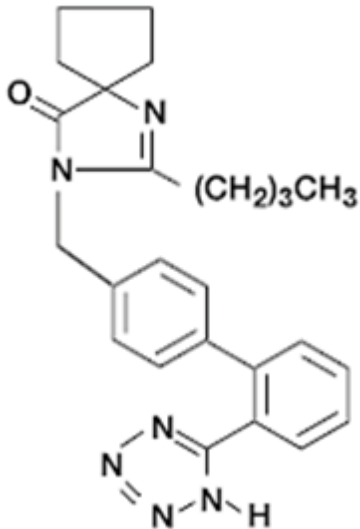


# MONOGRAFIA Irbesartan 150mg y 300mg

MARCA REGISTRADA: **ACEPRESS® (tabletas)**

QUÍMICA DEL PRINCIPIO ACTIVO: <b>Irbesartan 300mg y 150mg</b>	
NOMBRE QUÍMICO: 2-butyl-3-[p-(o-1H-tetrazol-5-ylphenyl)benzyl]-1,3-diazaspiro[4.4]non-1-en-4-one	
FÓRMULA: C <sub>25</sub> H <sub>28</sub> N <sub>6</sub> O	PESO MOLECULAR: 428.53 [g/mol]
SINÓNIMOS: Irbesartán	
ASPECTO DE LA SUSTANCIA: Polvo cristalino blanco o casi blanco	
SOLUBILIDAD: Ligeramente soluble en alcohol y en cloruro de metileno y prácticamente insoluble en agua	



The image shows the chemical structure of Irbesartan. It features a spirocyclic core consisting of a 1,3-diazaspiro[4.4]non-1-en-4-one system. Attached to this core is a butyl group (CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CH<sub>3</sub> and a benzyl group. The benzyl group is further substituted with a phenyl ring that is linked to a 1H-tetrazol-5-yl group.

## Descripción:

Acepress® (irbesartan) es un antagonista de los receptores de la angiotensina II (subtipo AT<sub>1</sub>).

## Farmacología clínica:

Mecanismo de acción:

La angiotensina II es un potente vasoconstrictor derivado de la angiotensina I en una reacción catalizada por la enzima convertidora de angiotensina (ECA). La angiotensina es el principal agente presor del sistema renina-angiotensina, también estimula la síntesis y secreción de aldosterona por la corteza suprarrenal, la contracción cardíaca, la reabsorción de sodio a nivel del riñón, la actividad del sistema simpático y el crecimiento de la fibra muscular lisa. El irbesartan bloquea los efectos vasoconstrictores y secretores de aldosterona de la angiotensina II al unirse selectivamente al receptor de angiotensina II AT<sub>1</sub>.

El irbesartan es un antagonista competitivo específico de los receptores AT<sub>1</sub> con una mayor afinidad (más de 8500 veces) por el receptor AT<sub>1</sub> que por el AT<sub>2</sub>. Además, presenta actividad agonista.

El bloqueo del receptor AT<sub>1</sub> remueve la retroalimentación negativa de la angiotensina II sobre la secreción de renina. No obstante, el incremento resultante en la actividad de la renina plasmática y en el nivel de angiotensina II no revierten los efectos del irbesartan sobre la presión sanguínea.

El irbesartan no inhibe la ECA o la renina, tampoco afecta otros receptores hormonales o canales de iones que estén involucrados en la regulación cardiovascular de la presión arterial y la homeostasis del sodio. Debido a que el irbesartan no inhibe la ECA la respuesta a la bradiquinina no se ve afectada.

## Farmacocinética:

El irbesartan es activo oralmente y no requiere biotransformación en formas activas. La absorción oral del irbesartan es rápida y completa con una biodisponibilidad absoluta de 60 a 80 %. Las concentraciones plasmáticas pico se obtiene de 90 min a 2 horas

después de la dosis. Los alimentos no afectan la biodisponibilidad del irbesartan.

La vida media es de 11 a 15 horas, las concentraciones del estado de equilibrio se alcanzan en 3 días con una acumulación limitada de irbesartan menor al 20 % con dosis repetidas de una vez al día.

## Metabolismo y eliminación:

El irbesartan se metaboliza vía conjugación glucurónico o por oxidación. Se excreta vía renal (20%) y biliar.

## Distribución:

El irbesartan se une en un 90 % a las proteínas plasmáticas. El volumen de distribución es de 53 a 93 L.

## Poblaciones especiales:

Género: No se necesita ajuste de dosis.

Geriatría: No se necesita ajuste de dosis.

Raza: En sujetos de raza negra se ha apreciado un valor de ABC 25 % mayor que en los de raza blanca, aunque no hay diferencias en la C<sub>max</sub>.

Insuficiencia renal: No es necesario ajuste de dosis en el paciente con insuficiencia renal a menos que el paciente con trastorno renal también esté con depleción de volumen.

Insuficiencia hepática: No es necesario ajuste de dosis.

Indicaciones y usos:

Acepress® (irbesartan) está indicado en el tratamiento de la hipertensión. Puede ser usado solo o en combinación con otros fármacos antihipertensivos.

Acepress® (irbesartan) está indicado en el tratamiento de la nefropatía diabética con creatinina sérica elevada y proteinuria (>300 mg/día) en pacientes con diabetes mellitus tipo 2 e hipertensión.

**Contraindicaciones:**

Acepress® (irbesartan) está contraindicado en pacientes con hipersensibilidad a alguno de los componentes de la fórmula.

**Precauciones y advertencias:**

Una reducción excesiva de la presión arterial ha sido rara vez vista en pacientes con hipertensión no complicada. El inicio de la terapia antihipertensiva puede causar hipotensión sintomática en pacientes con un volumen intravascular disminuido o con depleción de sodio (como aquellos tratados vigorosamente con diuréticos o que están en diálisis). Se debe corregir inicialmente la depleción de volumen o comenzar con una dosis más baja de Acepress® (irbesartan).

Como consecuencia de la inhibición del sistema renina-angiotensina-aldosterona se deben anticipar cambios en la función renal de determinados pacientes. En los pacientes cuya función renal depende de la actividad del sistema renina-angiotensina-aldosterona (como los pacientes con insuficiencia cardíaca congestiva) el tratamiento con IECA se ha asociado con oliguria y/o azotemia progresiva y, más raramente, con falla renal. Se espera un efecto similar con Acepress® (irbesartan).

En estudios con IECA se ha apreciado un aumento en la creatinina sérica y el BUN en pacientes con estenosis de la arteria renal unilateral o bilateral. Se espera un efecto similar con Acepress® (irbesartan).

**Interacciones medicamentosas y de otro género:**

El irbesartan no ha mostrado interacción significativa con la hidroclorotiazida, la digoxina, la warfarina y el nifedipino. No se espera interacción con fármacos cuyo metabolismo dependa del citocromo P450 isoenzimas 1A1, 1A2, 2A6, 2B6, 2D6, 2E1 ó 3A4.

**Carcinogénesis, mutagénesis y trastorno de la fertilidad:**

Los estudios en animales de laboratorio no han mostrado potencial carcinogénico, mutagénico ni alteraciones en la fertilidad con el uso de irbesartan.

**Embarazo y lactancia:**

Categoría de riesgo: C en el primer trimestre; D en los trimestres segundo y tercero. Los fármacos que actúan en el sistema renina-aldosterona pueden causar morbilidad fetal y neonatal incluyendo la muerte del feto o del neonato.

Debido al potencial efecto adverso sobre el lactante se debe decidir si se suspende la lactancia para administrar Acepress® (irbesartan) o se busca una terapia alternativa a este, preservando la lactancia, para lo cual se tomará en cuenta la importancia del medicamento para la madre.

**Reacciones adversas:**

El irbesartan no se ha asociado con un incremento de la tos seca

como ocurre con los IECAs. En pacientes con nefropatía diabética los síntomas de ortostatismo se han reportado con más frecuencia.

Los siguientes efectos se han reportado aunque no se ha determinado su relación con el irbesartan:

Cuerpo como un todo: edema facial, edema de la extremidad superior, escalofríos.

Cardiovascular: hipertensión, soplo cardíaco, infarto al miocardio, angina de pecho, arritmias, insuficiencia cardíaca.

Dermatológicos: prurito, dermatitis, equimosis, urticaria, eritema facial.

Endocrino/metabólico/trastorno hipoelectrolítico: disfunción sexual, cambios en la libido, hiperkalemia, gota.

Gastrointestinal: constipación, lesiones orales, gastroenteritis, flatulencia, distensión abdominal, íctero, incremento de los niveles de control de la función hepática.

Musculoesquelético: calambres, artritis, dolor muscular, rigidez articular, debilidad muscular.

Sistema nervioso: trastorno del sueño, somnolencia, trastorno emocional, depresión, parestesia, tremor, ataque transitorio de isquemia.

Renal/genitourinario: trastorno prostático, trastorno urinario.

Respiratorio: epistaxis, traqueobronquitis, congestión, disnea, sibilancias.

Sentidos especiales: trastorno visual, anormalidad en la audición, conjuntivitis, dolor de oído.

**Sobredosis:**

En caso de sobredosis se espera que haya hipotensión, taquicardia, bradicardia. El irbesartan no es removido por hemodiálisis.

**Dosis y administración:**

Acepress® (irbesartan) se administra por vía oral.

Hipertensión: La dosis inicial recomendada es de 150 mg una vez al día. De ser necesario la dosis se puede incrementar a 300 mg una vez al día. Un diurético a dosis baja puede ser agregado. La hidroclorotiazida ha mostrado un efecto aditivo.

Nefropatía en pacientes diabéticos tipo 2: La dosis recomendada es de 300 mg una vez al día.

Pacientes con depleción de volumen o de sal: se recomienda una dosis inicial de 75 mg una vez al día.

**Presentación:**

Acepress® tabletas

Estuche con 30 tabletas. Cada tableta contiene 150 mg de irbesartan.

Estuche con 30 tabletas. Cada tableta contiene 300 mg de irbesartan.

**REFERENCIAS BIBLIOGRÁFICAS:**