**TEMISAR A**

**TELMISARTAN – AMLODIPINO**

Venta Bajo Receta Comprimidos Bicapa

Industria Paraguaya V.A.: Oral

TEMISAR A 40/5®

TELMISARTAN - AMLODIPINO

FORMULA:

Cada comprimido bicapa contiene:

Telmisartán.....................................................................................................40 mg.

Amlodipino (Equiv. a 6,934 mg de Amlodipino Besilato)................................5 mg.

Excipientes........................................................................................................c.s.p.

TEMISAR A 40/10®

TELMISARTAN - AMLODIPINO

FORMULA:

Cada comprimido bicapa contiene:

Telmisartán.....................................................................................................40 mg.

Amlodipino (Equiv. a 13,868 mg de Amlodipino Besilato)............................10 mg.

Excipientes........................................................................................................c.s.p.

TEMISAR A 80/5®

TELMISARTAN - AMLODIPINO

FORMULA:

Cada comprimido bicapa contiene:

Telmisartán.....................................................................................................80 mg.

Amlodipino (Equiv. a 6,934 mg de Amlodipino Besilato)................................5 mg.

Excipientes........................................................................................................c.s.p.

TEMISAR A 80/10®

TELMISARTAN - AMLODIPINO

FORMULA:

Cada comprimido bicapa contiene:

Telmisartán.....................................................................................................80 mg.

Amlodipino (Equiv. a 13,868 mg de Amlodipino Besilato)............................10 mg.

Excipientes........................................................................................................c.s.p.

ACCION TERAPEUTICA:

Antihipertensivo .

MECANISMO DE ACCION Y DATOS FARMACOCINETICOS:

Esta asociación de fármacos antihipertensivos con mecanismos complementarios para controlar la presión arterial en pacientes con hipertensión esencial: Un antagonista de los receptores de la angiotensina II, Telmisartán y un inhibidor de los canales del calcio dihidropiridínico, Amlodipino. La asociación de estos componentes tiene un efecto antihipertensivo aditivo, reduciendo la presión arterial en mayor grado que la administración única de cada uno de los componentes.

Telmisartán: Es un antagonista específico de los receptores de la angiotensina II (tipo At1), eficaz por vía oral. Telmisartán desplaza a la angiotensina II, con una afinidad muy elevada, de su lugar de unión al receptor subtipo AT1, el cual es responsable de las conocidas acciones de la angiotensina II. Telmisartán no presenta ninguna actividad agonista parcial en el receptor AT1, tiene una larga duración y no muestra una afinidad destacable por otros receptores, incluyendo los AT2 y otros receptores AT menos caracterizados. Los niveles plasmáticos de aldosterona son disminuidos por Telmisartán, además este activo no inhibe la renina plasmática humana ni bloquea los canales iónicos. Telmisartán no inhibe la enzima convertidora de la angiotensina por lo tanto, no es de esperar una potenciación de los efectos adversos. Después de la administración de la primera dosis, el inicio de la actividad antihipertensiva se produce gradualmente en 3 horas y la reducción máxima de la presión se alcanza generalmente a las 4-8 semanas de iniciar el tratamiento manteniéndose durante un largo plazo. En pacientes hipertensos, Telmisartán reduce la presión arterial tanto sistólica como diastólica sin afectar a la frecuencia de pulso. Después de la interrupción brusca del tratamiento, la presión arterial retorna gradualmente a los valores pre-tratamiento durante un periodo de varios días, sin evidencia de hipertensión de rebote.

Amlodipino: Es un inhibidor del flujo de iones de calcio del grupo de las dihidropiridinas e inhibe el flujo transmembrana de los iones de calcio hacia el músculo cardíaco y el músculo liso vascular. El mecanismo de acción antihipertensivo del Amlodipino se basa en un efecto relajante directo sobre el músculo liso vascular que conduce a reducciones de la resistencia vascular periférica y de la presión arterial. Amlodipino es vaso selectivo, con un mayor efecto en células del músculo liso vascular que sobre células del músculo cardíaco. Debido al comienzo lento de la acción, la hipotensión aguda no es una característica de la administración de Amlodipino.

Propiedades farmacocinéticas

La absorción del Telmisartán es rápida a pesar de que la cantidad absorbida varía; la biodisponibilidad es del 50%. Cuando se ingiere con alimentos, la reducción en la curva del área bajo la curva frente al tiempo varía entre un 6% y un 19% aproximadamente. A las 3 horas de la administración, las concentraciones plasmáticas son similares tanto si Telmisartán se toma en ayunas o con alimentos.

Amlodipino se absorbe bien con niveles plasmáticos máximos entre 6-12 horas tras la administración, con una biodisponibilidad de 64% a 80% no siendo afectada por la ingesta de alimentos.

La distribución de Telmisartán es elevada en proteínas plasmáticas (>99,5%) principalmente a la albúmina y a la glucoproteína alfa-1 ácida teniendo un volumen de distribución de 500 L. Así mismo el volumen de distribución de Amlodipino es de 21 L/Kg y se une en un 97,5% a proteínas plasmáticas.

Biotransformación: Telmisartán se metaboliza por conjugación para formar el glucurónido del compuesto original. Amlodipino se metaboliza ampliamente en el hígado a metabolitos inactivos.

Eliminación: Telmisartán se caracteriza por una declinación farmacocinética biexponencial con una semivida de eliminación terminal de >20 horas. Se excreta casi exclusivamente en las heces principalmente como fármaco inalterado. La eliminación plasmática de Amlodipino es bifásica, con una semivida de eliminación terminal de aproximadamente 30 - 50 horas. La excreción es por vía urinaria.

INDICACIONES TERAPEUTICAS:

Tratamiento de la hipertensión esencial en adultos cuya presión arterial no puede controlarse adecuadamente solo con Amlodipino.Como terapia sustitutiva cuando la monoterapia con Telmisartán y Amlodipino se administran por separado.

POSOLOGIA:

La dosis recomendada es un comprimido al día.

La dosis de inicio usual es de 40 mg/5 mg una vez al día y la dosis máxima recomendada es de 80 mg/10 mg, un comprimido por día y esta indicado para tratamientos de larga duración.

Terapia de combinación: Temisar A 80 mg/5 mg, comprimidos puede administrarse a pacientes cuya presión arterial no puede controlarse adecuadamente con Temisar A 40 mg/5 mg.

Antes de cambiar a la combinación a dosis fijas se recomienda la titulación de la dosis con los componentes individuales (por ej. Amlodipino y Telmisartán). Cuando sea clínicamente apropiado se puede considerar el cambio directo de monoterapia a combinación a dosis fijas

Los pacientes tratados con 10 mg de Amlodipino que experimenten cualquier reacción adversa limitante de dosis tal como edema, pueden cambiar a Temisar A 40 mg/5 mg una vez al día, reduciendo la dosis de Amlodipino sin reducir la respuesta antihipertensiva global esperada.

Terapia sustitutiva: Los pacientes que reciban comprimidos de Telmisartán y Amlodipino por separado, pueden en su lugar tomar comprimidos de Temisar que contengan las mismas dosis de estos componentes en un comprimido una vez al día, por ej. para mejorar la comodidad o el cumplimiento.

Forma de administración: Puede tomarse con o sin alimentos. Se recomienda tomar con un poco de liquido.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad a los principios activos. Segundo y tercer trimestre del embarazo. Trastornos obstructivos biliares e insuficiencia hepática grave. Shock (incluyendo shock cardiogénico, hipotensión grave, obstrucción del flujo de salida del ventrículo izquierdo, insuficiencia cardíaca hemodinámicamente inestable tras infarto de miocardio).

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

Debido a que el Termisartán se elimina por la bilis, los pacientes con trastornos obstructivos biliares o insuficiencia hepática presentan un aclaramiento reducido, además la vida media del Amlodipino se prolonga en este tipo de pacientes. En pacientes con insuficiencia renal se recomienda la monitorización periódica de los niveles séricos de potasio y creatinina. Telmisartán y Amlodipino no son dializables. En pacientes con depleción de volumen y/o sodio, ocasionada por un tratamiento intensivo con diuréticos, por una dieta restrictiva de sal, por diarreas o vómitos puede producirse una hipotensión sintomática, especialmente después de la primera dosis. Como consecuencia de la inhibición del sistema renina-angiotensina-aldosterona se puede presentar hipotensión y cambios de la función renal en individuos susceptibles, especialmente si se utilizan en combinación con otros medicamentos que afecten a este sistema, también se manifiesta hiperpotasemia que puede ser mortal en pacientes ancianos, con insuficiencia renal, diabéticos y pacientes tratados de forma concomitante con otros medicamentos que puedan aumentar los niveles de potasio. Pacientes que presentan aldosterismo primario no responden al uso de antihipertensivos que actúan sobre el sistema renina-angiotensina por lo que no se recomienda el uso del Telmisartán.

REACCIONES ADVERSAS Y EFECTOS COLATERALES:

Las reacciones adversas más comunes incluyen mareos y edema periférico. Además pueden aparecer somnolencia, migraña, vértigo, bradicardia, palpitaciones, rubor, hipotensión ortostática, tos, dolor abdominal, prurito, espasmos musculares, disfunción eréctil, fatiga y aumento de enzimas hepáticas.

INTERACCIONES CON ALIMENTOS Y MEDICAMENTOS:

El efecto hipotensor puede verse incrementado por el uso concomitante de otros medicamentos antihipertensivos (como Baclofeno, Amifostina, neurolépticos o antidepresivos) y puede agravarse por el consumo de alcohol. No se recomienda el uso concomitante con diuréticos ahorradores de potasio (Espironolactona, Esplerenona, Triamtereno o Amilorida) o suplementos de potasio. Se han descrito aumentos reversibles de las concentraciones de Litio en suero. Se requiere precaución en la asociación con medicamentos antiinflamatorios no esteroideos. El Ramipril aumenta hasta 2,5 veces la AUC0-24 y Cmax de Ramipril y Ramiprilato.

El uso concomitante de Amlodipino con inhibidores CYP3A4 (Eritromicina y Diltiazem) aumenta su concentración plasmática asi como inhibidores del CYP3A4 (Ritonavir, Ketoconazol, Itraconazol), aumentan la concentración plasmática del Amlodipino. Así mismo el uso concomitante de inductores del CYP3A4 (Rifampicina, Yerba de San Juan) puede producir una disminución en la concentración plasmática de Amlodipino.

El uso de corticosteroides a nivel sistémico reduce el efecto hipotensor.

SOBREDOSIFICACION:

Ante una sobredosis son de esperar hipotensión, taquicardia o bradicardia, mareo, aumento de la creatinina sérica y fallo renal agudo. También puede darse vasodilatación periférica excesiva y posible taquicardia refleja. Ante cualquier síntoma el tratamiento debe ser sintomático y de soporte.

En caso de sobredosis o ingesta accidental, consultar al Servicio de Toxicología del Hospital de EMERGENCIAS MEDICAS Tel.: 220-418 o el 204-800 (int. 011).

RESTRICCIONES DE USO:

Uso profesional.

CONSERVACION:

Almacenar a temperatura entre 15° y 30 °C.

PRESENTACIONES:

Caja conteniendo 30 comprimidos bicapa.

Estos medicamentos deben ser usados únicamente por prescripción médica y no podrán repetirse sin nueva indicación del facultativo.

En caso de uso de estos medicamentos sin prescripción médica, la ocurrencia de efectos adversos e indeseables será de exclusiva responsabilidad de quien lo consuma.

Si Ud. es deportista y está sometido a control de doping, no consuma estos productos sin consultar a su médico.

Director Técnico: Q.F. Laura Ramírez

Reg. Prof. Nº 4.142

Autorizado por D.N.V.S. del M.S.P. y B.S.

MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS