

COMPOSICIÓN:	Tableta	Tableta
Amlodipina besilato equivalente a Amlodipina	5 mg	10 mg
Excipientes, c.s.p.	1 Tableta	1 Tableta

DESCRIPCIÓN:

Pistarme® contiene amlodipina, un fármaco utilizado para tratar la hipertensión y la enfermedad de las arterias coronarias. Es un bloqueador de los canales de calcio que pertenece al grupo de las dihidropiridinas y trabaja parcialmente por la vasodilatación.

INDICACIONES:

Pistarme® está indicado como tratamiento inicial de primera elección en la hipertensión arterial y puede usarse como monoterapia para el control de la presión arterial sanguínea en la mayoría de los pacientes. Aquellos enfermos que no estén adecuadamente controlados con un solo antihipertensivo pueden beneficiarse al agregar amlodipina, el cual se ha utilizado en combinación con diuréticos tiazídicos, agentes bloqueadores de adrenorreceptores beta, bloqueadores alfa, o inhibidores de la enzima convertidora de angiotensina. La amlodipina también está indicada para reducir el riesgo de enfermedad coronaria fatal y de infarto al miocardio no fatal y para reducir el riesgo de enfermedad vascular cerebral, así como para reducir el riesgo de revascularización coronaria y la necesidad de hospitalización debido a angina en pacientes con enfermedad arterial coronaria y para el tratamiento de primera elección en la isquemia del miocardio, por obstrucción fija (angina estable) y/o (angina variante de Prinzmetal) de los vasos coronarios.

FARMACOCINÉTICA Y FARMACODINAMIA:

Después de la administración oral la amlodipina es bien absorbida, con niveles sanguíneos máximos entre 6 y 12 horas posteriores a la administración de la dosis. Se ha estimado que la biodisponibilidad absoluta es de 64 a 80%. El volumen de distribución es de aproximadamente 21 L/kg. La absorción de la amlodipina no se afecta por el consumo de alimentos. La vida media de eliminación plasmática terminal es de alrededor de 35-50 horas y es consistente con una dosificación de una vez al día. Los niveles en estado estable plasmático se alcanzan al final de 7-8 días de su administración consecutiva. La amlodipina se metaboliza ampliamente en el hígado a metabolitos inactivos, excretándose en la orina 10% del compuesto original y 60% de los metabolitos. Los estudios in vitro han demostrado que aproximadamente 97.5% de la amlodipina circulante está unida a las proteínas plasmáticas. La amlodipina es un bloqueador de los canales de calcio angioselectivo e inhibe el movimiento de iones de calcio al músculo liso vascular y músculo cardíaco. La habilidad de los músculos lisos y cardíacos de contrarrestar dependen del movimiento de iones de calcio extracelulares al dentro de estas células por canales iónicos específicos. La amlodipina inhibe el influjo de iones de calcio sobre la membrana plasmática, con efecto mayor en las células del músculo liso vascular. Esto causa la vasodilatación y baja la resistencia vascular periférica, que en su turno baja la presión de sangre. Su efecto en el músculo cardíaco también previene la contracción excesiva de las arterias coronarias. Se puede detectar efectos inotrópicos negativos in vitro, pero aún no han sido vistos en animales intactos a dosis terapéuticas. Entre los dos estereoisómeros R(+) y S(-) el isómero (-) se ha sido reportado tener más eficacia que el isómero (+). La concentración de calcio en el suero no se afecta a la amlodipina por ser un bloqueador de canales de calcio. La amlodipina también inhibe las corrientes de los Cav1.3 canales de tipo L en la zona glomerular en la glándula suprarrenal. Se ha encontrado que la amlodipina también actúa como una antagonista del receptor del mineralcorticoides o como una antagonista de la aldosterona.

REACCIONES ADVERSAS:

La amlodipina es bien tolerada. En estudios clínicos controlados con placebo, que incluyeron pacientes con hipertensión o angina, las reacciones secundarias más comúnmente observadas fueron: bostornos, fatiga, edema, cefalea, mareos, dolor abdominal, náuseas, palpitaciones y somnolencia. En estos estudios clínicos no se observaron modificaciones importantes que pudieran relacionarse con la administración de amlodipina. Reacciones secundarias que se han observado menos comúnmente durante su comercialización incluyen: sequedad bucal, diaforesis, astenia, dolor de espalda, malestar general, dolor, aumento / disminución del peso corporal, hipotensión, síncope, hipertonia, hipoestesia / parestesia, neuropatía periférica, temblor, ginecomastia, alteración en los hábitos intestinales, dispepsia (incluyendo gastritis), hiperplasia gingival, pancreatitis, vómito, hiperglucemia, artralgia, calambres musculares, migraja, púrpura, trombocitopenia, impotencia, insomnio, cambios en el estado de ánimo, tos, disnea, rinitis, alopecia, hipopigmentación, urticaria, alteración del gusto, tinnitus, poliaquiuria, desorden de la micción, nicturia, vasculitis, alteraciones visuales y leucopenia. Rara vez pueden ocurrir reacciones alérgicas, incluyendo prurito, rash, angioedema y eritema multiforme.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

Dado que la vasodilatación inducida por la amlodipina es gradual al comienzo, raramente se ha informado hipotensión

aguda luego de la administración oral del medicamento. Sin embargo, se debe tener precaución al administrar amlodipina, al igual que con cualquier otro vasodilatador periférico, particularmente en pacientes con estenosis aórtica severa. Uso en pacientes con insuficiencia cardíaca congestiva: en general, los bloqueadores de los canales de calcio deben ser usados con precaución en pacientes con insuficiencia cardíaca. Mayor riesgo de angina y/o infarto de miocardio: raramente algunos pacientes, particularmente aquellos con enfermedad arterial coronaria obstructiva severa, han desarrollado frecuencia aumentada-documentada, duración y/o severidad de la angina o el infarto de miocardio al comenzar la terapia con bloqueadores de los canales de calcio o al aumentar la dosis. Se desconoce el mecanismo de este efecto. Uso en pacientes con deterioro de la función hepática: como con todos los antagonistas de los canales de calcio, la vida media de la amlodipina está prolongada en los pacientes con deterioro de la función hepática y no se han establecido aún las dosis recomendadas. Por lo tanto esta droga debe ser administrada con precaución en estos pacientes.

CONTRAINDICACIONES:

La única contraindicación absoluta para la amlodipina es en pacientes con hipersensibilidad conocida a las dihidropiridinas. Sin embargo, hay varias contraindicaciones relativas donde se debe tener cuidado en usarla: en pacientes con choques cardiogénicos, en que los ventrículos del corazón no pueden bombear bastante sangre, los bloqueadores de canales de calcio empeoran la situación por prevenir el flujo de iones calcio a las células cardíacas, que son necesarios para que el corazón bombee. En pacientes con angina no estable salvo a la angina Prinzmetal la amlodipina puede causar un aumento reflexivo de la contractilidad cardíaca.

INTERACCIONES:

Concentración plasmática aumentada por: inhibidores de la proteasa, antifúngicos azólicos, macrólidos como la eritromicina o la claritromicina, verapamilo o diltiazem.

Concentración plasmática reducida por: rifampicina, hierba de San Juan, dexametasona, fenobarbital, fenitoina, carbamazepina, nevirapina y rifabutina.

Potencia efecto antihipertensor de: agentes bloqueantes del receptor β -adrenérgico, inhibidores de la ECA, alfa-1-bloqueantes y diuréticos.

Aumenta las concentraciones plasmáticas de: tacrolímús, ciclosporina y simvastatina.

RESTRICCIONES DE USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA:

No se ha determinado la inocuidad de la amlodipina en el embarazo o la lactancia en humanos, por lo que no se recomienda su uso.

SOBREDOSIFICACIÓN Y TRATAMIENTO:

Aunque es raro, la sobredosis de amlodipina puede resultar en el ensanchamiento de los vasos sanguíneos, hipotensión severa y taquicardia. La toxicidad generalmente se maneja con el reemplazo de líquidos y monitorizar el electrocardiograma, los signos vitales, la función del sistema respiratorio, los niveles de glucosa, la función renal, los niveles de electrolitos y la producción de orina.

DOSIFICACIÓN Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN:

Vía de administración: oral.

Adultos: inicialmente 5 mg /día una vez al día con una dosis máxima de 10 mg /día. Los efectos antihipertensivos máximos pueden tardar varias semanas en establecerse plenamente. En los pacientes con insuficiencia hepática la dosis inicial se debe reducir en un 50%.

Ancianos: la dosis inicial debe ser de 2.5 mg una vez al día, ajustándose posteriormente en función de la respuesta obtenida.

PRESENTACIONES:

Pistarme 5 mg:

Caja conteniendo 3 blísteres de 10 tabletas.

Caja conteniendo 10 blísteres de 10 tabletas.

Pistarme 10 mg:

Caja conteniendo 3 blísteres de 10 tabletas.

Caja conteniendo 10 blísteres de 10 tabletas.

LEYENDA DE PROTECCIÓN:

Manténgase fuera del alcance de los niños.

Venta por receta médica.

Consérvese en un lugar fresco y seco entre 25 – 30 °C. Protéjase de la luz.



Fabricante y Titular:

LABORATORIO LAPROFAR, S.R.L.

C/2da. Av. Los Restauradores No.1,
Sabana Perdida, Santo Domingo Norte.