



ISOPROTERENOL

Clorhidrato de Isoproterenol

Inyectable

Industria Argentina – Venta bajo Receta

FORMULA

Cada ampolla contiene:

Clorhidrato de Isoproterenol	1mg
Cloruro de Sodio	42,5 mg
Acido Láctico	0,6 mg
Bisulfito de Sodio	5,0 mg
Agua Destilada c.s.p.	5,0 ml

ACCION TERAPEUTICA:

Antiarrítmico de efecto beta adrenérgico. El ISOPROTERENOL actúa primariamente en el corazón, músculos blandos de los bronquios, músculos de la vasculatura y tracto alimentario.

Código ATC: C01 CA02.

INDICACIONES DE USO:

En el tratamiento de bradicardia y en:

- Episodios moderados y transitorios de bloqueo cardíaco que no requieran electroshock o marca paso.
- En episodios serios de bloqueo cardíaco y síndrome de Adams-Stockes, excepto en el caso de ser causados por taquicardia ventricular o fibrilación.
- En caso de ataque cardíaco: por asistolia o bloqueo completo, hasta la aplicación del tratamiento de elección (electroshock o marcapaso).
- Adyuvante en la terapia de reemplazo de fluidos y electrolitos, y en el uso de otras drogas y tratamientos del shock hipovolémico y séptico, hipoperfusión, falla cardíaca congestiva, shock cardíaco.
- El ISOPROTERENOL también se indica en broncoespasmo durante la anestesia.

ACCION FARMACOLÓGICA:

Amina simpaticomimética sintética. Actúa casi exclusivamente sobre receptores beta.

FARMACOCINETICA: Mecanismo de Acción:

Como Broncodilatador: Estimula los receptores beta 2 adrenérgicos en los pulmones, relaja el músculo bronquial, aliviando el broncoespasmo, aumentando la capacidad vital, disminuyendo el volumen residual y reduciendo la resistencia al paso del aire. Esto se debe a un aumento en la producción de C-AMP, por activación de la enzima adenil-ciclasa. También inhibe la liberación de mediadores de los mastocitos.

Como estimulante cardíaco: Actúa sobre receptores adrenérgicos beta 1 en el corazón, aumenta el ritmo cardíaco por efecto cronotrópico y la fuerza de contracción por efecto inotrópico en miocardio. Aumenta la velocidad de

conducción y disminuye el período refractario del nódulo atrioventricular. Dilata los vasos sanguíneos periféricos (actúa sobre receptores beta 2 adrenérgicos).

Absorción: Tanto por vía parenteral como por inhalación el ISOPROTERENOL se absorbe rápidamente.

Tiempo de acción: Por las vías de administración indicadas, su acción se manifiesta en menos de cinco minutos, y su efecto se prolonga por 10 minutos. En ese lapso se manifiesta su efecto máximo.

Transformación: El ISOPROTERENOL se metaboliza principalmente en el hígado y pulmones. Entre 40 a 50% se excreta sin metabolizar.

POSOLOGIA / DOSIFICACION / MODO DE ADMINISTRACION:

Comenzar con la mínima dosis recomendada, si es necesario, incrementarla gradualmente, monitorear cuidadosamente al paciente. La vía de administración es infusión intravenosa o inyección bolo intravenosa. En casos de emergencia la droga deberá administrarse por medio de una inyección intracardíaca. Si el tiempo no es de extrema importancia, es preferible iniciar la terapia administrando la droga en forma subcutánea o intramuscular.

TABLA 1: DOSIS RECOMENDADAS PARA ADULTOS CON OBSTRUCCION CARDIACA, SINDROME ADAMS-STOKES y PARO CARDIACO

VIA DE ADMINISTRACION	PREPARACION DE LA DILUCION	DOSIS INICIAL	RANGO DOSIS SUBSIGUIENTE (*)
Inyección bolo I. V	Diluir 1ml (0,2mg) a 10ml con CNa inyectable USP ó 5% dextrosa inyectable USP	0,02 mg a 0,06 mg (1ml a 3ml de solución diluida)	0,01 mg a 0,02mg (0,5ml a 10ml de solución diluida)
Infusión bolo I.V.	Diluir 10ml (2mg) en 500ml de dextrosa 5% inyectable USP	5µg/min (1,25ml de solución diluida por minuto)	
Intramuscular	Usar solución 1:5000 sin diluir	0,2 mg (1ml)	0,02mg a 1mg (0,1ml a 5ml)
Subcutánea	Usar solución 1:5000 sin diluir	0,2 mg (1ml)	0,15mg a 0,2mg (0,75ml 1ml)
Intracardíaca	Usar solución 1:5000 sin diluir	0,2 mg (1ml)	

(*) La dosis subsiguiente y la vía de administración depende de la respuesta ventricular y de la rapidez con que el marcapaso responde, cuando la droga es gradualmente retirada.

TABLA 2: DOSIS RECOMENDADAS PARA ADULTOS EN ESTADO DE SHOCK E HIPOPERFUSION

VIA DE ADMINISTRACION	PREPARACION DE LA DILUCION	INFUSION (1)
Infusión I.V.	Diluir 5ml (1mg) en 500ml de dextrosa 5% inyectable USP	0,5 µg a 5 µg por minuto (0,25 ml a 2,5 ml de solución diluida)

DOSIS RECOMENDADAS PARA ADULTOS CON BRONCO ESPASMO DURANTE LA ANESTESIA

VIA DE ADMINISTRACION	PREPARACION DE LA DILUCION	DOSIS INICIAL	DOSIS SUBSIGUIENTES
Bolo Inyección I.V.	Diluir 1ml (0,2mg) en 10ml con CNa inyectable ó de dextrosa 5% inyectable USP	0,01 mg a 0,02 mg (0,5ml a 1ml) de solución diluida)	La dosis inicial deberá repetirse cuando sea necesario

IMPORTANTE: No administrar si la solución presenta color rosa-marrón o contiene un precipitado.

CONTRAINDICACIONES:

Está contraindicado su uso en pacientes con taquiarritmias, taquicardias u obstrucción cardíaca causada por intoxicaciones con digitálicos, enfermedades en arteria coronaria; insuficiencia coronaria, arritmias ventriculares que requieran terapia inotrópica y angina de pecho. Hipertensión. Diabetes mellitus. Hipertiroidismo, feocromocitoma. Hipersensibilidad a cualquiera de los componentes de la fórmula:

ADVERTENCIAS:

El clorhidrato de Isoproterenol, al aumentar el requerimiento de oxígeno en miocardio y disminuir la eficacia en la perfusión coronaria, podría provocar un efecto perjudicial en un corazón con alteraciones. En algunos pacientes, presumiblemente con problemas en el nódulo A.V. y sus ramificaciones, el clorhidrato de Isoproterenol inyectable, paradójicamente empeoró la obstrucción cardíaca o precipitó el síndrome de Adams-Stokes durante el ritmo sinusoidal normal o la obstrucción cardíaca transitoria. Pacientes hipersensibles al bisulfito de sodio podrían experimentar reacciones alérgicas: síntomas anafilácticos, peligro de muerte y episodios asmáticos menos severos. No administrar si la solución presenta color rosa-marrón o contiene un precipitado. Se recomienda realizar un monitoreo electrocardiográfico durante la administración de Isoproterenol, reduciendo la dosis en caso de observar una hiperexcitabilidad ventricular (extrasístoles polimorfas, reiteradas en salva o taquicardia ventricular.) Tener en cuenta que contiene sustancias que pueden dar resultados positivos en un test antidoping.

PRECAUCIONES:

Al comienzo del tratamiento utilizar la menor dosis recomendada. Esta puede aumentarse gradualmente, si es necesario, aunque debe monitorearse al paciente. Las dosis que incrementan el ritmo cardíaco, a más de 130 pulsaciones por minuto, pueden aumentar la probabilidad de inducir arritmias ventriculares. Este aumento en el ritmo cardíaco, podrá aumentar el requerimiento de oxígeno y el trabajo cardíaco; esto afectaría en forma negativa aun corazón con alteraciones o con arteriosclerosis. Se debe tener precaución en aquellos pacientes con enfermedades en arteria coronaria, insuficiencia coronaria, diabetes, hipertiroidismo e hipersensibilidad a amins simpaticomiméticas. La respuesta a la terapia debe ser monitoreada mediante: frecuentes determinaciones de la presión en venas centrales y gases en sangre. Pacientes en estado de shock deben ser observados durante la

administración del clorhidrato de Isoproterenol inyectable. Si el ritmo cardíaco excede las 110 pulsaciones por minuto, es aconsejable disminuir la dosis o discontinuar la infusión. Debe prestarse especial atención al balance ácido-base y a la corrección en los disturbios electrolíticos. En caso de shock asociados con bacteremia, deberá aplicarse una terapia antimicrobiana apropiada.

Interacciones Medicamentosas:

El clorhidrato de Isoproterenol inyectable no debe administrarse simultáneamente con epinefrina, debido a que ambas drogas son estimulantes cardíacos directos y podría provocar arritmias. Administrar Isoproterenol con precaución cuando se utilizan anestésicos inhalatorios como halotano, y también cuando se administra conjuntamente con:

- Antidepresivos tricíclicos o maprotilina: potencia los efectos cardiovasculares.
- Levodopa, hormonas tiroideas, nitratos, ritodrina, TL 201, xantinas. Antihipertensivos o diuréticos usados como antihipertensivos, bloqueantes beta adrenérgicos. Estimulantes del sistema nervioso central. Glicósidos digitálicos.

Embarazo: Se desconoce si esta droga podría causar daños en el feto al ser administrada en mujeres embarazadas o si podría afectar la capacidad de reproducción.

Lactancia: Se desconoce si esta droga se excreta en la leche materna. El médico tratante deberá tomar los recaudos necesarios.

Uso en Pediatría: No han sido establecidos valores de dosificación para uso pediátrico.

Carcinogénesis, mutagénesis y trastornos de fertilidad: No se han efectuado estudios a largo plazo que permitan dar información al respecto.

REACCIONES ADVERSAS:

Sistema Nervioso Central: nerviosismo, cefalea, vértigo.

Cardiovascular: Taquicardia, palpitaciones, angina, síndrome de Adams-Stokes, edema pulmonar, hipertensión, hipotensión, arritmias ventriculares, taquiarritmias.

Debilidad. Enrojecimiento de la piel. Transpiración. Temblores moderados, náuseas, vómitos, sequedad bucal.

SOBREDOSIFICACION Y TRATAMIENTO ORIENTATIVO:

En casos de sobredosis accidental evidenciada principalmente por taquicardia, y otras arritmias, palpitaciones, angina, hipotensión o hipertensión, reducir la dosis o discontinuar la medicación hasta que el paciente se restablezca.

Monitorear la presión sanguínea, pulso, respiración y EKG.

Se desconoce si el clorhidrato de Isoproterenol es dializable.

La DI 50 del clorhidrato de Isoproterenol en ratas es de 3,860 mg/kg +/- 1,190 mg/kg de la droga en solución.

Ante la eventualidad de una sobredosificación efectuar consulta médica a en los Centros de Toxicología o dirigirse al hospital mas cercano.

Frente a la estimulación del sistema nervioso central, administrar sedantes, Ej: barbitúricos. En casos de taquicardia y arritmias inducidas por Isoproterenol, administrar un bloqueante beta adrenérgico (propranolol). En pacientes asmáticos un bloqueante beta adrenérgico cardioselectivo (acebutolol, atenolol, metoprolol), podría ser mas apropiado.

Los beta bloqueantes deben ser usados con precaución en pacientes asmáticos, ya que pueden inducir broncoespasmo severo o ataque asmático.



CONDICIONES DE CONSERVACION Y ALMACENAMIENTO:

Proteger de la luz. Almacenaren lugar fresco (entre 15 y 30°C)

Mantener alejado del alcance de los niños.

PRESENTACION:

Envase con 1 y 100 ampollas por 5 ml., siendo el último para uso hospitalario.