

LERCANIDIPINA

La lercanidipina es un antagonista cálcico dihidropiridínico, altamente lipofílico que está indicado en el tratamiento de la hipertensión arterial leve a moderada.

Este fármaco actúa inhibiendo la entrada del ion calcio al interior de las células del músculo liso y cardíaco. También disminuye la resistencia periférica debido a que posee un efecto relajante directo sobre la musculatura vascular lisa. Además, la elevada selectividad vascular de la lercanidipina le permite producir vasodilatación sin efecto inotrópico negativo.

Este fármaco se caracteriza por no presentar la taquicardia refleja que acompaña a la hipotensión que genera debido a que el comienzo de su acción es lento. En parte este efecto se debe a su elevada lipofiliadad y su capacidad para concentrarse en la bicapa lipídica de la membrana celular, lo que le permite lograr su efecto pico a las 5-7 horas y una duración prolongada de 24 horas.

La mayor parte de la dosis de la lercanidipina ingerida se degrada porque sufre un considerable metabolismo de primer paso y es por ello que se debe administrar al menos 15 minutos antes de las comidas ya que su absorción aumenta aproximadamente cuatro veces cuando se ingiere con alimentos, principalmente aquellos con un alto grado de materias lipídicas.

La lercanidipina se une en un 98% a las proteínas plasmáticas y presenta una importante biotransformación en el hígado por la isoenzima citocromo P450 3A4. Si bien no se observaron cambios de los parámetros farmacocinéticos en los pacientes ancianos o en los pacientes con insuficiencia hepática o renal leve o moderada es de notar que en los pacientes con insuficiencia hepática o renal severa es necesario un ajuste de la dosis de lercanidipina. Este medicamento se presenta en comprimidos recubiertos.



Dosis y Administración:

Dosis inicial recomendada: 10 mg una vez al día, ingerido 15 minutos antes del desayuno.

Dosis máxima: 20-30 mg una vez al día

El máximo efecto antihipertensivo de la lercanidipina se obtiene al cabo de 2 semanas de iniciado el tratamiento.

En caso de no observarse respuesta satisfactoria luego de las primeras 2 semanas de tratamiento, la dosis podrá aumentarse a 20 mg/día.

En pacientes con hipertensión más severa o refractaria se podrá asociar con otro agente antihipertensivo (diurético, beta-bloqueante o inhibidor de la enzima convertidora).

Dosis mínimas y máximas: en algunos pacientes se han observado respuestas favorables con la dosis de 5 mg/día (medio comprimido, dosis mínima).

En pacientes con hipertensión más severa o refractaria se ha utilizado dosis de hasta 30 a 40 mg/día (dosis máximas).

Reacciones adversas:

Se ha demostrado que la lercanidipina es muy bien tolerada, por lo tanto la incidencia de los efectos adversos por vasodilatación brusca o excesiva que se observan comúnmente con los antagonistas cálcicos es baja con la dosis de 10 mg o la dosis de 20 mg post administración. Pero la incidencia de estos efectos adversos puede aumentar cuando se usa inicialmente la dosis de 20 mg/día. Es por este motivo que se recomienda iniciar con la dosis de 10 mg/día y luego aumentarla si fuese necesario.

Las reacciones adversas incluyen también rubor, edema, palpitación, taquicardia, cefalea y/o astenia.

Ocasionalmente pueden manifestarse: fatiga, trastornos gastrointestinales (dispepsias, náuseas, vómitos, dolor epigástrico y diarrea), erupción cutánea, somnolencia, mialgia, poliuria y aumento de las transaminasas hepáticas.

Los pacientes que padecen angina de pecho pueden experimentar aumento de la frecuencia, duración y severidad de ataques cardíacos.

Precauciones y advertencias:

Se advierte que la lercanidipina no debe tomarse con jugo de pomelo porque aumenta la concentración plasmática de este fármaco.

También se debe evitar el consumo de bebidas alcohólicas durante el tratamiento con este fármaco.

Se recomienda administrar con precaución a pacientes con falla ventricular izquierda o cardiopatía isquémica.

Se advierte que la lercanidipina debe ser administrada con precaución en aquellos pacientes con disfunción hepática o con disfunción renal leve o moderada, de ahí que el médico tratante deberá realizar los ajustes de dosis correspondientes en el caso de estos pacientes. Pero no se aconseja la administración de lercanidipina a los pacientes con disfunción hepática o renal grave.

Se recomienda especial atención en pacientes con isquemia cardíaca.

No se recomienda el uso de este fármaco en menores de 18 años, debido a que no existe experiencia con su utilización hasta la fecha.

Si bien la lercanidipina en las dosis habituales ha demostrado ser eficaz y bien tolerada en los adultos mayores, no obstante, al igual que con cualquier otro fármaco antihipertensivo que se emplee en este grupo etario, se recomienda precaución al iniciar el tratamiento.

No se aconseja el uso de lercanidipina durante el embarazo o la lactancia.

Teniendo en cuenta que la lercanidipina puede ocasionar vértigos, fatiga y somnolencia, es que se recomienda tener cuidado en el manejo de vehículos o máquinas de cualquier tipo.

Interacciones:

La lercanidipina se metaboliza en el hígado por la isoenzima citocromo P450 3A4; por lo tanto, se debe tener precaución y ajustar la dosis cuando se administra conjuntamente con inhibidores de esta isoenzima como son, por ejemplo: los imidazólicos, la cimetidina, la ciclosporina y la fluoxetina, ya que se incrementaría el efecto hipotensor de la lercanidipina.

Se deberá evitar el uso concomitante de lercanidipina con antimicóticos orales como el ketoconazol o el itraconazol; con antibióticos del tipo macrólidos, como la eritromicina, la claritromicina y la troleandomicina; así como con antivirales orales para el tratamiento de la infección por HIV, porque producen un aumento antihipertensivo de la lercanidipina y una disminución de su metabolismo.

En cambio las drogas que inducen la actividad del citocromo P450 3A4 tales como la fenitoína, la difenilhidantoína, la carbamazepina y rifampicina pueden aumentar el metabolismo de la lercanidipina, disminuyendo así su concentración en sangre y por lo tanto su efecto terapéutico.

Otras sustancias que se metabolizan por el mismo sistema, como ser: la terfenadina, el astemizol, la ciclosporina, la amiodarona, la quinidina, el diazepam, el midazolam, al coadministrarse con la lercanidipina aumentan el efecto de esta última disminuyendo su metabolismo.

La administración simultánea de lercanidipina y bloqueantes adrenérgicos tales como el propanolol y el metoprolol pueden ocasionar un aumento del efecto hipotensivo, ya que ambos tipos de drogas se metabolizan por el mismo sistema enzimático en el hígado.

La administración conjunta de lercanidipina con anticonvulsivantes puede ocasionar una disminución del efecto hipotensor.

Se debe suspender el consumo de alcohol durante el tratamiento con lercanidipina porque puede potenciar la vasodilatación producida por este fármaco.

Contraindicaciones:

La lercanidipina está contraindicada en los pacientes con hipersensibilidad a las dihidropiridinas o a este fármaco.

No debe ser administrada ni durante el embarazo ni en la lactancia.

También esta contraindicada en los pacientes con obstrucción severa en las vías de salida del ventrículo izquierdo, con insuficiencia cardiaca congestiva no tratada, angina inestable o antes de un mes de haber padecido un infarto de miocardio.

Tampoco debe administrarse en los pacientes con insuficiencia hepática o renal severa.

No asociar la lercanidipina ni con jugo de pomelo ni con alcohol.

Sobredosificación:

La sobredosis con lercanidipina podría ocasionar vasodilatación periférica excesiva por lo que es de esperar que el paciente presente hipotensión, taquicardia o bradicardia y deterioro de la consciencia. En este caso se recomienda apoyo y control de signos vitales durante por lo menos 24 horas, debido a la prolongada duración de la acción de la lercanidipina.

Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al hospital más cercano o comunicarse con los centros de Toxicología:

- Hospital A. Posadas: (014) 4654-6648 / 4658-7777
- Centro de Asistencia Toxicológica La Plata – Tel: (0221) 451-5555

NOMBRE	PRINCIPIO ACTIVO	PRESENTACION	LABORATORIO
LERCADIP	<i>Lercanidipina</i>	<i>Comprimidos recubiertos</i>	GADOR