

RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto:	TARTRATO DE METOPROLOL
Forma farmacéutica:	Inyección IV
Fortaleza:	1 mg/ mL
Presentación:	Estuche por 5 ó 50 ampolletas de vidrio ámbar con 5 mL cada una.
Titular del Registro Sanitario, país:	EMPRESA LABORATORIOS AICA, La Habana, Cuba.
Fabricante, país:	EMPRESA LABORATORIOS AICA, La Habana, Cuba. UNIDAD EMPRESARIAL DE BASE (UEB) AICA.
Número de Registro Sanitario:	M-12-175-C07
Fecha de Inscripción:	6 de diciembre de 2012
Composición:	
Cada ampolleta contiene:	
Tartrato de metoprolol	5,0 mg
Cloruro de sodio	
Agua para inyección	
Plazo de validez:	36 meses
Condiciones de almacenamiento:	Almacenar por debajo de 25 °C.

Indicaciones terapéuticas

Hipertensión arterial, angina al esfuerzo, arritmias, infarto agudo de miocardio, arritmias cardíacas, profilaxis de migraña, hipertiroidismo.

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad conocida. Los productores aconsejan no usar con antimaláricos. Asma bronquial, EPOC, bloqueo cardíaco de segundo y tercer grados, angina de Prinzmetal, shock cardiogénico, insuficiencia cardíaca descompensada, bradicardia intensa, síndrome del seno enfermo, acidosis metabólica, enfermedad arterial periférica severa, feocromocitoma (con un α bloqueador).

Precauciones:

Ver advertencias.

Advertencias especiales y precauciones de uso:

Embarazo: categoría de riesgo C.

Lactancia Materna: compatible, pero se debe vigilar debido a posibles efectos indeseables por bloqueo beta-adrenérgico. DH: reducir dosis. No suspender abruptamente su administración sobre todo en la cardiopatía isquémica. Bloqueo cardíaco de primer grado.

Hipertensión portal. Diabetes mellitus: ligera disminución de la tolerancia a la glucosa, enmascara los síntomas de la hipoglucemia. Miastenia gravis. Antecedente de hipersensibilidad, incrementa sensibilidad a alérgenos y las respuestas alérgicas. En raras situaciones, cuando no se disponga de una alternativa mejor, un beta-1 bloqueador cardíaco selectivo se puede administrar a pacientes con antecedente de broncospasmo bajo estrecha vigilancia especializada.

Efectos indeseables:

Frecuentes: broncospasmo, insuficiencia cardíaca, trastornos de la conducción auriculoventricular, bradicardia excesiva, trastornos gastrointestinales, insomnio, pesadillas, confusión, depresión, lasitud.

Ocasionales: vasoconstricción periférica (agrava la claudicación intermitente y el fenómeno de Raynaud), hipoglicemia o hiperglicemia, alopecia, mareos, hipotensión postural.

Raras: trombocitopenia, púrpura, reacciones cutáneas, exacerbación de psoriasis, trastornos visuales, psicosis, alucinaciones, síndrome oculomucocutáneo.

Posología y modo de administración:

Por vía i.v. Administrar 5 mg (1 – 2 mg/min), repetir si es necesario cada 5 minutos hasta dosis total de 15 mg. Para el control de las arritmias inducidas por anestesia 2 mg, se puede repetir hasta alcanzar 10 mg.

Infarto de miocardio: dentro de las primeras 12 h de iniciado el ataque, administrar 5 mg por vía i.v., cada 2 min hasta un máximo de 15 mg, continuar a los 15 min con 50 mg cada 6 h por v.o. durante 48 h, dosis de mantenimiento 200 mg/día en dosis dividida v.o.

Modo de administración: inyección intravenosa.

Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción:

Elevan sus concentraciones plasmáticas: cimetidina, propafenona. Los β bloqueadores aumentan su efecto sobre la presión arterial con antihipertensivos, alcohol, fenotiazinas, antidepresivos tricíclicos, IMAO, ansiolítica e hipnótica, dopaminérgicos como L-dopa, baclofeno, alprostadil. Antagonizan su acción antihipertensiva los esteroides, AINE, estrógenos y carbenoxolona. Aumenta la presión arterial: epinefrina, norepinefrina, dobutamina y tropisetron. Hipertensión de rebote con clonidina. Vasoconstricción periférica con ergotamina y metisergida. Junto con nifedipina y verapamil produce hipotensión severa e insuficiencia cardíaca. Diltiazem: bloqueo AV. Antiarrítmicos: inducen bradicardia, depresión miocárdica y bloqueo AV. Glucósidos cardíacos: riesgo incrementado de bloqueo AV y bradicardia. Antidiabéticos: enmascara signos de hipoglicemia y potencia los efectos hipoglicemiantes de la insulina. Pilocarpina: induce arritmias. Antagoniza la acción de la teofilina y los β agonistas. Propranolol aumenta el riesgo de toxicidad por bupivacaína y lidocaína. Eleva concentraciones plasmáticas de rizatriptán. Antagoniza los efectos de la neostigmina y piridostigmina e incrementa las acciones de los relajantes musculares.

Uso en Embarazo y lactancia:

Deberá ser utilizado en pacientes embarazadas solo si es claramente necesario y bajo prescripción facultativa.

Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:

No se han reportado hasta el momento.

Sobredosis:

Toxicidad aguda: Se han reportado varias clases de sobredosis, algunas conduciendo a la muerte. Señales y síntomas: Las señales y síntomas asociadas con la sobredosis del Metoprolol tartrato son la bradicardia, hipotensión, broncoespasmo y la falla cardíaca. Tratamiento: No hay un antídoto específico. En general los pacientes con infarto del miocardio agudo o reciente pueden ser más inestables hemodinámicamente que otros pacientes y se deben tratar conformemente. Basados en las acciones farmacológicas de tartrato de metoprolol, se deben emplear las siguientes medidas generales: Eliminación de la droga: Se debe realizar un lavado gástrico. Bradicardia: se debe administrar atropina. Si no hay respuesta al bloqueo vagal, se debe administrar con cautela isoproterenol. Hipotensión: se debe administrar un vasopresor, por ejemplo: Levarterenol o Dopamina. Broncoespasmo: Se debe administrar un agente beta 2 estimulante y/o derivado de la teofilina. Fallo cardíaco: Se debe administrar un glucósido, digital y diurético. En shock resultante de la contractilidad cardíaca se puede considerar la administración de Dobutamina, Isoproterenol o Glucagón.

Propiedades farmacodinámicas

ATC: C07AB02

Grupo farmacoterapéutico: Agentes beta-bloqueantes selectivos.

Es un beta-bloqueante cardiosselectivo de los receptores beta-1, lo que reduce la frecuencia cardíaca, la fuerza de contracción miocárdica y la velocidad de conducción a través del sistema de conducción. Estos efectos antiarrítmicos se conocen como de clase II; también como consecuencia del bloqueo beta-1, suprimen la liberación de renina inducida por las catecolaminas y lipólisis. No tiene actividad simpaticomimética intrínseca, y posee actividad pequeña o nula como estabilizador de membrana. Los efectos bloqueadores cardiosselectivos de receptores beta-1 son relativos y desaparecen con los aumentos de las dosis, por ello pueden aparecer los efectos clínicos por receptores beta-2 adrenérgicos. Mecanismo de acción: antagonista competitivo de los efectos de las catecolaminas en los lugares de los receptores beta-adrenérgicos, por lo que se emplean en diversas enfermedades, principalmente cardiovasculares.

Propiedades farmacocinéticas (Absorción, distribución, biotransformación, eliminación):

En el hombre, la absorción del Metoprolol tartrato es rápida y completa. La disponibilidad sistemática y la media vida del Metoprolol tartrato en los pacientes con insuficiencia renal no difieren a un grado significativo clínicamente de aquellos en sujetos normales. Por consiguiente, generalmente no es necesaria una reducción en la dosis en pacientes con insuficiencia renal crónica. Siguiendo la administración intravenosa de Metoprolol tartrato, la recuperación urinaria de la droga sin cambio es aproximadamente 10 %. Cuando se hizo infusión de la droga en periodo de 10 minutos, en voluntarios normales, se logró el bloqueador beta máximo aproximadamente a los 20 minutos. Las dosis de 5 mg y 15 mg produjeron una reducción máxima en el ritmo cardíaco inducido por el ejercicio del 10% y 15%, respectivamente. El efecto sobre el ritmo cardíaco del ejercicio disminuyó linealmente con el tiempo en el mismo ritmo para las dos dosis, y desaparecieron aproximadamente 5 horas y 8 horas para las dosis de 5 mg y 15 mg respectivamente. Un efecto equivalente máximo de efecto de bloqueador beta se logra con dosis intravenosas en proporción de aproximadamente 2.5:1. Existe una relación lineal entre el registro de niveles de plasma y la reducción del ritmo cardíaco por ejercicio. Sin embargo, la actividad antihipertensiva no parece estar relacionada con los niveles de plasma. Debido a los niveles de plasma variables obtenidos con una dosis dada y la carencia de una relación consistente de la actividad antihipertensiva a la dosis, la selección de una dosis adecuada requiere la valoración individual. En varios estudios de pacientes con infarto del miocardio agudo, la administración intravenosa seguida por la administración oral del Metoprolol tartrato ocasionó una reducción en el ritmo cardíaco, presión sistólica de la sangre y el gasto cardíaco. El volumen sistólico, la presión diastólica de sangre y la presión diastólica final de la arteria pulmonar permanecieron sin cambio alguno. En los individuos mayores con funciones renales y hepáticas clínicamente normales, no hay diferencias importantes en la farmacocinética del Metoprolol en comparación con los individuos jóvenes.

Es moderadamente liposoluble. Se distribuye ampliamente, atraviesa las barreras hematoencefálica y placentaria y alcanza la leche materna. Se une poco a proteínas plasmáticas (8-12 %). Se metaboliza extensamente en el hígado por desaminación oxidativa, O-desalquilación, seguida de oxidación e hidroxilación alifática. Los metabolitos se eliminan por la orina con pequeñas cantidades de metoprolol inalterado. La velocidad de hidroxilación está determinada por polimorfismo genético, el tiempo de vida media en hidroxiladores rápidos es 3-4 h, mientras que en los lentos es 7 h.

Instrucciones de uso, manipulación y destrucción del remanente no utilizable del producto:

No presenta.

Fecha de aprobación/ revisión del texto: 30 de junio de 2018.