de las comidas.

La rilmenidina se puede administrar en los paciente hipertensos de edad avanzada y en los pacientes hipertensos diabéticos.

**Pacientes con insuficiencia renal (con un clearance de creatinina superior a 15 ml/min):** no se modifica la posología, salvo criterio médico. El tratamiento se debe continuar bajo control y vigilancia médica.

## Reacciones adversas:

En general los efectos adversos son raros y transitorios y los podemos clasificar en:

**Trastornos generales:** Frecuente: astenia, fatiga al realizar esfuerzos.

**Trastornos cardíacos:** Frecuente: palpitaciones.

**Trastornos vasculares:** Frecuente: frío en las extremidades, edemas. Poco frecuente: sofocos, hipotensión ortostática.

**Trastornos del sistema nervioso:** Frecuente: somnolencia.

**Trastornos del aparato reproductor y de la mama:** Frecuente: disfunción sexual. **Trastornos gastrointestinales:** Frecuente: gastralgias, boca seca, diarrea, estreñimiento. Poco frecuente: náuseas.

**Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo:** Frecuente: prurito, eritema.

**Trastornos músculo-esqueléticos:** Frecuente: calambres musculares.

**Trastornos psiquiátricos:** Frecuente: ansiedad, depresión, insomnio.

## Precauciones y advertencias:

Se advierte que no se debe interrumpir el tratamiento en forma brusca sino que se debe ir disminuyendo la posología progresivamente.

Como con otros antihipertensivos, en los enfermos que presentan antecedentes vasculares recientes como ictus, infarto de miocardio, se recomienda que la administración de rilmenidina esté bajo vigilancia médica.

Se debe evitar la ingesta de alcohol o medicamentos que lo contengan durante el tratamiento con rilmenidina, para evitar potenciar el efecto sedativo del alcohol.

Se advierte que no es necesario ninguna modificación de la dosis de rilmenidina en los pacientes con insuficiencia renal, cuyo clearance de creatinina es superior a 15 ml/min.

Se recomienda no administrar durante el embarazo y la lactancia.

Se debe tener en cuenta que en las dosis usuales de hasta 2 mg diarios de rilmenidina, no se detectaron alteraciones en la habilidad de operar máquinas o conducir vehículos.

Se requiere ser precavido en el empleo de rilmenidina con baclofeno porque se incrementa el efecto antihipertensivo, por lo que se requiere controlar la presión arterial y si es necesario adaptar la dosis. Se debe evitar la interrupción brusca del tratamiento con rilmenidina a los pacientes tratados con beta-bloqueantes.

No se aconseja la administración de rilmenidina con aquellos medicamentos que provocan torsiones de puntas (excepto la sultoprida), como ser: antiarrítmicos de clase IA (quinidina, hidroquinidina, disopiramida) y antiarrítmicos de clase III (amiodarona, dofetilida, ibutilida, sotalol).

La administración de rilmenidina con otros depresores del SNC, como los derivados morfínicos (analgésicos, antitusivos y tratamientos de sustitución), las benzodiazepinas, otros ansiolíticos aparte de las benzodiazepinas, los hipnóticos, los neurolepticos, los antihistamínicos H1 sedantes, los antidepresores sedantes (amitriptilina, doxepina, mianserina, mirtazapina, trimipramina), otros antihipertensivos centrales, baclofeno, talidomida, pizotifeno, indoramina producen un aumento de la depresión central.

## Interacciones:

No se debe asociar rilmenidina con sultoprida porque hay riesgo aumentado de trastornos del ritmo ventricular, especialmente torsiones de punta. Se debe evitar la administración conjunta con los inhibidores de MAO.

La rilmenidina interactúa con amineptina, amoxapina, butriptilina, carpipramina, clozaprina, desipramina, dibenzepina, dosulepina, fenelzina, fentermina, furazolidona, imipraminóxido, iprindol, isocarboxazida, isoniazida, lofepramina, noxiptilina, opipramol, procarbazona y tianeptina.

La asociación de rilmenidina con bisoprolol, carvedilol o metoprolol, utilizados en la insuficiencia cardíaca, produce una disminución central del tono simpático y un efecto vasodilatador de los antihipertensores centrales.

La rilmenidina puede ser perjudicial en los casos de insuficiencia cardíaca tratada con betabloqueantes y vasodilatadores.

No se aconseja la administración de rilmenidina con aquellos medicamentos que provocan torsiones de puntas (excepto la sultoprida), como ser: antiarrítmicos de clase IA (quinidina, hidroquinidina, disopiramida) y antiarrítmicos de clase III (amiodarona, dofetilida, ibutilida, sotalol).

También está contraindicada la asociación de rilmenidina con los neurolépticos: fenotiazínicos (clorpromazina, levomepromazina, tioridazina), benzamidas (amisulprida, sulpirida, tiaprida), butirofenonas (droperidol, haloperidol), otros neurolépticos (pimozide).

El uso de rilmenidina con medicamentos como bepridilo, cisaprida, difemanil, eritromicina IV, halofantrina, mizolastina, moxifloxacino, pentamidina, espiramicina IV, vincamina IV producen un riesgo aumentado de trastornos del ritmo ventricular, especialmente de torsiones de puntas, por lo tanto estos pacientes deben estar bajo vigilancia clínica y electrocardiográfica.

Se debe tener en cuenta que la rilmenidina con los alfabloqueantes produce un incremento del efecto hipotensor y un riesgo aumentado de la hipotensión ortostática. Con la amifostina: aumento del efecto antihipertensivo. Con los corticoides, excepto la hidrocortisona utilizada como tratamiento sustitutivo en la enfermedad de Addison: disminución del efecto antihipertensivo (retención hidrosalina de los corticoides) y con los neurolépticos o los antidepresivos imipramínicos: efecto antihipertensivo y riesgo aumentado de hipotensión ortostática mayor (efecto aditivo).

## Contraindicaciones:

No se debe administrar este medicamento en los pacientes con hipersensibilidad al principio activo o alguno de sus componentes. Está contraindicado su uso en aquellos pacientes con insuficiencia renal severa que tengan un clearance de la creatinina < 15 ml/min. Tampoco se debe administrar este fármaco en los estados depresivos graves. Está contraindicada la ingesta de alcohol en los pacientes tratados con rilmenidina.

## Sobredosificación:

Ante una sobredosificación se puede observar hipotensión marcada y trastornos en la vigilia. Ante esta situación se realiza lavado gástrico y en caso de ser necesario, se administra un simpaticomimético y tratamiento de apoyo sintomático. Se aconseja, ante una eventual sobredosis, concurrir al hospital o centro asistencial más cercano.

| NOMBRE   | PRINCIPIO ACTIVO | PRESENTACION | LABORATORIO |
|----------|------------------|--------------|-------------|
| HYPERIUM | Rilmenidina      | Comprimidos  | SERVIER     |