HTA Connect II

Comparativa de las características farmacológicas de los ARA II



Características farmacológicas de los ARA-II. ¿Son todos iguales?

Tamargo J, Caballero R, Gómez R, et al. Pharmacological Properties of Angiotensin-II Receptor Antagonists. Do They All Belong to the Same Class of Drugs? Rev Esp Cardiol. 2006;6(Supl C):10-24. DOI: 10.1016/S1131-3587(06)75306-7



Acceso al artículo completo



Diferencias farmacodinámicas

Fármaco	Ki (nM)	CI ₅₀ (nM)	Velocidad de disociación (min)	Índice T/P	
Candesartán	0,49-0,64	0,1	152	>80	
Eprosartán	1,4-3,9	9,43	-	70-85	
E-3174	1,3-3,7	-	31	-	
Irbesartán	0,8-1,5	8,5	17	70	
Losartán	5-40	8,4	2,5	50-70	
Olmesartán	0,8	-	-	60-80	
Telmisartán	0,83-3,7	0,33	75	>50	
Valsartán	2,7-3,2	9,26	56	66	

CI: concentración inhibitoria; índice al T/P: índice pico/valle.

Tamargo J, Caballero R, Gómez R, et al. Características farmacológicas de los ARA-II. ¿Son todos iguales? Rev Esp Cardiol. 2006; 6(Supl C):10-24.



En la afinidad (Ki), **potencia vasodilatadora**, expresada como concentración (nM) que inhibe en un 50% la contracción inducida por la A-II. A menor concentración, mayor potencia del ARA-II para bloquear la unión de la A-II a sus receptores AT1.



En la **velocidad de disociación**. Un ARA-II que se libere **muy lentamente** del receptor AT1, como candesartán (>2 h), tendrá **más posibilidades de controlar la presión a lo largo de las 24 h** y tras la supresión del tratamiento permitirá que la presión arterial se recupere más lentamente que los ARA-II que se disocian muy rápidamente, como losartán (2,5 min).



En la efectividad clínica. El índice T:P (pico/valle) de un fármaco antihipertensivo es la relación aritmética entre la reducción de presión arterial alcanzada al final del intervalo de administración (inmediatamente antes de volver a ingerir la siguiente nueva dosis) con respecto a la máxima reducción por ese fármaco después de su administración.

Cuanto más alto sea este índice, más controlada estará la presión arterial.

Diferencias farmacocinéticas

Comparativa de características farmacocinéticas										
	Candesartán	Eprosartán Cilexetil	Irbesartán	Losartán	Olmesartán	Telmisartán Medoxomilo	Valsartán			
Profármaco	Sí	No	No	No	Sí	No	No			
Biodisponibilidad (%)	42	15	60-80	33	25	50	23			
Semivida (h)	9	5-7	12-17	0,5-2	14	24	6-9			
T _{máx} (h)	3-4	1-2	1,5-2	0,5-2	1,5-2,5	2-31-2				
UPP (%)	99	98	95	99	99	99	95			

Vd (I/kg)	0,1	0,18	0,7-1,2	0,5	0,3	7	0,25
Metabolito activo	Candesartán	No	No	EXP3174	Olmesartán	No	No
Eliminación renal (%)	30	7	20	30	35-50	2	15
Eliminación biliar (%)	60	90	80	70	50-65	98	85
Dosis (mg/día)	4-32	600	75-300	12,5-100	10-40	40-80	80-160

T_{mas}: tiempo máximo para alcanzar la concentración plasmática máxima (C_{más}); UPP: unión a proteínas plasmáticas; Vd: volumen de distribución. Tamargo J, Caballero R, Gómez R, et al. Características farmacológicas de los ARA-II. ¿Son todos iguales? Rev Esp Cardiol. 2006;6(Supl C):10-24.

Otras diferencias

Indicado

Comparativa de indicaciones										
	Candesartán	Eprosartán	Telmisartán	Valsartán						
НТА										
IC					•					
Disfunción ventricular					•		•			
Nefropatía DM2					•					
Reducción riesgo ACV										

Tras infarto de miocardio reciente (12 horas-10 días) IC = insuficiencia cardíaca; DM2 = diabetes mellitus tipo 2; ACV = accidente cerebrovascular.

Cuando no se toleran los IECA*

No indicado

^{*} Hasta la fecha sólo el candesartán ha demostrado que reduce la mortalidad en pacientes con IC sistólica tratados con IECA y bloqueadores beta. Fuente: elaboración propia a partir de las fichas técnicas de los medicamentos (Agencia Española de Medicamentos y Productos Sanitarios. Centro de Información del Medicamento: https://cima.aemps.es/cima/publico/home.html. Último acceso: febrero 2024.

Com	Comparativa de dosis y coste del tratamiento en monoterapia (€)												
Cano	Candesartán Eprosartán		Irbesartán		Losartán		Olmesartán		Telmisartán		Valsartán		
mg	PVP IVA	mg	PVP IVA	mg	PVP IVA	mg	PVP IVA	mg	PVP IVA	mg	PVP IVA	mg	PVP IVA
_		-		-		12,5	1,97	-		-		-	
4	2,5	-		75	3,87	25	2,5	-		20	5	40	2,5
8	5,25	-		150	7,74	50	4,17	10	5,04	40	9,99	80	8,15
16	10,49	600	14,27	300	15,49	100	8,34	20	10,08	80	19,97	160	16,3
32	20,97	-		-		-		40	20,17	-		320	32,6

Las cantidades se refieren a dosis diarias completas que habrá que dividir según el número de tomas.

Datos obtenidos de información en fichas técnicas consultadas en la web de la Agencia Española de Medicamentos y Productos Sanitarios. Centro de Información del Medicamento. Disponible en: https://cima.aemps.es/cima/publico/home.html. Último acceso: febrero 2024.

Y en: https://www.saludcastillayleon.es/portalmedicamento/es/terapeutica/ojo-markov/duda-ieca. Último acceso: febrero 2024. Y en: https://www.sanidad.gob.es/profesionales/nomenclator.do. Último acceso: febrero 2024.

