

EPLERENONA

La eplerenona es un antihipertensivo y un antagonista de la aldosterona que está indicada en el tratamiento standard que incluye a los betabloqueantes, para reducir el riesgo de la morbimortalidad cardiovascular en pacientes estables con disfunción sistólica ventricular izquierda menor o igual al 40% y evidencia clínica de insuficiencia cardíaca congestiva después de un infarto agudo de miocardio reciente.

La eplerenona también se indica para el tratamiento de la hipertensión arterial sola o asociada a otros antihipertensivos, ya que la reducción de la presión arterial, lleva a la reducción del riesgo de eventos cardiovasculares, especialmente los accidentes cerebrovasculares y el infarto de miocardio. Además se la utiliza en el diagnóstico y tratamiento de las enfermedades causadas por una producción anormalmente elevada de la aldosterona.

La eplerenona pertenece al grupo de medicamentos denominados bloqueantes selectivos de la aldosterona. Este fármaco actúa uniéndose a los receptores mineralocorticoides y de ese modo impide la unión de la aldosterona, que es la hormona del sistema renina-angiotensina-aldosterona involucrada en la regulación de la presión arterial y en la fisiopatología de la enfermedad cardiovascular. Este medicamento se presenta en comprimidos y comprimidos recubiertos.



Dosis y Administración:

Insuficiencia cardíaca congestiva después de un infarto de miocardio:

Dosis recomendada: 50 mg por día.

Iniciar el tratamiento con la dosis de 25 mg una vez por día y aumentarla hasta alcanzar la dosis recomendada de 50 mg una vez por día, preferentemente dentro de las 4 semanas, según la tolerancia del paciente.

La eplerenona se puede administrar con o sin alimentos.

Se aconseja medir el potasio sérico antes de iniciar el tratamiento con eplerenona, en la primera semana y al mes del inicio del tratamiento o del ajuste de la dosis. Luego se debe valorar periódicamente el potasio sérico según la necesidad.

Una vez iniciado el tratamiento se deberá ajustar la dosis de eplerenona en base a las concentraciones séricas de potasio según se muestra en la tabla.

Se advierte que no debe iniciarse el tratamiento con eplerenona en aquellos pacientes con niveles de potasio sérico mayor a 5,5 mEq/litro (mmol/litro) ya que la mayor incidencia de hiperpotasemia se produce dentro de los 3 primeros meses de tratamiento.

Hipertensión:

Dosis inicial recomendada: 50 mg administrado 1 vez por día.

El efecto terapéutico se obtiene dentro de las 4 semanas de iniciado el tratamiento.

En los pacientes que responden inadecuadamente al tratamiento con 50 mg una vez por día se debe aumentar la dosis a 50 mg 2 veces por día.

No es aconsejable administrar dosis más altas debido a que no ejerce un mayor efecto sobre la tensión arterial. Además se debe tener en cuenta que con dosis mayores de 100mg diarios hay un mayor riesgo de hiperpotasemia.

No es necesario ajustar la dosis inicial en pacientes ancianos o en la insuficiencia hepática leve o moderada. Se deberán determinar las concentraciones séricas de potasio antes de iniciar el tratamiento con eplerenona durante la primera semana y al mes después de iniciar el tratamiento o ajustar la dosis. Posteriormente se deberá controlar periódicamente el potasio sérico.

En todos los pacientes que toman eplerenona y agregan a su tratamiento un inhibidor moderado de CYP3A4 como eritromicina, saquinavir, verapamilo o fluconazol, se recomienda disminuir la dosis inicial a 25 mg diarios.

Concentraciones séricas de potasio (mEq/litro)	Ajuste de la dosis
<5,0	Aumentar de 25 mg día por medio a 25 mg una vez al día Aumentar de 25 mg al día a 50 mg una vez al día
5,0 -5,4	Ninguno
5,5 -5,9	Disminuir de 50 mg al día a 25 mg al día Disminuir de 25 mg al día a 25 mg cada dos días Disminuir de 25 mg cada dos días hasta suspender el tratamiento
≥ 6,0	Suspender el tratamiento. Se podrá volver a empezar el tratamiento con dosis de 25 mg día por medio cuando las concentraciones de potasio sérico sean inferiores a < 5,5 mEq/L.

Reacciones adversas:

Las reacciones adversas más frecuentes de la eplerenona son la hiperpotasemia y el incremento de la creatinina sérica.

Otros efectos secundarios presentados son:

Generales: ocasionalmente mareos, fatiga, síndrome pseudogripal, cefaleas y malestar general.

A nivel cardiovascular es frecuente la hipotensión arterial. Ocasionalmente se observa fibrilación auricular, insuficiencia cardíaca izquierda, hipotensión postural, arritmias cardíaca, infarto de miocardio o trombosis arterial de miembros inferiores.

A nivel renal, las más frecuentes son una función renal anormal, hiperpotasemia que se manifiesta por calambres musculares, diarrea, náuseas, mareos o dolor de cabeza, así como aumento de creatinina. Raramente se observa hipopotasemia, pielonefritis o proteinuria.

A nivel gastrointestinal son frecuentes las diarreas y las náuseas. Y raramente se observa flatulencia, vómitos o dolor abdominal.

A nivel endócrino es poco frecuente observar ginecomastia y mastodinia en hombres, y sangrado vaginal anormal en mujeres.

A nivel dermatológico raramente tienen prurito, aumento de sudoración o exantema.

A nivel metabólico, ocasionalmente algunos pacientes presentan hipercolesterolemia, hipertrigliceridemia, hiponatremia, deshidratación o aumento de urea en sangre.

A nivel hematológico se presenta ocasionalmente eosinofilia.

A nivel osteomuscular son poco frecuentes los dolores de espalda o los calambres en los miembros inferiores.

A nivel psiquiátrico, ocasionalmente los pacientes tienen insomnio.

Precauciones y advertencias:

No se debe utilizar eplerenona si el paciente es alérgico a este principio activo o a los demás componentes de la fórmula farmacéutica.

Se advierte que la eplerenona puede provocar hiperpotasemia por su mecanismo de acción. A su vez esta hiperpotasemia puede causar arritmias cardíacas severas, de ahí que para minimizar el riesgo de hiperpotasemia se deben seleccionar los pacientes, evitando ciertos tratamientos concomitantes y efectuando el control del potasio sérico al comenzar el tratamiento y ante cualquier ajuste de dosis.

Asimismo se recomienda el control periódico, especialmente en pacientes con mayor riesgo de desarrollar hiperpotasemia, como ser pacientes ancianos, diabéticos o con insuficiencia renal.

Se advierte que no se recomienda el empleo de suplementos de potasio después del inicio del tratamiento con eplerenona.

Se debe tener en cuenta que la reducción de la dosis de eplerenona disminuye los niveles de potasio sérico.

Se recomienda no usar eplerenona en los pacientes con galactosemia congénita, con síndrome de mala absorción de glucosa y galactosa o con deficiencia de lactasa.

La eplerenona se debe administrar con precaución en pacientes que presentan insuficiencia cardíaca congestiva luego de un infarto de miocardio, con concentraciones séricas de creatinina mayor de 2 mg/dl en hombres y de 1,8 mg/dl en mujeres o una depuración de creatinina menor o igual a 50 ml/min.

Asimismo se debe tratar con precaución en pacientes diabéticos con insuficiencia cardíaca congestiva después de un infarto de miocardio, si presentan proteinuria. Se aconseja no administrar eplerenona en pacientes con insuficiencia hepática leve o moderada.

Se advierte que la eplerenona se debe utilizar durante el embarazo únicamente en caso de ser sumamente necesario y si el médico tratante considera que el beneficio justifica el riesgo potencial para el feto.

Se debe tener en cuenta que debido a que se desconoce el potencial de efectos adversos en el lactante, se deberá decidir si continuar la lactancia o interrumpir el tratamiento teniendo en cuenta la importancia del medicamento para la madre.

No se ha demostrado el uso, la eficacia y la seguridad de la eplerenona en pediatría.

Si bien no se observaron diferencias en la incidencia total de eventos adversos entre las personas de edad avanzada y las más jóvenes; no obstante y debido a la disminución de la depuración de creatinina relacionada con la edad, la incidencia de hiperpotasemia confirmada por laboratorio aumenta en pacientes mayores de 65. Se advierte que los comprimidos de este medicamento contienen lactosa, lo que deberá ser tenido en cuenta en aquellos pacientes con problemas de absorción de glucosa o galactosa, galactosemia o insuficiencia de lactasa.

Se aconseja no conducir ni operar maquinarias, sobre todo al inicio del tratamiento, ya que pueden presentarse mareos.

Interacciones:

La eplerenona interactúa con distintos medicamentos, como ser:

Diuréticos ahorradores de potasio y suplementos de potasio: debido al riesgo aumentado de hiperpotasemia, no se debe administrar eplerenona a pacientes que reciben diuréticos ahorradores de potasio y/o suplementos de potasio.

Litio: si bien no se han realizado estudios de interacción de eplerenona con litio; sin embargo se ha descrito toxicidad producida por litio en pacientes que tomaban litio conjuntamente con diuréticos e inhibidores de ECA. Por lo tanto se debe evitar la administración conjunta de eplerenona y litio. Si esto fuera necesario, se debe controlar la concentración sérica de litio con frecuencia.

Ciclosporina, tacrolimus: estos medicamentos pueden alterar la función renal y aumentar el riesgo de hiperpotasemia, por lo tanto se debe evitar el uso concomitante de eplerenona con ciclosporina o tacrolimus. En los casos que estos medicamentos deban ser utilizados, se recomienda controlar frecuentemente el potasio sérico y la función renal.

Antiinflamatorios no esteroides (AINES): el tratamiento con este grupo de fármacos puede provocar insuficiencia renal aguda porque actúan directamente sobre la filtración glomerular, especialmente en pacientes con riesgo aumentado, como los pacientes mayores y/o los deshidratados. De ahí que se deba hidratar adecuadamente y controlar la función renal antes de iniciar el tratamiento en los pacientes que reciben conjuntamente eplerenona y AINES.

Trimetoprima: La administración simultánea de trimetoprima con eplerenona aumenta el riesgo de hiperpotasemia. Por lo tanto se debe controlar el potasio sérico y la función renal, particularmente en pacientes de edad avanzada o con insuficiencia renal.

Inhibidores de la ECA y antagonistas de los receptores de angiotensina II: la administración conjunta de eplerenona e inhibidores de la ECA, como el enalapril, o antagonistas de los receptores de angiotensina II se debe realizar con precaución, ya que la asociación de eplerenona con estos fármacos puede aumentar el riesgo de hiperpotasemia en pacientes con riesgo aumentado de insuficiencia renal, por ejemplo en los pacientes de edad avanzada.

Bloqueantes alfa 1-adrenérgicos (por ej. Prazosin, alfuzosina): cuando se administran conjuntamente los bloqueantes alfa 1-adrenérgicos con eplerenona, existe un aumento potencial del efecto hipotensor y/o de la hipotensión postural.

Glucocorticoides, tetracosactida: la asociación de estos medicamentos con eplerenona puede disminuir potencialmente el efecto antihipertensivo (retención de sodio y líquidos).

Antidepresivos tricíclicos como amitriptilina o amoxapina y neurolépticos como clorpromazina o haloperidol, así como la amifostina o el baclofeno asociados con eplerenona pueden ocasionar una disminución de la presión sanguínea y la aparición de mareos al levantarse.

Hierba de San Juan: su uso con eplerenona puede aumentar el metabolismo de esta última y por lo tanto reducir su efecto.

Contraindicaciones:

Está contraindicado el uso de la eplerenona en aquellos pacientes con hipersensibilidad a este fármaco o a cualquiera de los componentes de la fórmula farmacéutica.

También está contraindicada en la galactosemia congénita, en el síndrome de mala absorción de glucosa y galactosa o deficiencia de lactasa.

No se debe administrar este medicamento en pacientes con potasio sérico superior a 5.5 mEq/litro (mmol/litro) al comienzo del tratamiento ni en aquellos con insuficiencia renal severa con un clearance de creatinina menor o igual a 30 ml/min.

La eplerenona está contraindicada en pacientes con insuficiencia hepática severa.

No se debe usar en pacientes con tratamiento simultáneo con inhibidores potentes del CYP3A4 (por ejemplo: ketoconazol, ritonavir, nelfinavir, itraconazol, claritromicina, telitromicina y nefazodona).

Está contraindicada para el tratamiento por hipertensión en diabetes tipo2 con microalbuminuria. Tampoco se debe administrar en los pacientes con una creatinina sérica mayor de 2 mg/dl en varones y mayor de 1,8 mg/dl en mujeres, ni en aquellos con un clearance de creatinina menor a 50 ml/minuto.

Está contraindicado el uso de la eplerenona en los pacientes que estén con tratamiento simultáneo con amilorida, triamtireno o espironolactona y con suplementos de potasio.

Sobredosificación:

No se ha descrito ningún caso de sobredosis con eplerenona. La manifestación más probable de ocurrir sería la hipotensión y/o la hiperpotasemia. La eplerenona no se elimina por hemodiálisis, pero se une en forma considerable a carbón activado.

Ante una posible sobredosificación se debe concurrir al hospital más cercano o comunicarse con un centro de toxicología.

NOMBRE	PRINCIPIO ACTIVO	PRESENTACION	LABORATORIO
ALDACTONE EP 25 MG	Eplerenona	Comprimido recubierto	Pfizer
ALDACTONE EP 50 MG	Eplerenona	Comprimido recubierto	Pfizer
DILACOR 25	Eplerenona	Comprimido	Temis-Lastaló
DILACOR 50	Eplerenona	Comprimido	Temis-Lastaló
EPLERONA 25	Eplerenona	Comprimido recubierto	Gador
EPLERONA 50	Eplerenona	Comprimido recubierto	Gador
ETILES	Eplerenona	Comprimido recubierto	Laboratorios Bernabó
LANX EP 25 MG	Eplerenona	Comprimido recubierto	Elea
LANX EP 50 MG	Eplerenona	Comprimido recubierto	Elea
OLDREN	Eplerenona	Comprimido recubierto	Roemmers
SUFICARD	Eplerenona	Comprimido recubierto	Ivax Arg.

www.cofa.org.ar

