



# Clorhidrato de Labetalol 200 mg

Comprimidos recubiertos - Vía oral

Industria Argentina

Venta bajo receta

## FÓRMULA CUALI-CUANTITATIVA

Cada comprimido de 200 mg de BIASCOR® contiene:

Clorhidrato de Labetalol.....	200 mg
Almidón.....	77,08 mg
Lactosa monohidrato.....	118,92 mg
Estearato de magnesio.....	4 mg
Alcohol polivinílico.....	6,28 mg
Poliétilenglicol 3000.....	3,48 mg
Talco.....	2,32 mg
Dióxido de titanio.....	3,92 mg
Índigo carmín.....	0,08 mg

## ACCIÓN TERAPÉUTICA

BIASCOR® (Clorhidrato de Labetalol) combina la actividad bloqueante alfa adrenérgica competitiva y selectiva, con la actividad bloqueante beta adrenérgica competitiva no-selectiva en una sola sustancia.

## INDICACIONES

BIASCOR® Comprimidos recubiertos (Clorhidrato de Labetalol) está indicado en el tratamiento de:

- Hipertensión leve o moderada
- Hipertensión grave
- Hipertensión en el embarazo
- Angina de pecho con hipertensión coexistente.

## ACCIÓN FARMACOLÓGICA

BIASCOR® (Clorhidrato de Labetalol) actúa disminuyendo la presión sanguínea 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 beta-adrenérgicos, protege el corazón de una respuesta simpática refleja que de lo contrario ocurriría. El gasto cardíaco no se reduce significativamente en reposo o después del ejercicio moderado. Se reducen los aumentos en la presión sanguínea durante el ejercicio, pero los correspondientes cambios en la presión diastólica son esencialmente normales. En pacientes hipertensos con angina de pecho coexistente, al reducirse la resistencia periférica disminuye la sobrecarga posterior miocárdica y la demanda de oxígeno. Es de esperar que todos estos efectos beneficien a los pacientes hipertensos y a aquellos con angina coexistente.

## FARMACOCINÉTICA

El Labetalol es rápidamente absorbido del tracto gastrointestinal alcanzándose niveles plasmáticos máximos a las 1-2 horas después de la administración oral. Tiene lugar un metabolismo de primer paso significativo, lo que conduce a una biodisponibilidad del 25% aproximadamente, aunque existe una variación considerable.

La vida media plasmática del Labetalol es de unas 4 horas. El Labetalol se une alrededor de un 50% a proteínas plasmáticas. El Labetalol se metaboliza principalmente por conjugación, dando lugar a metabolitos, glucurónidos, inactivos. Éstos se excretan en orina y por vía biliar, en heces. El Labetalol atraviesa la barrera placentaria y es excretado en leche materna.

En estudios con animales se ha observado que únicamente cantidades insignificantes de fármaco atraviesan la barrera hematoencefálica.

## POSOLÓGIA Y MODO DE ADMINISTRACIÓN

BIASCOR® Comprimidos recubiertos: LA DOSIFICACIÓN DEBE DETERMINARSE EN FORMA INDIVIDUAL.

Adultos:

**Hipertensión:** El tratamiento debe iniciarse con dosis de 100mg dos veces al día. Si fuera necesario, esta dosis puede administrarse progresivamente e incrementarse 100mg, dos veces al día, cada 2-14 días. La presión sanguínea de muchos pacientes se controla con 200mg dos



veces al día y pueden llegar a darse hasta 400mg dos veces al día. En hipertensión refractaria grave se han dado hasta 2400mg/día, divididos en 3 ó 4 dosis.

**Ancianos:** Se recomienda una dosis inicial de 100mg diarios. Dosis de mantenimiento más bajas que las requeridas para pacientes jóvenes, pueden controlar satisfactoriamente la presión sanguínea.

**Hipertensión en el embarazo:** Si fuera necesario, la dosis inicial de 100mg dos veces al día podrá aumentarse a intervalos semanales en 100mg dos veces al día. La gravedad de la hipertensión puede requerir un régimen de tres veces al día. No deberá excederse una dosis total diaria de 2400mg.

Los pacientes hospitalizados con hipertensión grave pueden tener incrementos diarios de la dosis.

**Hipertensión coexistente con angina:** La dosis de BIASCOR® será la requerida para controlar la hipertensión.

Pueden aparecer efectos hipotensores aditivos si los comprimidos de BIASCOR® se administran conjuntamente con otros antihipertensivos, por ejemplo, diuréticos, metildopa, etc. En los pacientes que estén en tratamiento con tales fármacos y se vayan a sustituir por BIASCOR® comprimidos recubiertos, debe comenzarse con una dosis de 100mg dos veces al día, disminuyéndose gradualmente la terapia previa. No es aconsejable la retirada brusca de clonidina o agentes beta-bloqueantes.

Niños:

No se ha establecido la seguridad y eficacia de este medicamento en niños.

## CONTRAINDICACIONES

BIASCOR® está contraindicado en bloqueo A-V de segundo o tercer grado, shock cardiogénico y otros estados asociados a hipotensión prolongada y grave o a bradicardia grave. Los beta-bloqueantes, aún aquellos con aparente cardioselectividad, no deberán utilizarse en pacientes con asma o historia de obstrucción de las vías respiratorias.

El labetalol está contraindicado en pacientes con hipersensibilidad conocida al fármaco.

## ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

Se han descrito algunos casos raros de lesión hepatocelular grave en terapia con Labetalol. La lesión hepática es, generalmente, reversible y ha sucedido tanto tras tratamiento a corto plazo como a largo plazo. Deberán realizarse las pruebas analíticas adecuadas al primer signo o síntoma de disfunción hepática. Si hubiera evidencia analítica de disfunción hepática o si el paciente presentara ictericia, deberá suspenderse y no reiniciarse la terapia con Labetalol.

Se debe tener cuidado si el Labetalol se utiliza concomitantemente con agentes antiarrítmicos de Clase I o con antagonistas del calcio del tipo verapamilo.


**Riesgo de reacción anafiláctica:** Los pacientes con antecedentes de reacción anafiláctica grave a una variedad de alérgenos, que estén tomando bloqueantes de los receptores beta-adrenérgicos, pueden ser más sensibles al repetirse la exposición, bien accidental, de diagnóstico o terapéutica. Estos pacientes pueden no responder a las dosis habituales de adrenalina que se usan para tratar las reacciones alérgicas.

Se advierte a los deportistas que estos medicamentos contienen un componente que puede establecer un resultado analítico de control del dopaje como positivo.

Se han descrito erupciones cutáneas y/o sequedad de ojos asociadas con el uso de fármacos bloqueantes de los receptores beta-adrenérgicos. La incidencia es baja y, en la mayoría de los casos, los síntomas desaparecieron al suspenderse el tratamiento. Deberá considerarse una retirada gradual del fármaco, si tal reacción no fuera explicable de otro modo.

Se debe tener especial cuidado en pacientes con reserva cardíaca escasa y el fallo cardíaco debe controlarse con un glucósido cardíaco y un diurético antes de iniciar la terapia con BIASCOR®.

No es necesario suspender el tratamiento con comprimidos de BIASCOR® antes de la anestesia, si bien los pacientes deben recibir atropina por vía intravenosa antes de la inducción. BIASCOR® puede potenciar los efectos hipotensores del halotano.



Los pacientes, especialmente aquellos con enfermedad cardíaca isquémica, no deben interrumpir/suspender bruscamente la terapia con BIASCOR®.

Este medicamento contiene lactosa. Los pacientes con intolerancia hereditaria a galactosa, insuficiencia de lactasa de Lapp (insuficiencia observada en ciertas poblaciones de Laponia) o malabsorción de glucosa o galactosa no deben tomar este medicamento.

### INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS

BIASCOR® produce fluorescencia en solución alcalina a una longitud de onda de excitación de 334nm y a una longitud de onda de fluorescencia de 412nm pudieron, por ello, interferir en las valoraciones de ciertas sustancias fluorescentes incluyendo las catecolaminas.

La presencia de metabolitos del Labetalol en orina puede producir niveles elevados falsos en orina de catecolaminas, metanefrina, normetanefrina y ácido vanilmandélico (VMA) al ser determinados por métodos fluorimétricos o fotométricos. En pacientes controlados de los que se sospecha que presentan feocromocitoma y tratados con clorhidrato de Labetalol, deberá emplearse para la determinación de los niveles de catecolaminas, un método específico como cromatografía de líquidos de alta presión con fase de extracción sólida.

El uso concomitante de antidepressivos tricíclicos puede aumentar la incidencia de temblores. La cimetidina puede aumentar la biodisponibilidad del Labetalol y debe tenerse cuidado con la posología oral de la misma.

**Fertilidad, embarazo y lactancia:** Aunque no se han demostrado efectos teratogénicos en animales, el Labetalol sólo debe usarse en el primer trimestre del embarazo si el potencial beneficio supera al potencial riesgo.

Debe tenerse en cuenta que el Labetalol cruza la barrera placentaria y puede bloquear los receptores alfa y beta-adrenérgicos del feto y del neonato. Muy raramente se han descrito alteraciones perinatales y neonatales (bradicardia, hipotensión, depresión respiratoria, hipoglucemia, hipotermia). A veces, estos síntomas se desarrollan un día o dos después del nacimiento. La respuesta a las medidas de sostén (por ejemplo, fluidos intravenosos y glucosa) es generalmente rápida, pero con pre-eclampsia grave, especialmente después del tratamiento prolongado por vía intravenosa con Labetalol, la recuperación puede ser más lenta. Esto puede estar asociado con la disminución del metabolismo hepático en niños prematuros.

Se han descrito muertes intrauterinas y neonatales, si bien estuvieron implicados otros fármacos (por ejemplo, vasodilatadores, depresores del centro respiratorio) y los efectos de pre-eclampsia, retraso en el desarrollo intrauterino y parto prematuro. Esta experiencia clínica previene contra el uso indebidamente prolongado de altas dosis de Labetalol y retraso en el alumbramiento, y controla la administración conjunta de hidralazina.

BIASCOR® se excreta en leche materna, aunque no se han descrito efectos adversos en niños lactantes.

**Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas:** No se han descrito.

### REACCIONES ADVERSAS

Se han descrito casos raros de hipersensibilidad, erupción, prurito, angioedema y disnea.

Se han producido casos raros de elevación en las pruebas funcionales hepáticas, ictericia (tanto hepatocelular como colestásica), hepatitis y necrosis hepática. Estos signos o síntomas son, generalmente, reversibles al suspenderse el tratamiento.

Se han descrito algunos casos de bradicardia y de bloqueo cardíaco.

La mayoría de los efectos secundarios son transitorios y suceden durante las primeras semanas del tratamiento. Éstos incluyen dolor de cabeza, cansancio, vértigo, depresión y letargia, congestión nasal, sudoración y raramente edema maleolar.

La hipotensión postural es rara excepto a dosis muy altas o si la dosis inicial es demasiado alta o si se incrementan las dosis demasiado rápidamente.

Al comienzo del tratamiento puede aparecer en algún paciente una sensación de hormigueo en el cuero cabelludo, generalmente transitoria.

Se han descrito temblores en el tratamiento de las hipertensiones en el embarazo.

Se han descrito casos de retención aguda de orina, dificultad en la micción, fracaso eyaculatorio, dolor epigástrico, náuseas y vómitos.

Raramente han aparecido anticuerpos antinucleares positivos no asociados con la enfermedad, así como raros casos de lupus eritematoso sistémico y, muy raramente, ebre medicamentosa.

Muy raramente se han descrito casos de miopatía tóxica. Raramente se han producido erupción liquenoide reversible. Se han descrito casos de visión borrosa, irritación ocular y calambres, aunque no se asociaron necesariamente a BIASCOR®.

### SOBREDOSIFICACIÓN

Son de esperar efectos cardiovasculares profundos, tales como, hipotensión postural excesiva y, a veces, bradicardia. Los pacientes deben acostarse en posición supina con las piernas levantadas. Se justifica el lavado gástrico o la inducción al vómito dentro de las primeras horas a la ingestión; emplear un glucósido cardíaco y un diurético en caso de fallo cardíaco; en caso de broncoespasmo, administrar un agonista beta-2 en aerosol. Deberán darse de 0,25 a 0,3mg de atropina por vía intravenosa para aliviar la bradicardia. Para mejorar la circulación, administrar una dosis inicial de 5 a 10mcg de noradrenalina por vía intravenosa, preferiblemente a la isoprenalina, repitiéndose según la respuesta.

Alternativamente, puede infundirse la noradrenalina a una velocidad de 5mcg por minuto hasta que la respuesta sea satisfactoria.

En sobredosis grave, debe administrarse, preferiblemente, glucagón por vía intravenosa.

Se deberá administrar una dosis inicial de 5 a 10mg en solución inyectable de cloruro sódico o dextrosa, seguida de una infusión intravenosa de 5mg/h o lo que se necesite para mantener el rendimiento cardíaco.

Se ha descrito fracaso renal oligúrico después de una sobredosis masiva de Labetalol por vía oral. En un caso, el uso de dopamina para aumentar la presión sanguínea pudo haber agravado el fracaso renal.

La hemodiálisis elimina menos del 1% del clorhidrato de Labetalol de la circulación.

Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al Hospital más cercano o comunicarse con el Centro de Toxicología (CIAT) tel: 1722.

### PRESENTACIONES

Envase conteniendo 20 comprimidos recubiertos.

### CONDICIÓN DE CONSERVACIÓN Y ALMACENAMIENTO

Conservar a temperatura ambiente entre 15 - 30° C. Proteger de la luz.

### MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS.

Especialidad Medicinal Autorizada por el Ministerio de Salud - Certificado N° 48.609 - Argentina  
Dirección Técnica: Lic. Anabela M. Martínez - Farmacéutica

Última revisión: Mayo 2022

320581-001



INSTITUTO BIOLÓGICO  
ARGENTINO S.A.I.C.

Administración:  
Pte. José E. Uriburu 153 C1027AAC  
C.A.B.A. - Tel.: (00 54 11) 4953-7215  
Email: biol@biol.com.ar  
Planta Industrial:  
Calle 606 Dr. Silvio Dessy 351 -  
B1867DWE Florencio Varela  
Pcia. de Buenos Aires  
Tel.: (00 54 11) 4255-1040  
Email: planta@biol.com.ar