

Antihipertensivo

# Presolol<sup>®</sup>

## Telmisartán 40 - 80 mg

Comprimidos  
Vía Oral

### Uso concomitante que requiere precaución

**Medicamentos antiinflamatorios no esteroideos (AINEs):** El tratamiento con AINEs (es decir, ácido acetilsalicílico administrado en dosis propias de un tratamiento antiinflamatorio, inhibidores de la COX-2 y AINEs no selectivos), puede reducir el efecto antihipertensivo de los antagonistas de los receptores de la angiotensina II.

En algunos pacientes con la función renal alterada (por ejemplo pacientes deshidratados o pacientes de edad avanzada con la función renal alterada), la administración conjunta de antagonistas de los receptores de la angiotensina II y agentes inhibidores de la ciclooxigenasa, puede resultar en un mayor deterioro de la función renal, incluyendo posible fallo renal agudo, que normalmente es reversible. Por lo tanto, la combinación debe administrarse con precaución, especialmente en pacientes de edad avanzada. Los pacientes deben ser hidratados de forma adecuada, y debe considerarse la monitorización de la función renal al inicio del tratamiento concomitante y de forma periódica a partir de entonces.

**Diuréticos (tiazida o diuréticos del asa):** Los tratamientos anteriores con altas dosis de diuréticos tales como furosemida (diurético del asa) e hidroclorotiazida (diurético tiazida), pueden producir depleción de volumen y riesgo de hipotensión al iniciar tratamiento con telmisartán.

### A tener en cuenta en el uso concomitante

**Otros agentes antihipertensivos:** El efecto hipotensor de telmisartán puede verse incrementado por el uso concomitante de otros medicamentos antihipertensivos. Los datos de los estudios clínicos han demostrado que el bloqueo dual del sistema renina-angiotensina-aldosterona (SRAA), mediante el uso combinado de inhibidores de la enzima convertidora de angiotensina, antagonistas de los receptores de angiotensina II o aliskirén, se asocia con una mayor frecuencia de acontecimientos adversos tales como hipotensión, hiperpotasemia y disminución de la función renal (incluyendo insuficiencia renal aguda), en comparación con el uso de un solo agente con efecto sobre el SRAA.

En base a sus propiedades farmacológicas, es posible que los siguientes medicamentos potencien el efecto hipotensor de todos los antihipertensivos incluyendo telmisartán: baclofeno, amifostina. Además, la hipotensión ortostática puede agravarse por el alcohol, los barbitúricos, los narcóticos o los antidepresivos.

**Corticosteroides (administración sistémica):** Disminución del efecto hipotensor.

### SOBREDOSIS:

No se dispone de información concerniente a sobredosificación en humanos. En caso de hipotensión sintomática, deben instituirse medidas generales de sostén y lavado gástrico. Telmisartán o es hemodializable. Ante la eventualidad de una sobredosis acudir al Centro Nacional de Toxicología en el Hospital de Emergencias Médicas sito ubicado en la Avda. Gral Santos c/ Teodoro Mongelos. Tel. 220 418 Asunción - Paraguay

### PRESENTACIONES:

#### Presolol<sup>®</sup> 40:

Cajas conteniendo 10 y 30 comprimidos.

#### Presolol<sup>®</sup> 80:

Cajas conteniendo 10 y 30 comprimidos.

### CONSERVACIÓN:

Almacenar a temperatura ambiente (inferior a 30°C).

Mantener fuera del alcance de los niños.

Venta Bajo Receta  
Industria Paraguaya



Elaborado por:

Laboratorio Pharma Industrias S.A.

Calle 1 e/ Av. Pastora Cespedes y San Antonio - San Lorenzo

Para: Promepar S.A.

Gral. Wenceslao López N° 999. Tel: 573 -112. San Lorenzo - Paraguay

D.T.: Q.F. Myriam Cabriza de Paredes. - Reg. Prof. N° 2.837

Venta autorizada por la DINAvisa.

314285PRC-000

### FORMULA:

Cada comprimido de Presolol<sup>®</sup> 40 contiene:

Telmisartán..... 40 mg.  
Excipientes..... c.s.

Cada comprimido de Presolol<sup>®</sup> 80 contiene:

Telmisartán..... 80 mg.  
Excipientes..... c.s.

### MECANISMO DE ACCIÓN:

El telmisartán es un antagonista específico de los receptores de la angiotensina II (tipo AT1), eficaz por vía oral. El 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. El telmisartán no presenta ninguna actividad agonista parcial en el receptor AT1. Se une en forma duradera y selectiva a este receptor. El telmisartán no muestra una afinidad destacable para otros receptores, incluyendo los AT2 y otros receptores AT menos caracterizados.

Telmisartán disminuye las concentraciones plasmáticas de aldosterona. No inhibe la renina en el plasma ni bloquea los canales iónicos. Tampoco inhibe a la enzima convertidora de angiotensina (cininasa II), enzima que también degrada a la bradicina, por lo que no es de esperar potenciación de los eventos adversos mediados por la bradicina.

Una dosis de 80 mg de telmisartán, inhibe casi completamente el aumento de la presión arterial provocado por la angiotensina II. Este efecto inhibitorio, se conserva durante 24 horas, siendo aún medible hasta 48 horas después.

Tras la administración de la primera dosis de telmisartán, la actividad antihipertensiva es gradualmente evidente dentro de las primeras 3 horas. Se logra una disminución máxima de la presión arterial a las 4 semanas de tratamiento, conservándose en tratamientos prolongados. En estudios de medición ambulatoria de la presión arterial, se ha demostrado, que las acciones antihipertensivas de telmisartán permanecen constantes durante 24 horas después de administrado el medicamento, y abarcan las 4 últimas horas anteriores a la dosis siguiente.

Existen aparentemente tendencias entre una relación con la dosis y el tiempo de recuperación de la presión arterial sistólica basal; la información concerniente a la presión arterial diastólica es inconsistente. En los pacientes con hipertensión arterial, telmisartán disminuye las cifras de la presión arterial sistólica y diastólica, sin modificarse la frecuencia del pulso. En estudios clínicos comparados con amlodipina, atenolol, enalapril, hidroclorotiazida, losartán y lisinopril, se ha demostrado que la eficacia antihipertensiva del telmisartán es comparable con la de éstos.

En caso de interrumpir súbitamente un tratamiento a base de telmisartán, las cifras de la presión arterial gradualmente remiten a las mediciones previas al inicio del tratamiento, en un lapso de varios días, sin desarrollo de hipertensión arterial de rebote. En estudios clínicos que compararon directamente a pacientes con telmisartán y con inhibidores de la ECA, la incidencia de tos seca fue significativamente menor con telmisartán. Se desconocen hasta la fecha, los efectos benéficos de telmisartán sobre la mortalidad y la morbilidad cardiovascular.

### FARMACOCINÉTICA:

La **absorción** del telmisartán es rápida, aunque la cantidad absorbida es variable. El promedio de la biodisponibilidad absoluta de telmisartán es de aproximadamente 50%. Administrado concomitantemente con los alimentos, disminuye el área bajo la curva (ABC) de su concentración, aproximadamente 6 y 19% tras la administración de dosis de 40 y 80 mg, respectivamente. Tres horas después de su administración, las concentraciones plasmáticas de telmisartán son similares en ayunas o con alimentos. No es de esperar, que este decremento leve del ABC, ocasione disminución de su eficacia terapéutica. En estudios de farmacocinética, se observaron diferencias en las concentraciones plasmáticas relacionadas con el sexo; así tenemos que la C<sub>max</sub> y el ABC fueron, respectivamente, 3 y 2 veces mayores en las mujeres, que en los hombres, pero sin repercusiones sobre la eficacia terapéutica del medicamento. Telmisartán se une extensamente a las proteínas plasmáticas (> 99.5%), principalmente. Con la albúmina y con la glucoproteína a-1 ácida.

El volumen aparente de **distribución** en estado estable (V<sub>dss</sub>) es de aproximadamente 500 litros. Telmisartán es metabolizado por conjugación con el glucurónido del fármaco padre, siendo este conjugado farmacológicamente inactivo. Se caracteriza por una declinación farmacocinética biexponencial con una vida media de eliminación terminal > 20 horas. La concentración plasmática máxima (C<sub>max</sub>), y en menor grado el área bajo la curva de concentración y tiempo, aumentan desproporcionalmente con la dosis. No existen evidencias de acumulación clínicamente importantes del telmisartán. Tras su administración oral, el telmisartán es eliminado casi exclusivamente con las heces, y sólo como medicamento inalterado.

La **eliminación** urinaria acumulativa es < 2% de la dosis.

El aclaramiento plasmático total (Cl<sub>tot</sub>) es elevado, aproximadamente 900 ml/min, comparado con el flujo hepático (aproximadamente 1,500 ml/min). Las características farmacocinéticas del telmisartán no son diferentes entre los adultos jóvenes y los de la tercera edad. Se han observado concentraciones plasmáticas menores en pacientes con insuficiencia renal sujetos a tratamiento con diálisis. Telmisartán se une ampliamente con las proteínas plasmáticas en la insuficiencia renal y no es dializable. Los estudios farmacocinéticos en pacientes con insuficiencia hepática, demostraron un aumento aproximadamente del 100% en la biodisponibilidad absoluta. La vida media de eliminación no se modifica en sujetos con insuficiencia hepática o renal.

## INDICACIONES:

Tratamiento de la hipertensión arterial esencial.

## POSOLÓGIA:

**Adultos:** La dosis recomendada es de 40 a 80 mg una vez al día.

Algunos pacientes pueden beneficiarse con una dosis de 20 mg. En los casos en que no se obtenga la disminución esperada de la presión arterial, la dosis puede incrementarse hasta 80 mg al día. Cuando se considere un incremento de dosificación, se debe tomar en cuenta que el efecto antihipertensivo máximo se obtiene generalmente tras 4 a 8 semanas de haber iniciado el tratamiento.

En pacientes con hipertensión severa, se han utilizado dosificaciones superiores a 160 mg solos o en combinación con hidroclorotiazida de 12 a 25 mg diariamente, que han sido efectivos y bien tolerados. No es necesario ajustar la dosis en sujetos con insuficiencia renal de leve a moderada. En pacientes con insuficiencia hepática, la dosis diaria máxima recomendable es de 40 mg. En sujetos de la tercera edad, no es necesario efectuar ajustes de la dosificación.

## MODO DE USO:

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

## CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad conocida al medicamento. Durante el segundo y tercer trimestres del embarazo y la lactancia. En sujetos con patología obstructiva de las vías biliares, y en casos de insuficiencia hepática o renal severa. Si tiene diabetes, o se está tratando con un medicamento para bajar la presión arterial con medicamentos que contengan AIsikiren.

## REACCIONES ADVERSAS:

Las reacciones adversas son, normalmente, de carácter leve y transitorio, y sólo raramente requieren la supresión del tratamiento. La incidencia de las mismas, no está relacionada con la dosis, y no se ha observado una correlación con el sexo, edad o raza de los pacientes.

**Infecciones:** Infecciones del tracto urinario, infecciones de las vías respiratorias superiores.

**Desórdenes psiquiátricos:** Ansiedad.

**Alteraciones oftálmicas:** Desórdenes de la visión.

**Alteraciones laberínticas y del oído:** Vértigo.

**Desórdenes gastrointestinales:** Dolor abdominal, diarrea, sequedad de boca, dispepsia, flatulencia, trastornos gástricos.

**Alteraciones de la piel y del tejido celular subcutáneo:** Eczema, humedad incrementada.

**Alteraciones musculoesqueléticas, óseas y del tejido conectivo:** Artralgias, mialgias, dolor lumbar, calambres en piernas o dolor de miembros inferiores y síntomas tipo tendinitis.

**Efectos sobre el estado general:** Dolor precordial, síntomas tipo influenza.

Además, desde la comercialización de telmisartán, los casos de eritema, prurito, debilidad, insomnio, depresión, vómito, hipotensión, bradicardia, taquicardia, disnea, eosinofilia, trombocitopenia, astenia y falta de eficacia, han sido reportados en forma muy poco frecuente.

Como sucede con la administración de otros antagonistas de la angiotensina II, se han reportado casos aislados de angioedema, urticaria y otros eventos relacionados. Se ha observado, en forma poco frecuente, descenso en la hemoglobina o un incremento del ácido úrico, los cuales ocurren en forma más frecuente durante el tratamiento con telmisartán que durante la administración del placebo. También, se ha presentado un incremento de la creatinina o de las enzimas del metabolismo hepático durante el tratamiento con telmisartán, pero dichos cambios sucedieron como hallazgo de laboratorio, con una frecuencia similar o menor a la del placebo.

## PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

**Insuficiencia hepática:** Telmisartán no debe administrarse a pacientes con colestasis, trastornos obstructivos biliares o insuficiencia hepática grave, debido a que telmisartán se elimina principalmente con la bilis.

Puede esperarse que estos pacientes presenten un aclaramiento hepático de telmisartán reducido. Telmisartán debe utilizarse con precaución en pacientes con insuficiencia hepática de leve a moderada.

**Hipertensión renovascular:** En pacientes con estenosis bilateral de la arteria renal o estenosis de la arteria de un único riñón funcional, tratados con medicamentos que afecten al sistema renina-angiotensina-aldosterona, existe un riesgo aumentado de hipotensión grave e insuficiencia renal.

**Insuficiencia renal y trasplante renal:** Cuando se administra telmisartán a pacientes con función renal insuficiente, es recomendable la monitorización periódica de los niveles séricos de potasio y creatinina. No se dispone de experiencia con respecto a la administración de telmisartán en pacientes que han sufrido trasplante renal reciente.

**Hipovolemia intravascular:** En pacientes con depleción de volumen y/o sodio, ocasionada por un tratamiento intensivo con diuréticos, por una dieta restrictiva en sal, por diarreas o vómitos, puede producirse una hipotensión sintomática, especialmente después de la primera dosis de telmisartán. Estas situaciones deben ser corregidas antes de la administración de telmisartán.

**Bloqueo dual del sistema renina-angiotensina-aldosterona (SRAA):** Existe evidencia de que el uso concomitante de inhibidores de la enzima convertidora de angiotensina, antagonistas de los receptores de angiotensina II o aliskiren aumenta el riesgo de hipotensión, hiperpotasemia y disminución de la función renal (incluyendo insuficiencia renal aguda). En consecuencia, no se recomienda el bloqueo dual del SRAA mediante la utilización combinada de inhibidores de la enzima convertidora de angiotensina, antagonistas de los receptores de angiotensina II o aliskiren. Si se considera imprescindible la terapia de bloqueo dual, ésta sólo se debe llevar a cabo bajo la supervisión de un especialista y sujeta a una monitorización estrecha y frecuente de la función renal, los niveles de electrolitos y la presión arterial. No se deben utilizar de forma concomitante los inhibidores de la enzima convertidora de angiotensina y los antagonistas de los receptores de angiotensina II en pacientes con nefropatía diabética.

**Otras situaciones con estimulación del sistema renina-angiotensina-aldosterona:** En pacientes cuyo tono vascular y función renal dependen principalmente de la actividad del sistema renina-angiotensina-aldosterona (p.ej. pacientes con insuficiencia cardíaca congestiva grave o enfermedad renal subyacente, incluyendo estenosis de la arteria renal), se ha asociado el tratamiento con fármacos que afectan a este sistema, tales como telmisartán, con hipotensión aguda, hiperpotasemia, oliguria, o raramente fallo renal agudo.

**Aldosteronismo primario:** Los pacientes con aldosteronismo primario no responden, generalmente, a los medicamentos antihipertensivos que actúan por inhibición del sistema renina-angiotensina. En consecuencia, no se recomienda el uso de telmisartán.

**Estenosis valvular aórtica y mitral, cardiomiopatía hipertrófica obstructiva:** Como sucede con otros vasodilatadores, se recomienda especial precaución en pacientes con estenosis aórtica o mitral o con cardiomiopatía hipertrófica obstructiva.

**Pacientes diabéticos tratados con insulina o antidiabéticos:** En estos pacientes puede aparecer hipoglucemia bajo tratamiento con telmisartán, por lo que en estos pacientes, se debe considerar una adecuada monitorización de la glucosa en sangre. Cuando esté indicado, puede ser necesario un ajuste de la dosis de insulina o de antidiabéticos.

**Hiperpotasemia:** El uso de medicamentos que afectan el sistema renina-angiotensina-aldosterona puede producir hiperpotasemia, que puede ser mortal en pacientes de edad avanzada, pacientes con insuficiencia renal, diabéticos, pacientes tratados de forma concomitante con otros medicamentos que puedan aumentar los niveles de potasio y/o pacientes con otros episodios clínicos concurrentes. Debe evaluarse la relación beneficio riesgo cuando se valore la posibilidad de utilizar concomitantemente medicamentos que afectan el sistema renina-angiotensina-aldosterona.

Los principales factores de riesgo a tener en cuenta en relación con la hiperpotasemia son: Diabetes mellitus, insuficiencia renal, edad (>70 años).

**Combinación con uno o más medicamentos que afectan el sistema renina-angiotensina-aldosterona y/o suplementos de potasio como:** sustitutos de la sal que contienen potasio, diuréticos ahorradores de Na, antagonistas de la ECA, antagonistas de los receptores de la angiotensina II, medicamentos antiinflamatorios no esteroideos (AINEs, incluyendo inhibidores selectivos de la COX-2), heparina, inmunosupresores (ciclosporina o tacrolimus) y trimetoprim. Otros episodios clínicos concurrentes, en particular deshidratación, descompensación cardíaca aguda, acidosis metabólica, empeoramiento de la función renal, empeoramiento repentino de la enfermedad renal (por ejemplo, enfermedades infecciosas), lisis celular (por ejemplo isquemia aguda de las extremidades, rabdomiolisis, traumatismo intenso). Se recomienda la estrecha monitorización de los niveles de potasio en suero en pacientes de riesgo.

**Diferencias étnicas:** Al igual que sucede con los inhibidores de la enzima convertidora de la angiotensina, telmisartán y otros antagonistas de los receptores de la angiotensina II son, aparentemente, menos eficaces en la disminución de la presión arterial en la población de raza negra que en las demás, posiblemente, por una mayor prevalencia de niveles bajos de renina entre la población hipertensa de raza negra.

**Otras:** Como sucede con cualquier fármaco antihipertensivo, un descenso excesivo de la presión arterial en pacientes con cardiopatía isquémica o enfermedad cardiovascular isquémica, puede producir un infarto de miocardio o un ictus.

**Advertencias sobre excipientes:** Este medicamento contiene sorbitol. Los pacientes con intolerancia hereditaria a la fructosa no deben tomar este medicamento.

**Uso en niños:** No existe información sobre la seguridad y la eficacia de Telmisartán en niños ni en adolescentes.

**Uso en ancianos:** No es necesario un ajuste de dosis.

## Uso durante el embarazo y la lactancia

**Embarazo:** No se debe iniciar ningún tratamiento con Antagonistas de los Receptores de la Angiotensina II (ARA II) durante el embarazo. Salvo que se considere esencial continuar el tratamiento con los ARAII, las pacientes que estén planeando quedarse embarazadas deberán cambiar a un tratamiento antihipertensivo alternativo que tenga un perfil de seguridad conocido para su uso durante el embarazo. Cuando se diagnostique un embarazo, deberá interrumpirse inmediatamente el tratamiento con los ARAII, y si procede, iniciar un tratamiento alternativo.

**Lactancia:** Puesto que no existe información relativa a la utilización de este medicamento durante la lactancia, se recomienda no administrar telmisartán durante este periodo. Es preferible cambiar a un tratamiento cuyo perfil de seguridad en el periodo de lactancia sea más conocido, especialmente en recién nacidos o prematuros.

**Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas.**

No se han realizado estudios que sugieran que telmisartán afecte la capacidad para conducir y utilizar máquinas. Sin embargo, al conducir vehículos o manejar maquinaria, debe tenerse presente que con el tratamiento antihipertensivo pueden producirse, ocasionalmente, mareos o somnolencia.

## RESTRICCIONES DE USO:

Este producto se debe administrar con restricción en pacientes con antecedentes de insuficiencia hepática y renal, obstrucción de las vías biliares, estenosis de la arteria renal, estenosis aórtica y mitral, cardiopatía obstructiva, hipercalemia.

## INTERACCIONES:

Los estudios de interacciones se han realizado sólo en adultos.

### Uso concomitante no recomendado

**Diuréticos ahorradores de potasio o suplementos de potasio:** Los antagonistas de los receptores de la angiotensina II, tales como telmisartán, disminuyen la pérdida de potasio debida a los diuréticos. Los diuréticos ahorradores de potasio, como por ejemplo espironolactona, eplerenona, triamtereno o amilorida, los suplementos de potasio, o los sustitutos de la sal que contienen potasio, pueden conducir a un aumento significativo de los niveles de potasio en suero. Si está indicado el uso concomitante debido a hipopotasemia documentada, deben utilizarse con precaución y debe monitorizarse con frecuencia el nivel de potasio en suero.

**Litio:** 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 y con antagonistas de los receptores de la angiotensina II, incluyendo telmisartán. Si se considera necesario el uso de esta combinación, se recomienda la estrecha monitorización de los niveles de litio en suero.