

FARMACODIVULGACIÓN

Betaxolol

Nombre de producto: betaxolol.

Forma farmacéutica: colirio.

Fortaleza: 0,5 %.

Presentación: estuche por 1 frasco gotero de PEBD con 5 mL.

Composición:

Cada mL contiene:

Betaxolol 0,5 % p/v

(como clorhidrato)

Cloruro de benzalconio NF.0,01 % p/v

Vehículo acuoso.

Indicaciones terapéuticas

Betaxolol está indicado en el tratamiento de la hipertensión ocular y en el glaucoma crónico de ángulo abierto. Puede utilizarse solo, o en combinación con otras drogas anti-glaucoma.

Contraindicaciones

Betaxolol está contraindicado en pacientes con bradicardia sinusal mayor que un bloqueo atrio-ventricular de primer grado, un choque cardiogénico o un historial de insuficiencia cardíaca manifiesta y en pacientes con hipersensibilidad a cualquiera de los componentes de la fórmula.

Precauciones

Debe utilizarse con precaución en pacientes con diabetes o que estén desarrollando tirotoxicosis.

Debe ejercerse precaución cuando se trate a pacientes que tengan un historial de enfermedad pulmonar obstructiva.

Se recomienda la reducción gradual de la dosis antes de una anestesia general, en razón de la capacidad reducida del corazón para responder a los estímulos reflejos simpáticos mediados beta-adrenérgicamente.

Aunque betaxolol ha mostrado tener poco o ningún efecto sobre el ritmo cardiaco o la presión sanguínea en estudios clínicos, debe ejercerse precaución al tratar pacientes con un historial de fallo cardiaco. Se ha reportado que el bloqueo beta-adrenérgico potencia la debilidad muscular consistente con ciertos síntomas miasténicos (ej. diplopía, ptosis y debilidad generalizada).

La presión intraocular debe ser monitoreada durante la terapia con betaxolol, es esencial.

Advertencias especiales y precauciones de uso

No se ha establecido la seguridad ni la eficacia en niños. Betaxolol tiene poco o ningún efecto en las pupilas. Cuando se usa betaxolol para reducir la presión intraocular elevada en el glaucoma de ángulo estrecho, debe utilizarse con un miótico y no solo.

Efectos indeseables

Puede experimentarse incomodidad de corta duración después de la instilación; se ha reportado la ocurrencia de lagrimeo ocasional.

Igualmente, se han observado en raros casos disminución de la sensibilidad de la córnea, eritema, prurito, manchas punteadas en la córnea, queratitis, anisocoria y fotofobia.

Solo en raras ocasiones se ha reportado la ocurrencia de reacciones sistémicas después de la administración tópica de betaxolol (ej. insomnio y neurosis depresiva).

Posología y modo de administración

Betaxolol está destinado para uso tópico solamente, y no para inyección. Instile 1 o 2 gotas en el ojo (o los ojos) afectado(s) dos veces al día. Si fuera necesario, puede instituirse una terapia concomitante con pilocarpina, otros mióticos, adrenalina o inhibidores de la anhidrasa carbónica.

Transferencia desde otros agentes a betaxolol

Cuando se utiliza solamente un agente único, continúe el agente y agregue 1 gota de betaxolol en el ojo (o los ojos) afectado(s) 2 veces al día. Al día siguiente, descontinúe el agente anterior completamente, y continúe con betaxolol.

Cuando se estén utilizando muchos agentes anti-glaucoma, debe evaluarse el paciente sobre una base individual. El ajuste debe involucrar un agente a la vez, a intervalos no menores de una semana. El médico podría descontinuar algunos o todos los otros agentes antiglaucoma.

Interacciones con otros productos medicinales y otras formas de interacción

Epinefrina: ocasionalmente, se ha reportado la ocurrencia de midriasis como resultado de la terapia concomitante de betaxolol solución tópica y epinefrina.

Agentes bloqueadores de beta-adrenérgicos: la coadministración con un agente reductor de la catecolamina puede tener un efecto aditivo con la producción de hipotensión y/o bradicardia.

Drogas psicotrópicas adrenérgicas: los pacientes que reciben tratamiento concomitante con drogas psicotrópicas adrenérgicas deben ser estrechamente monitoreados.

Uso en embarazo y lactancia

Betaxolol gotas oftálmicas solamente debe usarse en el embarazo si los beneficios potenciales son mayores que los posibles riesgos. No se sabe si el clorhidrato de betaxolol se segrega por la leche materna. Debe ejercerse precaución cuando se administre a mujeres durante la lactancia.

Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias

No procede.

Sobredosis

Para una sobredosificación de betaxolol gotas oftálmicas puede enjuagarse el ojo (o los ojos) con agua corriente tibia.

Propiedades farmacodinámicas

Clorhidrato de betaxolol es un agente bloqueador selectivo del receptor beta-1 adrenérgico, para utilizarse en el glaucoma. Reduce la presión intraocular ya sea elevada o normal, esté o no acompañada de glaucoma. No posee actividad significativa de estabilización de las membranas (anestésico local) y está exento de acción intrínseca simpaticomimética. Se ha demostrado que betaxolol tiene efectos mínimos sobre los parámetros pulmonares y cardiovasculares.

Betaxolol es uno de los agentes beta-bloqueadores cardioselectivos más potentes. Es además, uno de los más cardioselectivos. Es 245 veces más potente sobre los receptores b-1 del atrio de Conejillos de Indias aislado, que sobre los receptores beta-1 de la tráquea de los Conejillos de Indias.

Propiedades farmacocinéticas

La mayor parte de los datos sobre farmacocinética se refieren tanto al betaxolol administrado por vía oral, como al administrado por vía i.v. Betaxolol es bien absorbido por la vía oral, y las concentraciones séricas pico ocurren de 2 a 6 h después de la ingestión (26-28). Sufre un metabolismo mínimo de primer paso y posee una biodisponibilidad de 78-90 % luego de su administración oral. Las dosis orales de 5, 10 y 15 mg producen concentraciones plasmáticas pico de 8-14, 14-28 y 52-119 ng/mL, respectivamente. Su unión a las proteínas plasmáticas es de 50-60 %. Se ha informado que su volumen de distribución es de 4,9-13 L/kg, y dos de los metabolitos poseen una débil actividad beta-bloqueadora. El metabolismo ocurre principalmente en el hígado. La excreción de betaxolol se da principalmente por los riñones, con 3-16 % de una dosis oral excretada sin cambios. La vida media de eliminación es bastante larga, teniéndose informes que indican que es de 12 a 22 h. Penetra fácilmente la córnea cuando se coloca sobre la superficie de la córnea.

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

Mantenga el envase bien cerrado. Utilice dentro de un período de un mes después de abrir el envase.

Plazo de validez: 36 meses.

Condiciones de almacenamiento: almacenar por debajo de 30 °C. Protéjase de la luz.