

Loctenk - Losartán Potásico

Comprimidos recubiertos

Venta bajo receta

Industria Argentina

► **Formula:** Cada comprimido recubierto contiene: **Losartán potásico 50 mg.** Excipientes autorizados: Lactosa monohidrato, Celulosa microcristalina, Almidón glicolato sódico, Talco, Estearato de magnesio, Cubierta gastro soluble (compuesta por: HPMC, PEG 6000, aceite de castor, talco, dióxido de titanio), Amarillo quinolina LA, Eritrosina LA, Croscarmelosa sódica, Sacarina sódica, alcohol etílico, agua purificada, c.s.

Cada comprimido recubierto contiene: **Losartán potásico 100 mg.** Excipientes autorizados: Lactosa monohidrato, Celulosa microcristalina, Almidón glicolato sódico, Talco, Estearato de magnesio, Cubierta gastro soluble (compuesta por: HPMC, PEG 6000, aceite de castor, talco, dióxido de titanio), Amarillo ocaso LA, Rojo Allura LA, Sacarina sódica, Croscarmelosa sódica, alcohol etílico, agua purificada, c.s.,

► **Acción terapéutica:** Antihipertensivo antagonista de los receptores de la angiotensina II (tipo AT I)

► **Indicaciones:** Hipertensión arterial esencial leve a moderada. Insuficiencia cardíaca congestiva.

► **Características farmacológicas / propiedades**

Acción farmacológica: Losartán potásico es el primer derivado de una nueva generación de fármacos llamados antagonistas de la angiotensina II (tipo AT I) que desarrolla un gradual y prolongado efecto sobre los valores sistodiológicos de sujetos hipertensos. Se trata de una sustancia sintética derivada del bifenetilazolo, de naturaleza no peptídica, que por su semejanza estructural compite con el receptor específico de la angiotensina II inhibiendo de esta manera su unión con este agonista endógeno. Su elevada afinidad y especificidad *in vitro* e *in vivo* sobre los receptores AT I de la angiotensina II, localizados preferentemente en el músculo liso vascular y otras estructuras, (miocardio, riñón, cerebro, suprarrenal), y su comportamiento como un antagonista puro sin efecto agonista parcial, lo destacan como un agente antihipertensivo eficaz y seguro. A diferencia de su antecesor, la saralinasina de uso endovenoso en infusión continua, el losartán potásico es activo por vía oral, en dosis de 50 mg diarios en una toma única.

Farmacocinetica: Luego de su administración oral este derivado imidazólico benzisotiazolado sufre una biotransformación hepática (efecto de primer paso) que reduce significativamente su absorción sistémica a un 33% y produce un metabolito activo, el ácido S-carboxílico, de larga vida media, que contribuye a prolongar su acción antihipertensiva durante las 24 horas con una sola toma diaria, gracias a esta acción aditiva o de suma entre la droga y su metabolito activo. La vida media plasmática es de 2,3 horas para el losartán potásico y de 6,7 horas para el metabolito activo, en tanto que la proporción que se une a las proteínas es de alrededor del 99%. La absorción digestiva del fármaco no es afectada por la presencia de alimentos en el estómago, luego de la administración de una dosis única oral de 50 mg alcanza el pico plasmático máximo a los 60 minutos, con un volumen de distribución de 34 L, aproximadamente, sin que se observe fenómeno acumulativo con la administración continua y prolongada incluso en dosis elevadas (100 mg). La excreción, seguida con la molécula del principio activo marcada con ¹⁴C, mostró un 35% de eliminación por la orina y un 58% por las heces. Los estudios clínicos doble ciego con losartán potásico en pacientes con hipertensión esencial leve a moderada mostraron buena respuesta antihipertensiva sisto-diastólica en comparación con beta-bloqueantes (atenolol), diuréticos (hidroclorotiazida) y antagonistas de calcio. La tolerancia medicamentosa del losartán potásico, así como también su inocuidad y seguridad, fueron confirmadas por su uso crónico; se destaca la menor incidencia de tos (3%) en comparación con la registrada con los inhibidores de la ECA (10%). No se registró efecto rebote en los valores tensionales de pacientes hipertensos que redujeron o suspendieron el losartán potásico.

► **Posología y forma de administración:** La dosificación inicial y de mantenimiento usual para la mayoría de los pacientes es de 50 mg una vez al día. El efecto antihipertensivo máximo se alcanza luego de 3 a 6 semanas de iniciado el tratamiento. Algunos pacientes pueden obtener un beneficio adicional aumentando la dosis a 100 mg por día.

En los pacientes que tienen disminuido el volumen intravascular (por ejemplo, los tratados con diuréticos a altas dosis) se debe considerar la posibilidad de una dosis inicial de 25 mg una vez al día (ver "Precauciones"). No es necesario hacer ningún ajuste inicial de la dosificación en los pacientes de edad avanzada o con deterioro renal, incluyendo los que están en diálisis. Se debe considerar una dosificación mas baja en los pacientes con antecedentes de deterioro hepático (ver "Precauciones"). **Loctenk** puede administrarse junto con otros agentes antihipertensivos. Puede administrarse con o sin alimentos.

► **Contraindicaciones:** pacientes hipersensibles a cualquiera de los componentes. Embarazo. Lactancia. Niños.

► **Advertencias:** Los pacientes en tratamiento con **Loctenk** (comprimidos recubiertos) no deben recibir suplementos de potasio o sustitutos de la sal que contengan potasio debido a la posibilidad de desarrollar hiperkalemia. Los pacientes que tienen disminuido el volumen intravascular (por ejemplo, los tratados con altas dosis de diuréticos) pueden presentar síntomas de hipotensión. Se debe corregir la hipovolemia antes de administrar **Loctenk** o se debe utilizar una dosificación inicial menor (ver "Posología y forma de administración").

En base a los datos farmacocinéticos que demuestran un aumento significativo de las concentraciones plasmáticas de losartán potásico en pacientes cirróticos, se debe considerar el empleo de una dosificación menor en los pacientes con antecedente de deterioro hepático. Otros medicamentos que afectan el sistema renina-angiotensina pueden aumentar la urea sanguínea y la creatinina sérica en pacientes con estenosis bilateral de las arterias renales o de la arteria

de un riñón único. Aunque no se ha confirmado, puede ocurrir lo mismo con los antagonistas de los receptores de angiotensina II.

► **Precauciones:**

Embarazo: cuando se usan durante el segundo y tercer trimestre del embarazo, los medicamentos que actúan directamente sobre el sistema renina-angiotensina pueden causar daños o incluso la muerte del feto. Si la paciente se embaraza, se debe suspender la administración de losartán potásico lo más pronto posible. Aunque no hay experiencia con el uso de losartán potásico en mujeres embarazadas, los estudios en animales han demostrado lesiones y muertes fetales y neonatales, que al parecer son mediadas farmacológicamente por los efectos sobre el sistema renina-angiotensina. En el feto humano la perfusión renal, que depende del desarrollo del sistema renina-angiotensina, se inicia en el segundo trimestre, por lo que el riesgo para el feto aumenta si losartán potásico se administra durante el segundo o tercer trimestre del embarazo.

Madres lactantes: no se sabe si el losartán potásico es excretado con la leche humana. Como muchos medicamentos si son excretados por esa vía, y debido al riesgo de efectos adversos en el lactante, se debe decidir si se suspende la lactancia o no se administra el medicamento, teniendo en cuenta la importancia de este para la madre.

Empleo en niños: no se ha determinado la seguridad y eficacia en niños.

Empleo en pacientes de edad avanzada: del total de pacientes tratados con losartán potásico en los estudios clínicos controlados, 91 (19%) tenían 65 años o más, y 37 (2%) tenían 75 años o más. No se observó ninguna diferencia general en la eficacia o la seguridad de losartán potásico entre esos pacientes y otros más jóvenes.

Interacciones: los estudios *in vitro* han demostrado una inhibición significativa de la formación del metabolito activo del losartán potásico por los inhibidores del citocromo P450 3A4 (ketoconazol-troleandomicina-gotestodeno), el P450 2C9 (sulfafenazol) y una inhibición casi completa por la asociación de sulfafenazol y ketoconazol. No se ha identificado ninguna interacción farmacológica de importancia clínica con los siguientes compuestos que se han estudiado en ensayos farmacocinéticos clínicos: hidrocortizida, digoxina, warfarina, cimetidina y fenobarbital.

► **Reacciones adversas:** **Loctenk** es generalmente bien tolerado. Usualmente, los efectos colaterales son leves y pasajeros no se hace necesario suspender el tratamiento. La incidencia total de efectos colaterales reportados con losartán potásico fue similar a la observada con un placebo. En los ensayos clínicos controlados en pacientes con hipertensión esencial, el mareo fue el único efecto colateral reportado como relacionado con el medicamento; ocurrió con una incidencia mayor que con el placebo en un 1% ó más de los pacientes tratados con losartán potásico. La incidencia de tos reportada (3,1%) no fue significativamente mayor que la del placebo (2,6%). Además se observaron efectos ortostáticos relacionados con la dosis en menos de 1% de los pacientes. Hubo raros casos de erupción cutánea, aunque en los ensayos clínicos controlados su incidencia fue menor que con el placebo. Pruebas de laboratorio: en los ensayos clínicos controlados rara vez se asociaron con la administración de losartán potásico, cambios clínicamente importantes en los parámetros de laboratorio usuales. Ocurrió hiperpotasemia (potasio sérico > 5,5 mEq/l) en 1,5% de los pacientes, pero no hizo necesario suspender el tratamiento con losartán potásico. Hubo raros casos de aumento de la alanina-aminotransferasa, que generalmente cesaron al suspender el tratamiento.

► **Sobredosificación:** los datos relativos a la sobredosificación en seres humanos son limitados. Las manifestaciones más probables de la sobredosificación serían hipotensión y taquicardia. Podría ocurrir bradicardia por estimulación parasimpática (vagal). Si ocurre hipotensión sintomática, se debe establecer tratamiento de sostén. Ni el losartán potásico ni su metabolito activo se pueden extraer por hemodialisis.

Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al Hospital más cercano o comunicarse con los centros de toxicología:
Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez: (011) 4962-6666/2247
Hospital A. Posadas: (011) 4654-6648/4658-7777
Hospital de Niños Pedro de Elizalde: (011) 4300-2115
u otros Centros de Intoxicaciones.

► **Información para el paciente:** ANTES DE USAR ESTE MEDICAMENTO CONSULTE A SU MÉDICO. ESTE MEDICAMENTO HA SIDO PRESCRIPTO PARA SU PROBLEMA MÉDICO ACTUAL NO LO RECOMIENDE A OTRAS PERSONAS.

► **Conservación:** conservar en sitio fresco y seco (preferiblemente entre 15° y 30°C) MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS

► **Presentaciones:**

Envases conteniendo 15, 20, 30, 40, 50 y 60 comprimidos recubiertos.
Envases conteniendo 100, 250, 500 y 1000 comprimidos recubiertos de uso hospitalario exclusivo.

Biotenk®

Industria Argentina - Especialidad medicinal autorizada por el Ministerio de Salud. Certificado Nro.: 47.997
Biotenk S.A. Zuviria 5747, Capital Federal.
Directora Técnica: Silvia G. Balanian - Farmacéutica
Fecha de última revisión: Septiembre de 2007