

COMPOSICIÓN

Cada comprimido contiene:

Candesartán cilexetilo 16 mg
Amlodipina 5 mg
Excipientes, c.s.

PROPIEDADES

Es un medicamento antihipertensivo que contiene la asociación de dos sustancias (candesartán cilexetilo y amlodipina) que han demostrado ser sumamente eficaces en la regulación de la presión arterial.

El candesartán cilexetilo es un antagonista de la angiotensina II. La angiotensina II es la hormona vasoactiva primaria del sistema renina-angiotensina-aldosterona y desempeña un papel significativo en la fisiopatología de la hipertensión y otras alteraciones cardiovasculares. Tiene también un papel importante en la patogénesis de la hipertrofia y daño del órgano blanco. Los principales efectos fisiológicos de la angiotensina II, como la vasoconstricción, la estimulación de la aldosterona, la regulación de la homeostasis de la sal y del agua y la estimulación del crecimiento de la célula, son mediados vía el receptor tipo 1 (AT1). Es una pro-droga adecuada para uso oral. Es rápidamente convertida a la droga activa, candesartán, por hidrólisis del éster durante la absorción en el tracto gastrointestinal. Es un antagonista de los receptores de la angiotensina II, selectivo para los receptores (AT1), con una unión fuerte y una disociación lenta del receptor. No tiene actividad agonista. No inhibe la ECA (enzima convertidora de la angiotensina), que convierte la angiotensina I en angiotensina II y degrada la bradixinina. Ya que no tiene efecto sobre la degradación de la bradixinina, los antagonistas del receptor de la angiotensina II difícilmente estén asociados con tos.

La amlodipina es un bloqueador de los canales lentos de calcio de tipo dihidropiridina que impide la entrada del calcio a la célula muscular lisa de los vasos sanguíneos que es donde la sustancia tiene mayor selectividad. Esto trae como consecuencia vasodilatación con caída de la resistencia vascular periférica lo que incide en la disminución de la presión arterial y de la fuerza que se opone al vaciado cardíaco (post-carga) facilitando el mismo; lo cual disminuye el trabajo del corazón, su consumo metabólico y mejora el equilibrio oferta demanda de oxígeno en el paciente anginoso. También provoca relajación del músculo liso de las coronarias aumentando el flujo sanguíneo miocárdico favoreciendo tanto en la angina de esfuerzo como en la angina por vasoespasma coronario.

FARMACOCINÉTICA

El candesartán cilexetilo es una prodroga que rápidamente se hidroliza a la droga activa durante su absorción en el tracto gastrointestinal, se une altamente a proteínas plasmáticas (más del 99%) y su vida media es de aproximadamente 9 horas. Se elimina principalmente vía urinaria y biliar sin sufrir metabolismo hepático. No requiere ajuste de dosis en aquellos pacientes con alteraciones renales leves a moderadas o hepáticas. Además, puede ser ingerido con o sin alimentos.

La amlodipina alcanza su pico máximo en plasma entre las 6 y 12 horas luego de haberse administrado. Su biodisponibilidad es de 60-90% y no se altera en presencia de alimentos. Su eliminación plasmática es bifásica presentando una vida media de 30-50 horas. El estado de equilibrio se logra en 7-8 días de dosis consecutivas. La insuficiencia renal no altera sus niveles. La insuficiencia hepática puede hacer que sus niveles se incrementen y sea necesario reducir las dosis pues se metaboliza en el hígado. El efecto hipotensor se mantiene al menos 24 horas y es mayor a medida que es mayor la hipertensión. Sujetos normotensos tienen poca o ninguna modificación de la presión arterial.

TOXICOLOGÍA

No hay evidencias de mutagenicidad, clastogenicidad y carcinogenicidad.

INFORMACIÓN CLÍNICA

INDICACIONES

Hipertensión arterial en sus diversas gradaciones, así como para el manejo del paciente con hipertensión arterial asociada a cardiopatía isquémica.

CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a cualquiera de los componentes del producto. También está contraindicado en el embarazo y lactancia (ver USO EN EMBARAZO Y LACTANCIA).

En cuanto a la amlodipina está contraindicado en pacientes con hipersensibilidad a las dihidropiridinas.

EFFECTOS INDESEABLES

En estudios clínicos controlados con candesartán, los efectos adversos fueron leves y transitorios y comparables al placebo. La incidencia general de reacciones adversas no se asoció con la dosis, edad o sexo. La interrupción del tratamiento debido a los efectos adversos fue similar en ambos grupos con esta sustancia (2,4%) y placebo (2,6%).

En cuanto a la amlodipina es bien tolerado, por lo cuál los efectos adversos de éste son, en general, transitorios y leves. Entre ellos están las alteraciones cardiovasculares (edemas, sofocos), alteraciones neurológicas (cefaleas, mareos, somnolencia) y alteraciones osteomusculares (fatiga). No se han observado anomalías de laboratorio clínicamente significativas relacionadas con esta sustancia.

ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

Se recomienda administrar con precaución a pacientes con estenosis arterial renal bilateral o de la arteria renal en un riñón solitario ya que podrían aumentar los valores de urea y creatinina sérica, tal como ocurre con otras drogas que afectan el sistema renina-angiotensina-aldosterona. De la misma manera, se aconseja administrar dosis menores o corregir la depleción severa del volumen intravascular en aquellos pacientes que pueden sufrir hipotensión sintomática.

Debido a la amlodipina, debe emplearse con precaución en pacientes con alteración de la función hepática, debido a que la vida media de eliminación en éstos pacientes se prolonga y no se han establecido recomendaciones de dosificación.

COMPRIMIDOS

ANTIHIPERTENSIVO

USO EN EMBARAZO, LACTANCIA Y EN NIÑOS

No administrar durante el embarazo ya que puede afectar el desarrollo del sistema renina-angiotensina-aldosterona del feto. A pesar de que se desconoce si se excreta por leche materna, se recomienda no administrar durante la lactancia. Su eficacia y seguridad no ha sido establecida en niños.

INTERACCIONES

No se observaron interacciones con hidroclorotiazida, warfarina, digoxina, anticonceptivos orales (etinilestradiol/levonorgestrel), glibenclamida y nifedipina.

En cuanto a la amlodipina, puede potenciar el efecto y/o toxicidad de la ciclosporina, la ergotamina o la teofilina.

SOBREDOSIS

Basado en consideraciones farmacológicas, las principales manifestaciones de una sobredosis probablemente sean hipotensión sintomática y vértigo. Si se produjera hipotensión sintomática, debe ser instituido un tratamiento sintomático y la monitorización de los signos vitales. El paciente debe ser acostado con las piernas elevadas. Si esto no es suficiente, se debe aumentar el volumen de plasma por infusión de, por ejemplo, solución salina isotónica. Si las medidas mencionadas no son suficientes, pueden ser administradas drogas simpaticomiméticas. No es probable eliminar por hemodiálisis.

USO Y DOSIS

La dosis recomendada es un comprimido por día.

VÍA DE ADMINISTRACIÓN

Oral.

Antes de consumir este o cualquier otro medicamento, debe siempre consultar a su médico.

En caso de un marcado efecto secundario, sea este por sobredosis o reacción particular, acuda inmediatamente a su médico.

INFORMACIÓN FARMACÉUTICA

DURACIÓN DE ESTABILIDAD

Verificar fecha de vencimiento señalada en el envase.

PRECAUCIONES ESPECIALES PARA SU CONSERVACIÓN

Conservar a una temperatura menor o igual a los 30°C.

PRESENTACIÓN

Caja conteniendo 3 tirillas de 10 comprimidos.

NOTA IMPORTANTE

Este producto se encuentra envasado y protegido en una adecuada y rigurosa laminación, especialmente diseñada para evitar su exposición con la luz y humedad, descartando además que por descuidos involuntarios los niños puedan acceder al mismo.

Registro Industrial No. 14109

Registro Sanitario No. 2012-1018

Venta por receta médica.

Mantener fuera del alcance de los niños.

Fabricado por Ethical Pharmaceutical, S.R.L.
de República Dominicana.