

NEOPOL®

LABETALOL CLORHIDRATO 20 mg / 4 mL

SOLUCIÓN INYECTABLE
VÍA DE ADMINISTRACIÓN: I.V.

FÓRMULA

Cada 4 mL de solución inyectable contiene:

Labetalol Clorhidrato.....20 mg
Excipientes.....C.S.

ACCIÓN TERAPÉUTICA:

Bloqueante alfa y beta adrenérgico. Vasodilatador. Antihipertensivo.

PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS:

Grupo farmacoterapéutico: C- Sistema cardiovascular, C07- Agentes beta-bloqueantes, C07A- Agentes beta-bloqueantes, C07AG- Agentes bloqueantes alfa y beta. ATC: C07AG01.

El Labetalol es un agente bloqueante alfa - y beta - adrenérgico. Actúa disminuyendo la presión sanguínea por efecto vasodilatador mediante el bloqueo de los receptores alfa adrenérgicos arteriales periféricos y, por ello, reduciendo la resistencia periférica y mediante un bloqueo concurrente de los receptores betaadrenérgicos, protege el corazón de una respuesta simpática refleja que de lo contrario ocurriría.

PROPIEDADES FARMACOCINÉTICAS:

Seguida la infusión intravenosa de Labetalol, la vida media de eliminación es aproximadamente 5,5 horas y el aclaramiento del cuerpo total es aproximadamente 33 mL/min/kg. La vida media del Labetalol en plasma seguida la administración oral es aproximadamente 6 a 8 horas. En los pacientes con la función hepática o renal disminuida, no se altera la vida media de eliminación de Labetalol; sin embargo, la biodisponibilidad relativa en los pacientes dañados hepáticamente se incrementa debido al metabolismo de primer-paso disminuido.

El metabolismo de Labetalol es principalmente a través de la conjugación a metabolitos glucurónidos; éstos están presentes en el plasma y se excretan en la orina y, vía biliar, en las heces. Aproximadamente 55% a 60% de una dosis aparecen en la orina como conjugado o inalterado dentro de las primeras 24 horas de la dosificación.

El Labetalol se ha mostrado cruzar la barrera placentaria en los humanos. Sólo cantidades muy pequeñas cruzan la barrera hematoencefálica según los estudios en animales. Labetalol es enlazado a proteínas en aproximadamente un 50%. Ni la hemodiálisis, ni la diálisis peritoneal remueve una cantidad significativa de Labetalol de la circulación general (< 1%).

INDICACIONES:

Está indicado cuando se requiere una rápida reducción de la presión arterial, sobre todo en la hipertensión severa, incluyendo la del embarazo, inmediatamente después de la fase aguda del infarto de miocardio o para la hipotensión controlada durante la cirugía.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad al Labetalol clorhidrato o a alguno de los excipientes.

Bloqueo auriculoventricular de segundo o tercer grado, shock cardiogénico y otros estados asociados a hipotensión prolongada y grave o a bradicardia grave.

Asma o antecedentes de enfermedad obstructiva de las vías aéreas.

En episodios hipertensivos tras infarto agudo de miocardio, cuando existe vasoconstricción periférica que sugiere bajo gasto cardiaco.

FÓRMULA

Cada 4 mL de solución inyectable contiene:

Labetalol Clorhidrato.....20 mg
Excipientes.....C.S.

ACCIÓN TERAPÉUTICA:

Bloqueante alfa y beta adrenérgico. Vasodilatador. Antihipertensivo.

PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS:

Grupo farmacoterapéutico: C- Sistema cardiovascular, C07- Agentes beta-bloqueantes, C07A- Agentes beta-bloqueantes, C07AG- Agentes bloqueantes alfa y beta. ATC: C07AG01.

El Labetalol es un agente bloqueante alfa - y beta - adrenérgico. Actúa disminuyendo la presión sanguínea por efecto vasodilatador mediante el bloqueo de los receptores alfa adrenérgicos arteriales periféricos y, por ello, reduciendo la resistencia periférica y mediante un bloqueo concurrente de los receptores betaadrenérgicos, protege el corazón de una respuesta simpática refleja que de lo contrario ocurriría.

PROPIEDADES FARMACOCINÉTICAS:

Seguida la infusión intravenosa de Labetalol, la vida media de eliminación es aproximadamente 5,5 horas y el aclaramiento del cuerpo total es aproximadamente 33 mL/min/kg. La vida media del Labetalol en plasma seguida la administración oral es aproximadamente 6 a 8 horas. En los pacientes con la función hepática o renal disminuida, no se altera la vida media de eliminación de Labetalol; sin embargo, la biodisponibilidad relativa en los pacientes dañados hepáticamente se incrementa debido al metabolismo de primer-paso disminuido.

El metabolismo de Labetalol es principalmente a través de la conjugación a metabolitos glucurónidos; éstos están presentes en el plasma y se excretan en la orina y, vía biliar, en las heces. Aproximadamente 55% a 60% de una dosis aparecen en la orina como conjugado o inalterado dentro de las primeras 24 horas de la dosificación.

El Labetalol se ha mostrado cruzar la barrera placentaria en los humanos. Sólo cantidades muy pequeñas cruzan la barrera hematoencefálica según los estudios en animales. Labetalol es enlazado a proteínas en aproximadamente un 50%. Ni la hemodiálisis, ni la diálisis peritoneal remueve una cantidad significativa de Labetalol de la circulación general (< 1%).

INDICACIONES:

Está indicado cuando se requiere una rápida reducción de la presión arterial, sobre todo en la hipertensión severa, incluyendo la del embarazo, inmediatamente después de la fase aguda del infarto de miocardio o para la hipotensión controlada durante la cirugía.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad al Labetalol clorhidrato o a alguno de los excipientes.

Bloqueo auriculoventricular de segundo o tercer grado, shock cardiogénico y otros estados asociados a hipotensión prolongada y grave o a bradicardia grave.

Asma o antecedentes de enfermedad obstructiva de las vías aéreas.

En episodios hipertensivos tras infarto agudo de miocardio, cuando existe vasoconstricción periférica que sugiere bajo gasto cardiaco.

POSOLOGÍA Y MODO DE USO:

El Labetalol es para uso intravenoso en los pacientes hospitalizados. La dosificación debe individualizarse dependiendo de la severidad de la hipertensión y la respuesta del paciente. El objetivo es la obtención de cifras aproximadas a 140/90 mmHg. La presión arterial diastólica no debe descender por debajo de 90 mmHg. Durante la administración, el paciente debe encontrarse siempre en posición supina (boca para arriba) o lateral izquierda. Dejar en reposo al paciente durante 3 horas tras la administración intravenosa (riesgo de caída ortostática de la presión arterial).

Adultos:

Infusión intravenosa repetida: Administrar 20 mg (4 mL) por inyección intravenosa lenta en al menos 1 - 2 minutos. Si la presión arterial no se ha controlado a los 5 - 10 minutos de haber puesto la inyección, administrar una dosis adicional de 20 mg (4 mL). Se administrarán dosis adicionales de 40 mg (8 mL) y después de 80 mg (16 mL) cada 10 minutos hasta que la presión arterial esté controlada, sin sobrepasar la dosis total de 300 mg. El efecto máximo normalmente ocurre dentro de 5 minutos de cada inyección y la duración de la acción normalmente es de aproximadamente 6 horas pero puede ser de 18 horas.

Infusión: también puede ser administrado por infusión intravenosa continua. Para ello, diluir el contenido de 2 ampollas de 20 mL en 160 mL del fluido intravenoso. La solución resultante contiene 1 mg/mL de Labetalol. Se administra mediante un dispositivo de infusión que estará conectado a una bureta de medición para permitir una dosificación más exacta.

Hipertensión no relacionada con el embarazo: La velocidad de infusión debe ser de 2 mg/minuto (2 mL de solución). Después de obtener un resultado satisfactorio, suspender la infusión. La dosis eficaz es de 50 a 200 mg dependiendo de la severidad de la hipertensión. En la mayoría de los casos, una dosis de 200 mg es más que suficiente, pero, excepcionalmente, una dosis de 300 mg puede ser necesaria, sobre todo en pacientes con feocromocitoma. El médico puede necesitar ajustar la velocidad de infusión según la respuesta del paciente al fármaco.

Hipertensión relacionada con el embarazo: La velocidad de infusión inicial es de 20 mg/h, entonces se puede duplicar la dosis cada 30 minutos hasta una reducción de la presión arterial adecuada o una dosis de 160 mg/h. Ocasionalmente pueden ser necesarias dosis más altas.

Crisis de hipertensión después de un infarto agudo de miocardio: Establecer la infusión a una dosis de 15 mg/h, y luego aumentar

en etapas, de acuerdo con los resultados obtenidos hasta 120 mg/h.

Hipotensión controlada durante intervenciones quirúrgicas: En esta indicación, la dosis inicial es de 10 - 20 mg por vía intravenosa en 30 segundos. En los individuos jóvenes y sin anestesia con Halotano, la dosis será algo mayor (25 - 30 mg). El Halotano aumenta el efecto antihipertensivo del Labetalol, por lo que la concentración de Halotano no debe exceder de 1 a 1,5%. Si no recibe la esperada reducción de la presión arterial en el espacio de 5 minutos, se puede administrar Labetalol 5 - 10 mg hasta la aparición del efecto deseado. Después de la inyección de 20 - 25 mg de Labetalol, el efecto antihipertensivo persiste unos 150 minutos en promedio. La reducción de la presión arterial es rápidamente reversible al detener la administración de Halotano y una inyección intravenosa de 0,6 mg de Atropina. Cabe señalar que la ventilación con presión positiva intermitente (IPPV) puede aumentar aún más el efecto antihipertensivo de Labetalol y/o Halotano. Pueden usarse Tubocurarina y pancuronio cuando se requiere la ventilación asistida o controlada.

Niños y adolescentes:

- Hipertensión: Vía intravenosa 0,2 - 1 mg/kg/dosis (dosis máxima: 40 mg) en 1 - 10 min. Se puede repetir en 10 - 15 min sin superar la dosis total de impregnación de 200 mg; debería reservarse su uso para la hipertensión grave.
- Emergencia hipertensiva: Infusión intravenosa continua 0,25 - 3 mg/kg/hora; iniciar en la dosis más baja del rango e ir aumentando lentamente. Se recomienda no bajar la tensión más de un 25-30%.

Insuficiencia renal: el Labetalol es particularmente adecuado para ser utilizado en pacientes hipertensos con disfunción renal.

Insuficiencia hepática: puede ser necesario una reducción de dosis.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

- Prescripción bajo control médico constante.
- Administrar con precaución en caso de diabetes (riesgo de hipoglucemia). El bloqueo beta adrenérgico puede prevenir la aparición de signos predictivos y síntomas (por ejemplo, taquicardia) de hipoglucemia aguda. Esto es especialmente importante con los diabéticos inestables. El beta bloqueo también reduce la liberación de insulina en la respuesta a la hiperglicemia; puede ser por consiguiente necesario ajustar la dosis de las drogas anti-diabéticas.
- Reducir la posología en caso de insuficiencia renal.
- En caso de shock anafiláctico, puede haber riesgo de resistencia al tratamiento con epinefrina.
- Evitar o vigilar la asociación con: mefloquina, digoxina, amiodarona, diltiazem, verapamilo (riesgo de bradicardia); antidepresivos tricíclicos, neurolepticos, otros antihipertensivos (riesgo de hipotensión).
- Vigilar al el recién nacido: riesgo de hipoglucemia, bradicardia, dificultad respiratoria que aparece la mayor parte de veces en las primeras 24 horas y hasta 72 horas después del nacimiento.
- En caso de hipotensión, administrar Ringer lactato para mantener una TA diastólica ≥ 90 mmHg.
- Puede producirse lesión hepatocelular grave; realizar pruebas analíticas adecuadas al primer signo o síntoma de disfunción hepática y si esta se constata o aparece ictericia, deberá suspenderse y no reiniciar Labetalol.
- Riesgo de reacción anafiláctica en pacientes con antecedentes de reacción anafiláctica grave. Erupciones cutáneas o sequedad de ojos: considerar retirada gradual del fármaco.
- Pacientes con reserva cardiaca escasa: el fallo cardiaco debe controlarse con un glucósido cardiaco y un diurético, antes de iniciar Labetalol.
- No es necesario suspender el tratamiento con comprimidos de Labetalol antes de la anestesia, si bien los pacientes deben recibir atropina por vía intravenosa antes de la inducción. El Labetalol por vía intravenosa puede enmascarar las respuestas fisiológicas compensatorias de hemorragia brusca (taquicardia y vasoconstricción).
- Los pacientes, especialmente aquellos con enfermedad cardiaca isquémica, no deben interrumpir/suspender bruscamente la terapia con Labetalol.
- Función Hepática dañada: debe usarse con cautela en los pacientes con la función hepática dañada debido a que el metabolismo del Labetalol puede disminuirse.
- Hipotensión: La hipotensión postural sintomática (incidencia, 58%) es muy probable que ocurra si los pacientes son movidos hacia un lado o se le permite asumir la posición derecha dentro de 3 horas de recibir el Labetalol por vía intravenosa. Por consiguiente, la capacidad del paciente de tolerar una posición derecha debe establecerse antes de permitir cualquier ambulancia.
- Seguida la Cirugía de Desviación de la Arteria Coronaria: debe evitarse el uso de Labetalol en estos pacientes, ya que desarrollan hipotensión.
- Dosis alta de Labetalol: La administración de hasta 3 g/día como una infusión por 2 a 3 días, produce hipotensión o bradicardia.
- Broncoespasmo no alérgico (por ejemplo, Bronquitis Crónica y Enfisema): Debido a que el Labetalol a las dosis terapéuticas intravenosas usuales, no se ha estudiado en los pacientes con enfermedad de broncoespasmo no alérgica, no debe usarse en tales pacientes.
- Feocromocitoma: Labetalol intravenoso ha mostrado ser eficaz en la disminución de la presión arterial y en el alivio de los síntomas en los pacientes con feocromocitoma; pueden requerirse dosis superiores a las usuales. Sin embargo, se han informado respuestas hipertensivas paradójicas en unos pacientes con este tumor; por consiguiente, debe usarse con cautela al administrar Labetalol a los pacientes con feocromocitoma.
- Cirugía mayor: La necesidad o conveniencia de retirar la terapia de un beta bloqueador antes de la cirugía mayor es cuestionable, debido a la hipotensión severa prolongada y la dificultad de reiniciar o mantener un latido del corazón. El efecto de la actividad alfa-adrenérgica del Labetalol no se ha evaluado en esta situación. Se ha mostrado un sinergismo entre el Labetalol y la anestesia de Halotano.
- Disminuciones rápidas de la presión arterial: se debe ser cautelosos al reducir la presión arterial muy elevada, ya que pueden darse varias reacciones adversas, incluyendo infarto cerebral, infarto del nervio óptico, angina y cambios isquémicos en el

Raro: Bradicardia.

Muy raro: Bloqueo del corazón.

Desórdenes vasculares:

Común: hipotensión postural.

Muy raro: Exacerbación de los síntomas del Síndrome de Raynaud.

La hipotensión postural pronunciada puede ocurrir si se permiten a los pacientes asumir la posición derecha dentro de 3 horas de recibir el Labetalol.

Trastornos respiratorios, torácico y mediastino:

Común: congestión nasal.

Trastornos Hepatobiliares:

Común: Las pruebas de la función hepáticas elevadas.

Muy raro: Hepatitis, ictericia hepatocelular, ictericia colestática, necrosis hepática.

Los signos y síntomas de los desórdenes hepatobiliares son normalmente reversibles después del retiro del medicamento.

SOBREDOSIS (SIGNOS, SÍNTOMAS, CONDUCTA Y TRATAMIENTO):

La sobredosis con Clorhidrato de Labetalol causa hipotensión excesiva que es sensible a la postura y a veces, bradicardia excesiva. Los pacientes deben ponerse en posición supina (boca para arriba) y sus piernas levantadas, si es necesario, para mejorar el suministro de la sangre al cerebro.

Las medidas adicionales que deben emplearse si es necesario:

- Excesiva bradicardia: administrar atropina o epinefrina.

- Fallo Cardíaco: administrar un digitálico glicósido y un diurético. Dopamina o dobutamina puede también ser útil.

- Hipotensión: administrar vasopresores, por ejemplo norepinefrina. Hay evidencia farmacológica que la norepinefrina puede ser una droga de elección.

- Broncoespasmo: administrar epinefrina y/o un agonista beta 2 en aerosol.

- Convulsiones: administrar diazepam.

- En sobredosis severa de un beta-bloqueador resultante en hipotensión y/o bradicardia, glucagón ha mostrados ser efectivo cuando es administrado en grandes dosis (5 a 10 mg rápidamente sobre 30 segundos, seguida por infusión continua de 5 mg por hora que puede ser reducida según el paciente mejora).

Ninguna hemodiálisis ni diálisis peritoneal remueve una cantidad significativa de Labetalol desde la circulación general (< 1%).

RECOMENDACIÓN:

Ante la eventualidad de una sobredosis, concurrir al Hospital más Cercano, o al Centro Nacional de Toxicología, en Emergencias Médicas, sito en Avda. Gral. Santos y Teodoro S. Mongelós. Tel. 204 800. Asunción – Paraguay.

PRESENTACIONES:

Caja x 1 ampolla x 4 mL.

Caja x 25, 50 y 100 ampolla x 4 mL (Presentaciones Hospitalarias).

Mantener a temperatura ambiente (15 °C a 30 °C). Conservar en lugar seco.

VENTA BAJO RECETA

Elaborado por

Laboratorios Catedral de Scavone Hnos. S. A. – Acceso Norte

Planta Industrial: Vía Férrea esq. Cándido Vasconellos - Asunción – Paraguay

Director Técnico: Farm. Jaime Cristóful - Reg. Prof. N° 2.719

SCAVONE HNOS. S.A.

Santa Ana N° 431 c/ Avda. España - Asunción – Paraguay

Director Técnico: Q.F. Amílcar Sena - Reg. Prof. N° 4.885

Todo medicamento debe ser mantenido fuera del alcance de los niños.