

## XATEROL

### Amlodipina

#### Composición:

Cada comprimido de Xaterol® contiene:

Amlodipina (como besilato).....5,0 mg.  
Excipientes.....c.s.

Cada comprimido de Xaterol® Forte contiene:

Amlodipina (como besilato) .....10,0 mg.  
Excipientes.....c.s.

#### Mecanismo de acción:

La amlodipina es un calcioantagonista (bloqueador de los canales lentos del calcio o antagonista de los iones calcio), del grupo de las dihidropiridinas, que impide el paso de los iones calcio a través de la membrana al músculo liso y cardiaco. La acción antihipertensiva de la amlodipina es debida a un efecto relajador directo del músculo liso vascular, causando una reducción de la resistencia periférica y la tensión arterial. En pacientes con angina de esfuerzo reduce la resistencia periférica total (poscarga) y, en consecuencia, el consumo miocárdico de oxígeno. En la angina vasoespástica (angina variante de Prinzmetal) reduce la constricción vascular restaurando el flujo en las arterias coronarias. La administración crónica tampoco produjo aumentos en la frecuencia cardiaca en pacientes normotensos con angina. La amlodipina no se ha relacionado con ningún efecto metabólico adverso, ni con alteraciones de los lípidos plasmáticos, y es adecuada para su administración a enfermos con asma, diabetes y gota.

#### Farmacocinética:

La amlodipina se absorbe bien, alcanzando concentraciones máximas en la sangre a las 6 a 12 hs de la administración. La absorción no se modifica con la ingesta de alimentos. La biodisponibilidad absoluta ha sido estimada entre el 64 y el 80%. El 93% de la droga circula unida a proteínas plasmáticas. La semivida plasmática de eliminación final es de unas 35 a 50 hs. Después de la administración continuada, se alcanzan concentraciones plasmáticas estables a los 7 a 8 días. La amlodipina se metaboliza ampliamente en el hígado a metabolitos inactivos, eliminándose por la orina hasta el 10% del

fármaco inalterado y el 60% de los metabolitos.

En los pacientes con cirrosis la semivida de eliminación se prolonga de modo significativo. La farmacocinética de la amlodipina no se afecta de forma significativa por la insuficiencia renal. En los ancianos la AUC aumenta en un 40-60% y el

aclaramiento plasmático aumenta igualmente de forma significativa.

#### Indicaciones:

Tratamiento de la hipertensión arterial en monoterapia o asociada a otras medicaciones antihipertensivas. Tratamiento de la angina estable o de la angina vasoespástica (angina variante de Prinzmetal).

#### Posología:

La dosificación debería ser ajustada de acuerdo con la necesidad de cada paciente. En general, la titulación debería realizarse en 7 a 14 días, para que el médico pueda asegurar totalmente la respuesta del paciente a cada nivel de dosis.

Tratamiento de la hipertensión:

*Adultos:* 5 mg a 10 mg/día.

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

*Niños:* la seguridad y eficacia de la amlodipina no ha sido establecida.

Tratamiento de la angina estable o de la angina vasoespástica:

*Adultos:* 5 mg a 10 mg/día. La dosis de mantenimiento suele ser de 10 mg/día. En los sujetos con insuficiencia hepática la dosis inicial debe ser de 2.5 mg.

Los pacientes con insuficiencia renal no requieren reajustes de dosis.

#### Modo de uso:

Este producto se debe administrar por vía oral, independientemente o no de los alimentos.

#### Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a la amlodipina o a otros antagonistas de los canales de calcio.

#### Reacciones adversas:

Se han observado reacciones adversas ligeras o moderadas, casi siempre relacionadas con los efectos vasodilatadores periféricos del fármaco. Las jaquecas y el edema son los dos efectos secundarios más frecuentes. También pueden aparecer debilidad, mareos, sofocos y palpitaciones. En la experiencia postmarketing, con amlodipina, se han comunicado ictericia y elevación de las transaminasas, consistentes con colestasis o hepatitis, en algunos pacientes. También se han comunicado casos raros de pancreatitis. Otros efectos secundarios poco frecuentes, son angioedema, reacciones alérgicas y eritema multiforme.

#### Precauciones y advertencias:

La amlodipina deber ser empleada con precaución en

pacientes con bradicardia severa o fallo cardiaco (en particular cuando se asocia a un beta-bloqueante), debido a la posibilidad de un shock

cardiogénico por sus propiedades inotrópicas negativas y potentes efectos hipotensores. Los pacientes con disfunción del ventrículo izquierdo, que reciban amlodipina para el tratamiento de la angina, deberán ser estrechamente vigilados para comprobar que el fármaco no empeora la insuficiencia cardíaca. Aunque la amlodipina ha demostrado no empeorar la insuficiencia cardíaca de grado III, se debe evitar en los pacientes con insuficiencia cardíaca NYHA Clase IV. Debe usarse con precaución, como cualquier vasodilatador periférico, en pacientes con estenosis aórtica severa y en pacientes con presión arterial sistólica < 90 mm Hg.

#### *Uso durante el embarazo y lactancia:*

La amlodipina está clasificada dentro de la categoría C de riesgo en el embarazo, y sólo será administrada en esta etapa si los beneficios superan claramente los riesgos potenciales. Se desconoce si el fármaco se excreta en la leche humana, por lo que se deberá evitar su utilización durante la lactancia.

*Efectos sobre la capacidad de conducir vehículos o manejar maquinarias:* Este producto, puede afectar las reacciones del paciente y ejercer una influencia adversa sobre su capacidad para conducir automóviles u operar maquinarias.

#### **Restricciones de uso:**

Este producto se debe administrar con restricción en pacientes con antecedentes de insuficiencia hepática, insuficiencia cardíaca congestiva, estenosis aórtica grave, bradicardia severa.

#### **Interacciones:**

La coadministración de amlodipina y algún AINE aumenta el riesgo de hemorragia gastrointestinal y/o antagoniza el efecto antihipertensivo. La amiodarona inhibe al citocromo P450 3A4 y los antagonistas de los canales de calcio también, por lo que la administración concomitante puede provocar el incremento de las concentraciones de uno u otro o de ambos. La asociación de antagonistas de los canales de calcio y anticoagulantes orales puede incrementar el riesgo de hemorragias gastrointestinales. La terapia concomitante con barbitúricos incrementa el metabolismo de la amlodipina por inducción enzimática. Se aconseja el monitoreo de la presión arterial. Los bloqueantes alfa<sub>1</sub>adrenérgicos pueden incrementar el efecto hipotensor de los antagonistas de los canales de calcio. Aunque la asociación de amlodipina y los bloqueantes beta es útil en la terapéutica de la hipertensión arterial y la angina pectoris, su asociación presenta efectos cardiovasculares aditivos, que pueden provocar disminución de la función cardíaca o hipotensión arterial grave. La asociación de amlodipina y buflomedil puede inducir un cuadro

de hipotensión arterial que exige el monitoreo clínico cuidadoso. La asociación con carbamazepina/fenitoína/rifampicina pueden disminuir las concentraciones plasmáticas de amlodipina por inducción del citocromo P450. La amlodipina y la ciclosporina se metabolizan en hígado por el citocromo P450 3A4 y pueden incrementarse las concentraciones plasmáticas de la ciclosporina. La asociación de amlodipina y diltiazem puede

inducir un incremento de las concentraciones plasmáticas de amlodipina y provocar hipotensión arterial marcada, especialmente en pacientes añosos. La asociación de droperidol y un antagonista de los canales de calcio, puede provocar cardiotoxicidad con prolongación del Q-T, torsión de punta y paro cardíaco; por lo tanto, si se necesita su administración conjunta, debe efectuarse con extremo cuidado. Se recomienda el monitoreo de la función cardíaca cuando se asocian epirubicina y antagonistas de los canales de calcio. Durante la anestesia con fentanilo, los pacientes bajo tratamiento con amlodipina, pueden experimentar una hipotensión arterial grave. El fluconazol, itraconazol, ketokonazol inhiben al citocromo P450 aumentando las concentraciones plasmáticas de la amlodipina. La administración conjunta con saquinavir/voriconazol puede incrementar el riesgo de toxicidad de la amlodipina. La administración simultánea de amlodipina y digoxina no modifica las concentraciones séricas ni el aclaramiento renal de la digoxina. La cimetidina no modifica la farmacocinética de amlodipina. Dado que no existen estudios in vitro e in vivo sobre la posible interacción de la teofilina y la ergotamina con amlodipina, se recomienda monitorizar los niveles plasmáticos de estos productos cuando se administren concomitantemente. La ingestión de pomelo (o de zumo de pomelo) ha mostrado aumentar la absorción de la felodipina (un fármaco parecido a la amlodipina) y aumentar sus efectos secundarios en los pacientes hipertensos.

#### **Sobredosis:**

No se conoce con precisión el cuadro de sobredosificación con amlodipina. Los datos disponibles permiten suponer que una sobredosis de esta droga puede provocar una excesiva vasodilatación periférica con hipotensión y colapso cardiovascular. En caso de producirse una situación semejante, se recomienda un control estricto de la función cardiovascular y respiratoria, elevación de los miembros inferiores, control de la volemia y eventualmente administración de vasoconstrictores, siempre que no exista una contraindicación para su uso. Debido a la elevada capacidad de unión de la amlodipina a las proteínas plasmáticas, es probable que la diálisis

no ofrezca beneficio en caso de sobredosis. En caso de sobredosis recurrir a Emergencias Médicas. Av. Gral. Santos. Tel.: 206 206. o al Centro Nacional de Toxicología. Gral. Santos y Teodoro Mongelos. Tel.: 220 418.

**Presentación:**

Caja conteniendo 30 comprimidos .

**Almacenar a temperatura ambiente (inferior a 30°C), en lugar seco. Mantener fuera del alcance de los niños.**



**ETICOS®**

Elaborado por **Laboratorio de Productos ETICOS C.E.I.S.A.**  
Atilio Galfre N° 151 y Calle 1 - San Lorenzo, Paraguay  
Tel.: (595-21) 521 390 (R.A.) Fax: (595-21) 521 389  
laboratorio@eticos.com.py - www.eticos.com.py  
D.T.: Q.F. Myriam Cabriza de Paredes - Reg. N° 2837  
Autorizado en Paraguay por el M.S.P. y B.S.