SACTAN® AMLO

TELMISARTAN 40 mg ; AMLODIPINA (como besilato) 5 mg COMPRIMIDOS
TELMISARTAN 80 mg ; AMLODIPINA (como besilato) 5 mg RANURADOS
TELMISARTAN 80 mg ; AMLODIPINA (como besilato) 10 mg

Venta Bajo Receta
Industria Argentina

FÓRMULAS

Cada comprimido bicapa de SACTAN AMLO 40/5 contiene: Telmisartan 40,000 mg; Amlodipino (como Besilato) 5,000 mg; Excipientes: Meglumina 12,500 mg; Celulosa Microcristalina 421,891 mg; Povidona K30 3,750 mg; Manitol 45,500 mg; Almidón Glicolato de Sodio 15,000 mg; Estearato de Magnesio 18,250 mg; Hidróxido de Sodio 3,025 mg; Estearato de Magnesio 4,750 mg; Talco 3,750 mg; Dióxido de Silicio Coloidal 0,750 mg; Agua Purificada c.s.p. Recubrimiento 5,000 mg; Óxido Férrico Amarillo 0,100 mg

Cada comprimido bicapa de SACTAN AMLO 80/5 contiene: Telmisartan 80,000 mg; Amlodipino (como Besilato) 5,000 mg; Excipientes: Meglumina 25,000 mg; Celulosa microcristalina 812,366 mg; Povidona K30 7,500 mg; Manitol 91,000 mg; Almidón glicolato sodico 24,500 mg; Croscarmelosa 32,500 mg; Hidróxido de sodio 7,050 mg; Estearato de magnesio 8,000 mg; Talco 3,750 mg; Dióxido de Silicio Coloidal 1,500 mg; Agua Purificada c.s.p. Recubrimiento 5,000 mg; Óxido férrico amarillo 0,100 mg

Cada comprimido bicapa de SACTAN AMLO 80/10 contiene: Telmisartan 80,000 mg; Amlodipino (como Besilato) 10,000 mg; Excipientes: Meglumina 25,000 mg; Celulosa microcristalina 812,366 mg; Povidona K30 7,500 mg; Manitol 91,000 mg; Almidón glicolato sodico 24,500 mg; Croscarmelosa 32,500 mg; Hidróxido de sodio 7,050 mg; Estearato de magnesio 8,000 mg; Talco 3,750 mg; Dióxido de Silicio Coloidal 1,500 mg; Agua Purificada c.s.p. Recubrimiento 5,000 mg; Óxido férrico amarillo 0,100 mg

ACCIÓN TERAPÉUTICA

Antihipertensivo.
Código ATC: C09DB04.

INDICACIONES

Tratamiento de la hipertensión esencial.

Terapia de reemplazo

Los pacientes que reciben telmisartán y amlodipina en comprimidos por separado pueden en cambio recibir SACTAN AMLO que contiene las mismas dosis comprimidas.

Terapia combinada

SACTAN AMLO está indicado en aquellos cuya presión sanguínea no está adecuadamente controlada con telmisartán o amlodipina en monoterapia.

Terapia inicial

También puede utilizarse SACTAN AMLO como terapia inicial en aquellos que posiblemente necesiten múltiples drogas para alcanzar el objetivo de presión sanguínea (ver Propiedades farmacodinámicas de SACTAN AMLO como terapia para hipertensión) debería basarse en los potenciales beneficios y riesgos.

ACCIÓN FARMACOLÓGICA

Propiedades farmacodinámicas
Telmisartán es un antagonista antagonistas de la angiotensina II, simple (telmisartán), combinaciones (telmisartán y otros antihipertensivos).

Mecanismos de acción
SACTAN AMLO combina dos compuestos antihipertensivos con mecanismos complementarios para controlar la presión sanguínea en pacientes con hipertensión esencial: el amlodipino es un bloqueador de los canales de la angiotensina II, telmisartán, y un bloqueador de los canales de calcio dihidropiridínico, amlodipina.

La combinación de estas sustancias tiene un efecto antihipertensivo aditivo, reduciendo la presión sanguínea en un rango de disolitación terapéutica de 8 a 10 mmHg.

Telmisartán

Telmisartán es un antagonista oralmente efectivo y específico (tipo AT1) de los receptores de la angiotensina II. Telmisartán desplaza la angiotensina II con una muy alta afinidad desde su lugar de unión al subtipo de los receptores AT1, responsable de las acciones conocidas de la hormona. Telmisartán no exhibe actividad agonista parcial en el receptor AT1 y telmisartán no se une selectivamente al receptor AT1. La unión es de larga duración.

Telmisartán no muestra afinidad con otros receptores, incluyendo AT2 y otros receptores AT menos caracterizados. Se desconoce el papel funcional de estos receptores. Además, como no se bloquean los efectos de la angiotensina II, se espera que los niveles elevados de angiotensina II estimulen los receptores no bloqueados en la aldosterona en plasma. Telmisartán no inhibe la renina plasmática humana ni bloquea los canales iónicos. Telmisartán no inhibe la angiotensina convertasa, que es la enzima (renina-II), la enzima que también degrada la bradikinina. Por lo tanto, no se esperan efectos potenciados mediados por bradikinina.

Una dosis de 80 mg de telmisartán en voluntarios sanos inhibe casi completamente el aumento de la presión sanguíneas evocado por la angiotensina II. El efecto inhibidor se mantiene por 24 horas y es aún mensurable hasta 48 horas.

Amlodipina

La amlodipina es un inhibidor del influjo del ion calcio, perteneciente al grupo de las dihidropiridinas (bloqueador lento o antagonista del ion del calcio). Inhibe influjo de iones transmembrana de los iones de calcio en el músculo liso vascular y en el corazón.

El mecanismo de acción antihipertensiva de la amlodipina se debe al efecto relajante directo que tiene sobre el músculo liso vascular, que reduce la resistencia vascular periférica y la presión arterial.

Los datos experimentales indican que la amlodipina se une a los sitios de unión de dihidropiridina y no dihidropiridina. La contracción del músculo cardíaco y liso depende, en parte, de la entrada en las células del músculo liso vascular que en las células del músculo liso vascular que en las células del músculo cardíaco.

FARMACOCINÉTICA

Absorción

Después de la ingesta oral de telmisartán, la actividad antihipertensiva se vuelve gradualmente evidente dentro de las 3 horas. La reducción máxima de la presión sanguínea generalmente se observa a 4 semanas después de comenzado el tratamiento y se sostiene a lo largo de una terapia de largo plazo.

La reducción de la presión sanguínea es de 10 mmHg a 15 mmHg después de la dosificación a niveles terapéuticos de amlodipina. La amlodipina produce una muestra en las mediciones ambulatorias de la presión sanguínea. Esto lo confirman los estudios ambulatorios de presión arterial de 24 horas en los experimentados después de las dosis de 40 mg y 80 mg de telmisartán en combinación con amlodipina 5 mg y 10 mg.

Existe una relación dosis-respuesta para la dosis oral de telmisartán y exposición de la presión arterial sistólica basal. En este respecto, los datos acerca de la amlodipina son insuficientes para determinar.

En los pacientes con hipertensión telmisartán reduce ambas presiones sanguíneas sistólica y diastólica sin efectos clínicos significativos.

La eficacia antihipertensiva de telmisartán es comparable con la de agentes representativos de otras clases de drogas antihipertensivas (demostrado en estudios controlados con placebo y activos en amlodipina, atenolol, enalapril, hidroclorotiazida, fosinalpril, lisinopril, ramipril y valsartán).

Los efectos de la dosis de telmisartán sobre la presión sanguínea mantienen durante 24 horas en la clínica y en el consultorio y en la medición ambulatoria. Esto sin evidencia de hipertensión de rebote. Se ha mostrado en estudios clínicos que telmisartán produce una reducción similar en la presión sanguínea diastólica significativas de la Masa Ventricular Izquierda e Índice de Masa Ventricular Izquierda en pacientes hipertensos con hipertrofia ventricular izquierda.

Existe una relación entre la concentración de la dosis oral de telmisartán (basada en comparadores como losartán, ramipril y valsartán) está asociado a reducciones estadísticamente significativas de la isquemia (incluyendo electrocardiografía y macroalbuminuria) en pacientes con hipertensión y nefropatía diabética.

Amlodipina

Administrada una vez al día en pacientes hipertensos disminuye la presión arterial en grado clínicamente significativo en posición supina, supina y de pie, durante un intervalo de 24 horas. Debido al lento comienzo de acción, la hipotensión aguda no es una consecuencia de la administración de amlodipina.

En los pacientes hipertensos con función renal normal, las dosis terapéuticas de amlodipina disminuyeron la resistencia vascular renal y aumentaron la tasa de filtración glomerular y el flujo plasmático renal sin, en cambios en la fracción de filtración o proteinuria

FARMACOCINÉTICA

Farmacocinética de la Combinación de dosificación fija

La absorción de telmisartán y amlodipina de SACTAN AMLO son equivalentes a la biodisponibilidad de telmisartán y amlodipina cuando son administrados como comprimidos individuales.

Farmacocinética de componentes

Telmisartán

La absorción de telmisartán es rápida, aunque la cantidad absorbida varía. La biodisponibilidad absoluta media de telmisartán es de aproximadamente el 50% cuando se administra en dosis de 40 mg y 80 mg. Los niveles pico de la concentración sanguínea (Cmax) de telmisartán se alcanzan a las 0,5 horas de aproximadamente el 6% (dosis de 40 mg) a aproximadamente el 19% (dosis de 160 mg). A las 3 horas de la administración, las concentraciones en plasma de 80 mg de telmisartán se toma en ayuno o con alimento.

Existe una variación individual considerable de la AUC provoque una disminución de la eficacia terapéutica.

Después de la administración oral de dosis terapéuticas de amlodipina sola, los niveles máximos en plasma se alcanzan aproximadamente de 6-12 horas. La biodisponibilidad absoluta se calculó entre 64% y 80%. La biodisponibilidad de amlodipina no se ve afectada por la ingesta de alimentos.

Distribución

Telmisartán se une de forma elevada a las proteínas plasmáticas (>99,5%), principalmente a la albúmina y a la alfa-1-glicoproteína ácida. El volumen de distribución aparente medio en el estado de equilibrio (Vss) es de aproximadamente 500 litros.

El volumen de distribución de amlodipina es consistente con el 21 L/kg. Los estudios in vitro con amlodipina muestran que aproximadamente el 97,5 % de los fármacos circulantes se unen a las proteínas plasmáticas en hipertensos. Metabolismo

La vía principal para la farmacocinética de decaimiento bioexponencial con una vida media de eliminación terminal de aproximadamente 24 horas.

La amlodipina se metaboliza extensivamente (aproximadamente el 90%) por el hígado a los metabolitos inactivos.

Eliminación

La vía principal de caracteristica por una farmacocinética de decaimiento bioexponencial con una vida media de eliminación terminal de aproximadamente 24 horas. La concentración plasmática máxima (Cmax) y, en menor grado, el área bajo la curva de concentración plasmática-tiempo (AUC) aumentan de forma lineal y proporcional a la dosis. No hay evidencia de acumulación clínicamente detectable de telmisartán. La depuración total del telmisartán es alta (aproximadamente 1500 ml/min) en forma casi exclusiva por depuración hepática (aclaramiento comparado) mediante la excreción urinaria acumulativa es <2% de la dosis. El clearance plasmático total (CT) tras la administración intravenosa es de aproximadamente 500 ml/min y el aclaramiento renal es de aproximadamente 275 ml/min.

Después de la administración oral de dosis terapéuticas de amlodipina, se observó una vida media de eliminación de aproximadamente de 30-50 horas.

Farmacocinética de la edad

El volumen de distribución de amlodipina se ve afectada, con una eliminación terminal de vida media prolongada de 60 horas. Los niveles de plasma en estado de equilibrio se alcanzan después de la administración continua durante 7-8 días en comparación con los varones, sin influencia relevante sobre la eficacia.

Insuficiencia renal

Se observaron concentraciones plasmáticas inferiores de telmisartán en pacientes con insuficiencia renal de la angiotensina. Sin embargo, la información clínica y de los pacientes plasmáticas en pacientes insuficientes renales y no puede ser extrapolada a otros. La vida media de eliminación no se ve afectada en pacientes con insuficiencia renal.

La insuficiencia renal no influencia significativamente la farmacocinética de la amlodipina.

Insuficiencia hepática.

◀◀

Interacciones con telmisartán

Telmisartán puede aumentar el efecto hipotensor de otros agentes antihipertensivos.

La administración conjunta de telmisartán no arrojó como resultado una interacción clínica significativa con digoxina, warfarina, hidroclorotiazida, glibenclamida, ibuprofeno, paracetamol, simvastatina y amlodipina. Para digoxina se ha observado un aumento del 20% en las concentraciones mínimas en estado de plasma (39% en un caso); debería considerarse el monitoreo de los niveles de digoxina en plasma.

En un estudio, la administración conjunta de telmisartán y ramipril llevó a un aumento de hasta 2,5 veces la AUC (0-24) Cmax de ramipril y ramiprilato. El significado clínico de este hallazgo es desconocido.

Se han descrito aumentos reversibles de las concentraciones de litio en suero y de la toxicidad durante la administración concomitante de litio con inhibidores de la enzima convertidora de la angiotensina. También se informaron casos con antagonistas de los receptores de la angiotensina II, incluyendo telmisartán. Se recomienda una cuidadosa monitorización de los niveles séricos de litio durante el uso concomitante de estos agentes. Medio administración antimicrobiano, con dosis propias de un tratamiento antimicrobiano, inhibidores de la CDK2 y ANEs no esteroideos (es con la posibilidad de inducir insuficiencia renal en pacientes deshidratados. Los compuestos que actúan sobre el Sistema Renina-Angiotensina-Aldosterona (SRAA) y telmisartán pueden ser hiperkalemia. Los pacientes que reciben ANEs