

Psiquiátrico: Disfunción sexual, insomnio, nerviosismo, depresión, ansiedad, despersonalización.

Sistema respiratorio: Disnea, epistaxis.

Los siguientes eventos ocurrieron en $\leq 0.1\%$ de pacientes: Falla cardíaca, pulso irregular, extrasístole, decoloración de la piel, urticaria, sequedad de la piel, alopecia, dermatitis, debilidad muscular, ataxia, hipertonia, migraña, gastritis, amnesia agitación, aumento del apetito, tos, rinitis.

La terapia con amlodipina no ha sido asociada con cambios significantes en las pruebas de laboratorio de rutina. Ningún cambio clínico relevante fue notado en el potasio, glucosa sérica, colesterol total, colesterol HDL, ácido úrico, creatinina.

Interacciones Medicamentosas: Amlodipina se ha administrado en forma segura con diuréticos tipo tiazida, beta bloqueadores, inhibidores de la enzima convertidora, nitratos de acción prolongada, nitroglicerina sublingual, drogas antiinflamatorias no esteroideas, antibióticos y drogas hipoglucemiantes orales. Estudios especiales han indicado que la co-administración de amlodipina con digoxina no cambió los niveles plasmáticos de digoxina o el clearance renal de digoxina en voluntarios normales, y que la co-administración de cimetidina no alteró la farmacocinética de amlodipina. Los datos in vitro de estudios con plasma humano indican que amlodipina no posee efectos en la unión a proteínas de las drogas ensayadas (digoxina, fenitoína, warfarina e indometacina).

SOBREDOSIFICACIÓN:

Se podría esperar que una sobredosis con amlodipina provoque vasodilatación periférica excesiva con marcada hipotensión. No se conocen muchos casos de sobredosis intencional con amlodipina.

En caso de una sobredosis, se debe monitorear la actividad cardíaca y respiratoria. La medición de la presión debe ser frecuente. En el caso que ocurra una hipotensión se debe iniciar un apoyo cardiovascular. Si la hipotensión continúa, se debe administrar vasopresores (tales como la Fenilefrina).

En caso de sobredosis concurrir al Centro Asistencial más próximo o comunicarse con el Centro de Intoxicaciones de:

Hospital Ricardo Gutiérrez: Tel: (011) 4962-6666 o 4962-2247.

Hospital A. Posadas: Tel: (011) 4654-6648/4658-7777.

PRESENTACIONES:

Envases por 10, 20, 30 y 40 comprimidos para la venta al público y 50, 100, 500 y 1000 para uso exclusivo de hospitales.

Especialidad Medicinal autorizada por el Ministerio de Salud.

Certificado N° 51.950

CONSERVAR A TEMPERATURA NO MAYOR DE 30 °C. EN LUGAR SECO, ALABRIGO DE LA LUZ, Y EN SU ENVASE ORIGINAL.

MANTENER ESTE Y TODOS LOS MEDICAMENTOS FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS.

Laboratorios Duncan S.A.

Tronador 543 (C1427CRK) - CABA

Elaborado en: Tronador 229/41/55 - (C1427CRE) - CABA

y/o Galicia 2652 - (C1416DHR) - CABA

Directora Técnica: SILVIASALLAGO - Farmacéutica



Abloom Amlodipina

Comprimidos

Industria Argentina

Venta bajo receta

FÓRMULA CUALICUANTITATIVA:

Cada comprimido de Abloom 5 mg contiene:

Amlodipina (como besilato) 5 mg, Celulosa microcristalina 146,97 mg, Croscarmelosa sódica 2,50 mg, Dióxido de silicio coloidal 1,55 mg, Estearato de magnesio 2,00 mg.

Cada comprimido de Abloom 10 mg contiene:

Amlodipina (como besilato) 10 mg, Celulosa microcristalina 293,94 mg, Croscarmelosa sódica 5,00 mg, Eritrosina laca aluminica 0,10 mg, Dióxido de silicio coloidal 3,10 mg, Estearato de magnesio 4,00 mg.

ACCIÓN TERAPÉUTICA: Antihipertensivo. Antianginoso.

INDICACIONES: Amlodipina está indicada para el tratamiento de la hipertensión arterial esencial, y en la isquemia del miocardio (angina estable crónica, angina vasospástica). En todos los casos puede ser usada como monoterapia o en combinación con otros antihipertensivos.

CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS/PROPIEDADES:

Mecanismo de acción: Amlodipina es un antagonista calcio dihidropiridina (antagonista del ion cálcico o bloqueante de canal lento) que inhibe el paso a través de la membrana de iones de calcio en la musculatura vascular y cardíaca.

Según estadísticas, la amlodipina se une tanto a sitios de enlace dihidropiridina y no-dihidropiridina. Los procesos contráctiles del músculo cardíaco y músculo liso vascular dependen del movimiento extracelular de iones cálcicos dentro de estas células a través de canales iones específicos.

Amlodipina inhibe el paso de iones cálcicos a través de la membrana celular, con un efecto mayor sobre las células del músculo liso vascular que sobre las células del músculo cardíaco.

El mecanismo de la acción antihipertensiva de amlodipina se debe a un efecto relajante directo en el músculo liso vascular. El mecanismo preciso por medio del cual la amlodipina alivia la angina no ha sido determinado completamente, pero reduce el daño isquémico total por medio de las 2 siguientes acciones: 1) Amlodipina dilata las arteriolas periféricas y por lo tanto, reduce la resistencia periférica total (post carga) contra la cual trabaja el corazón. Puesto que no existe taquicardia refleja asociada, esta descarga del corazón reduce el consumo de energía del miocardio y los requerimientos de oxígeno, y probablemente es responsable por la efectividad de la amlodipina en isquemia cardíaca. 2) El mecanismo de acción de amlodipina probablemente involucra la dilatación de las principales arterias y arteriolas coronarias, tanto en las regiones normales como isquémicas. Esta dilatación aumenta la liberación de

oxígeno del miocardio en pacientes con espasmo de la arteria coronaria (angina Prinzmetal o variante).

FARMACOCINÉTICA:

Luego de la administración oral de dosis terapéuticas de amlodipina, la absorción produce picos de concentraciones plasmáticas entre las 6 y las 12 horas. El volumen de distribución es de aproximadamente 20 l/kg. La vida media de eliminación plasmática terminal es de alrededor de 35-50 horas. La biodisponibilidad absoluta se considera dentro del 64 % y 90%. La biodisponibilidad de la amlodipina no se altera por la presencia de alimentos.

Amlodipina se convierte (alrededor del 90%) en metabolitos inactivos vía metabolismo hepático, con 10% del componente principal y 60% de los metabolitos es excretada en la orina.

Los niveles estables en plasma se alcanzan luego de 7 a 8 días de dosis diarias consecutivas. Los pacientes con disfunción renal pueden recibir la dosis usual inicial. Los pacientes de edad avanzada y pacientes con insuficiencia hepática han reducido el clearance de amlodipina con un aumento en la AUC aproximadamente de 40-60%, por lo que puede requerirse una baja inicial en la dosis. Un aumento similar en la AUC fue observado en pacientes con falla cardíaca de moderada a severa.

FARMACODINAMIA:

Hemodinamia: luego de la administración de dosis terapéuticas a pacientes con hipertensión, la amlodipina produce vasodilatación. Estas bajas en la presión sanguínea no son acompañadas de un cambio significativo en el pulso cardíaco o en los niveles de catecolamina con dosis crónicas. Aunque la administración intravenosa de amlodipina reduce la presión arterial y aumenta el pulso cardíaco en estudios hemodinámicos de pacientes con angina estable, la administración oral de amlodipina en ensayos clínicos no condujo cambios significativos en el pulso cardíaco o presión sanguínea en pacientes con angina y presión normal.

Con una administración oral diaria, la efectividad antihipertensiva se mantiene por al menos 24 horas. La magnitud de la reducción de la presión sanguínea se relaciona con el grado de presión pre-tratamiento. Pacientes con hipertensión moderada (presión diastólica 105-114 mm Hg) tuvieron un 50% más de respuesta que pacientes con hipertensión leve (90 – 104 mmHg).

POSOLÓGIA/ DOSIFICACIÓN:

La dosis oral antihipertensiva inicial de amlodipina es de 5 mg diarios, con una dosis máxima de 10 mg diarios.

Pacientes débiles, mayores o pacientes con insuficiencia hepática pueden comenzar con 2.5 mg una vez al día. Esta dosis puede ser usada cuando se administra amlodipina junto a otro antihipertensivo. La dosis debería ser ajustada de acuerdo a las necesidades de cada paciente.

La dosis recomendada en angina vasospástica o crónica estable es de 5-10 mg, con la dosis más baja en los pacientes mayores y en pacientes con insuficiencia hepática. La mayoría de los pacientes requerirán 10 mg para un efecto adecuado. Co-administración con otros antihipertensivos y/o drogas antianginosas: amlodipina ha sido administrada con tiazidas, inhibidores ACE, betabloqueantes, nitratos de acción prolongada y/o nitroglicerina sublingual.

CONTRAINDICACIONES: Amlodipina está contraindicada en pacientes con hipersensibilidad conocida a dihidropiridinas.

PRECAUCIONES:

General: Hipotensión aguda ha sido rara vez reportada ya que la vasodilatación inducida por amlodipina es gradual desde el comienzo. Sin embargo se debería tener mucha precaución cuando se administra

amlodipina como con cualquier otro vasodilatador periférico particularmente en pacientes con estenosis aórtica severa.

Uso en pacientes con falla cardíaca congestiva: En general los bloqueantes de canal de calcio deberían ser usados con precaución en pacientes con falla cardíaca.

Uso concomitante con Betabloqueantes: Amlodipina no es un beta bloqueante y por lo tanto no da protección contra los posibles efectos del empleo conjunto de estos medicamentos. Antes de emplear amlodipina debería reducirse gradualmente la dosis de beta bloqueante.

Pacientes con disfunción hepática: Como amlodipina es mayormente metabolizada por el hígado y la eliminación plasmática media es (1/2) de 56 horas en pacientes con insuficiencia hepática, se debería tener mucha precaución al administrar amlodipina a estos pacientes.

Carcinogénesis, Mutagénesis, Daños en la fertilidad.

Mutagénesis: Estudios revelaron ningún efecto relacionado con la droga tanto en los niveles cromosómicos como en los genes.

No hubo efecto alguno sobre la fertilidad en ratas tratadas con amlodipina

Embarazo: No hay evidencia de teratogenicidad u otra toxicidad embrio fetal en estudios sobre ratas o conejos tratados oralmente con hasta 10 mg/kg.

No hay estudios realizados a mujeres embarazadas, por lo que ABLOOM debería ser usada durante el embarazo solo si los beneficios potenciales justifican los riesgos probables.

Lactancia: No se conoce si amlodipina es excretada en la leche materna. Se recomienda suspender el amamantamiento mientras se esta recibiendo amlodipina.

Uso pediátrico: La seguridad y efectividad de amlodipina en niños no ha sido establecida.

REACCIONES ADVERSAS:

Las reacciones más comunes son dolor de cabeza y edema.

Varias experiencias adversas aparecen relacionadas a la droga y la dosis. Hubo mayor incidencia en mujeres que en los hombres.

	Amlodipina		Placebo	
	Hombres	Mujeres	Hombres	Mujeres
	%	%	%	%
Edema	5.6	14.6	1.4	5.1
Flushing	1.5	4.5	0.3	0.9
Palpitaciones	1.4	3.3	0.9	0.9
Somnolencia	1.3	1.6	0.8	0.3

Los siguientes efectos ocurrieron en $\leq 1\%$ pero $>1\%$ de los pacientes en estudios clínicos donde no se puede establecer una relación causal; son mencionados para alertar a los especialistas de alguna posible relación.

Cardiovascular: Arritmia (incluyendo taquicardia ventricular y fibrilación auricular) bradicardia, dolor de pecho, hipotensión, isquemia periférica, síncope, taquicardia.

Sistema nervioso central y periférico: Anorexia, constipación dispepsia, disfagia, diarrea, flatulencia, vómitos, hiperplasia gingival.

General: Astenia, dolor de espalda.

Sistema músculo-esquelético: Artralgia, artrosis, mialgia.