

Lleva la presión al nivel

Rulle 
Telmisartán



INFORMACIÓN PARA PRESCRIBIR AMPLIA (IPP-A)

1. DENOMINACIÓN DISTINTIVA: RULLE

2. DENOMINACIÓN GENÉRICA: TELMISARTAN

3. FORMA FARMACÉUTICA Y FORMULACIÓN: TABLETAS

Cada tableta Contiene:

Telmisartán 40 mg 80 mg

Excipiente, cbp 1 Tableta 1 Tableta

4. INDICACIONES TERAPÉUTICAS:

RULLE contiene telmisartán, un antagonista no peptídico de los receptores de angiotensina II (ARA II), indicado en el tratamiento de la hipertensión arterial esencial. **RULLE** también es empleado para la prevención de morbilidad y mortalidad cardiovascular en pacientes de 55 años o mayores con alto riesgo de enfermedad cardiovascular.

5. FARMACOCINÉTICA Y FARMACODINAMIA:

Farmacocinética: Absorción: Telmisartán se absorbe rápidamente, su biodisponibilidad es variable y depende de la FÁRMACO dosis administrada, tras la administración de 40 y 60 mg, existe una biodisponibilidad del fármaco del 42 y 58%, respectivamente. Los alimentos reducen la biodisponibilidad del fármaco, a dosis de 40 mg se observa una disminución del 6% en el área bajo la curva; y con la dosis de 160 mg la disminución del área bajo la curva es del 20%. La farmacocinética de telmisartán no es lineal en el rango de 20-160 mg, la concentración máxima plasmática (C_{máx}) y, en menor grado, el área bajo la curva de concentración-tiempo aumenta de forma no proporcional con la dosis.

Distribución: Telmisartán se une extensamente a las proteínas plasmáticas (95%), principalmente a la albúmina y a la glicoproteína α -1-ácida y presenta un volumen de distribución de 500 L/Kg. **Metabolismo:** Telmisartán se metaboliza a través de la vía del citocromo P450 por conjugación, el principal metabolito obtenido es el glucoronido; el cual no posee actividad terapéutica. **Eliminación:** Posterior a la administración de una dosis única de telmisartán el glucoronido representa el 11% de la radiactividad en plasma. Más del 97% de la dosis administrada de telmisartán se elimina como fármaco inalterado. La eliminación urinaria acumulativa es < 2% de la dosis. Telmisartán posee una vida media de eliminación de 24 hrs. **Farmacodinamia:** Telmisartán es un antagonista de los receptores de angiotensina II, se han identificado dos subtipos de receptores AT1 y AT2. Telmisartán posee una finidad 3.000 veces mayor por el subtipo AT1 que por el AT2. La angiotensina II es una hormona vasoactiva del sistema renina-angiotensina y juega un papel importante dentro de la

fisiopatología de la hipertensión y de la insuficiencia cardíaca congestiva. Al antagonizar los efectos de la angiotensina II, el telmisartán relaja el músculo liso y en consecuencia produce vasodilatación, aumenta la excreción renal de sodio y agua, reduce el volumen del plasma y disminuye la hipertrofia celular. Telmisartán no inhibe la renina en el plasma ni bloquea los canales iónicos, tampoco inhibe a la enzima convertidora de angiotensina (quininasa II), enzima que también degrada a la bradicinina. Gracias a este efecto específico el telmisartán no afecta la frecuencia cardíaca, la adaptación ortostática después de los cambios posturales pasivos o las consecuencias hemodinámicas del estímulo simpático posterior al ejercicio. Telmisartán tiene un efecto nefroprotector en los pacientes con diabetes mellitus tipo 2, a través de mecanismos independientes de la presión arterial. **6. CONTRAINDICACIONES:** RULLE está contraindicado en casos de hipersensibilidad al telmisartán y/o cualquier componente de la formulación. No se use en el embarazo y la lactancia. No se use en menores de 18 años. No se administre en pacientes con obstrucción biliar o patología hepática severa. **7. PRECAUCIONES GENERALES:** Debido a que telmisartán es un antagonista de los receptores de angiotensina II, pueden incrementarse los valores de potasio y de creatinina, por lo que RULLE debe ser usado con precaución en pacientes con falla renal, también se recomienda monitorear los niveles plasmáticos del potasio y de la creatinina. En los pacientes con enfermedad hepática, incluyendo la originada por obstrucción biliar, se pueden ver incrementados los niveles plasmáticos de telmisartán, se recomienda reajustar la dosis de telmisartán en este tipo de pacientes. **RULLE** debe ser usado con precaución en caso de que el paciente presente hipercalemia, los bloqueadores de angiotensina II, elevan los niveles de potasio en plasma, por lo que se recomienda corregir esta situación y monitorear los niveles plasmáticos de potasio. En pacientes con hipovolemia, incluso aquellos que están sometidos a altas dosis de diuréticos, se recomienda usar con precaución telmisartán pues puede incrementar el riesgo de hipotensión sintomática, por lo que se recomienda corregir la hipovolemia y/o reducir la dosis del diurético antes de iniciar el tratamiento con telmisartán. Debido a que en el hiperaldosteronismo primario se altera el sistema renina-angiotensina, se recomienda el uso con precaución de telmisartán. La disminución excesiva de la presión arterial en pacientes con cardiopatía isquémica puede resultar en un infarto del miocardio o en enfermedad cerebral vascular, por lo

que se recomienda usar con precaución telmisartán en este tipo de pacientes. Los pacientes con aldosteronismo primario generalmente no responden a tratamientos antihipertensivos que actúan mediante inhibición del sistema renina-angiotensina, por lo que telmisartán no es recomendable en estos casos.

8. RESTRICCIONES DE USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA: Telmisartán está clasificado como categoría D por la FDA, se han reportado casos de oligohidramnios, aborto espontáneo y disfunción renal en el recién nacido, durante el segundo y tercer trimestre de embarazo. El uso de telmisartán durante la lactancia no está recomendado. **9. REACCIONES SECUNDARIAS Y ADVERSAS:** Efectos cardiovasculares: Hipotensión severa, taquicardia y bradicardia. Efectos gastrointestinales: Náuseas, dolor abdominal, diarrea, dispepsia y sequedad de boca. Efectos musculoesqueléticos: Artralgia, mialgia, parestesias, dolor lumbar y dolor en miembros inferiores. Efectos dermatológicos: Eritema, eccema, angioedema, urticaria y prurito. Efectos hepáticos: Hepatotoxicidad e incremento de las bilirrubinas. Efectos neurológicos: Ataxia, vértigo, insomnio y somnolencia. Efectos renales: Oliguria, falla renal aguda, incremento del nitrógeno ureico y de la creatinina plasmática, infecciones urinarias. Efectos respiratorios: Infecciones del tracto superior (sinusitis, faringitis, rinitis, etc.). Efectos oftalmológicos: Visión borrosa. Efectos psiquiátricos: Ansiedad, depresión. Efectos hematológicos: Anemia, eosinofilia, trombocitopenia. **10. INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS Y DE OTRO GÉNERO:**

FÁRMACO	INTERACCIÓN
Digoxina	Pueden incrementarse los niveles plasmáticos de digoxina, se recomienda el monitoreo de los niveles plasmáticos de la digoxina, de ser necesario se puede reajustar la dosis o suspender el tratamiento con telmisartán.
Warfarina	Puede observarse disminución de las concentraciones plasmáticas de warfarina, no se afecta el INR.
Suplementos/ sales de potasio, cotrimoxazol, IECA's, diuréticos ahorradores de potasio, (amilorida, espironolactona, triamtereno).	Puede incrementarse el riesgo de hipercalemia, por lo que se recomienda, vigilar los niveles de potasio.
Litio	Pueden aumentar el nivel plasmático de litio y el riesgo de toxicidad, probablemente debido a que reducen su excreción renal. Puede ser necesario reducir la dosis de litio.
AINE's	El uso en conjunto disminuye el efecto antihipertensivo e incrementa el riesgo de falla renal.

11. ALTERACIONES DE PRUEBAS DE LABORATORIO: Se ha observado aumento de la creatinina o aumento de las enzimas hepáticas, durante el tratamiento con telmisartán. Telmisartán incrementa los niveles de creatina fosfoquinasa (CPK) en sangre. **12. PRECAUCIONES Y RELACIÓN CON EFECTOS DE CARCINOGENESIS, MUTAGENESIS, TERATOGENESIS Y SOBRE LA FERTILIDAD:** Hasta el momento no se han reportado efectos teratogénicos, mutagénicos y carcinogénicos. **13. DOSIS Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN:** ORAL Tratamiento de la hipertensión arterial esencial: La dosis recomendada es de 40 mg al día en una sola administración. En los casos en los que no se logra el requerido descenso de la presión arterial puede aumentarse la dosis de telmisartán hasta un máximo de 80 mg en una sola administración diaria. Alternativamente, telmisartán puede administrarse en combinación con diuréticos tiazídicos, por ejemplo, hidroclorotiazida, lo que ha demostrado tener un efecto coadyuvante en el descenso de la presión arterial. Si se considera necesario aumentar la dosis de telmisartán ha de tenerse en cuenta que el efecto antihiperten-

sivo máximo se alcanza generalmente en 4 a 8 semanas de iniciado el tratamiento. En pacientes con hipertensión severa el tratamiento con telmisartán a dosis de hasta 160 mg (solo o en combinación con hidroclorotiazida 12.5-25 mg) por día, resulta efectivo y bien tolerado. Prevención de morbilidad y mortalidad cardiovascular: La dosis recomendada es de 80 mg una vez al día. No se sabe si dosis menores de 80 mg de telmisartán son efectivas en la prevención de morbilidad y mortalidad cardiovascular. Cuando se inicie el tratamiento con telmisartán para la prevención de morbilidad y mortalidad cardiovascular, se recomienda monitorizar la presión arterial, y puede ser necesario un adecuado ajuste de los medicamentos antihipertensivos. Puede tomarse junto con las comidas. Grupos especiales: Pacientes con insuficiencia renal: No se requieren cambios en la posología en caso de insuficiencia renal leve a moderada. La experiencia es limitada en pacientes con insuficiencia renal severa o en hemodiálisis. Telmisartán no se elimina de la sangre por diálisis. Pacientes con insuficiencia hepática: En caso de pacientes con insuficiencia hepática leve a moderada, la dosis de telmisartán no debe exceder los 40 mg en una sola administración diaria. Pacientes ancianos: No es necesario un ajuste de la dosis. Pacientes pediátricos y adolescentes: No se recomienda usar en niños menores de 18 años de edad debido a los datos limitados que existen sobre la seguridad y eficacia. **14. MANIFESTACIONES Y MANEJO DE LA SOBREDOSIFICACIÓN O INGESTA ACCIDENTAL (ANTÍDOTOS):** Los signos y síntomas de una sobredosificación con telmisartán son: Hipotensión, taquicardia y en algunos casos se puede presentar bradicardia. El tratamiento recomendado de la sobredosis va a depender del tiempo transcurrido desde la ingestión, la inducción del vómito y el lavado gástrico se recomiendan como parte de este tratamiento, el uso de carbón activado también puede ser de utilidad, además de medidas generales y de sostén. Aunado a lo anterior se debe monitorizar con frecuencia la creatinina y los electrolitos en suero. En caso de hipotensión el paciente debe ser colocado en decúbito supino, con administración rápida de sales y reposición de la volemia. Telmisartán no se elimina por hemodiálisis. **15. PRESENTACIÓN O PRESENTACIONES:** Caja con 14, 28 o 30 tabletas 40 mg Caja con 14, 28 o 30 tabletas 80 mg **16. RECOMENDACIONES SOBRE ALMACENAMIENTO:** Consérvese la caja bien cerrada. Consérvese a no más de 30° C. **17. LEYENDAS DE PROTECCIÓN:** Literatura exclusiva para médicos. Su venta requiere receta médica. No se deje al alcance de los niños. No se use en el embarazo y la lactancia. No se use en menores de 18 años. Reporte las sospechas de reacción adversa al correo farmacovigilancia@cofepris.gob.mx. **18. NOMBRE Y DOMICILIO DEL LABORATORIO:** Hecho en México por: NEOLPHARMA, S. A. DE C. V. Boulevard de los Ferrocarriles No. 277, Col. Industrial Vallejo, C. P. 02300, Deleg. Azcapotzalco, D. F., México. Para: **LABORATORIOS ALPHARMA, S. A. DE C. V.** Boulevard Pípila No. 1, Esq. Av. del Conscripto, Col. Manuel Ávila Camacho, C. P. 11610, Deleg. Miguel Hidalgo, D. F. México. **19. NÚMERO DE REGISTRO DEL MEDICAMENTO ANTE LA SSA:** Reg. No. 292M2015 SSA IV

