



Agente bloqueante alfa- y betaadrenérgico. 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.

USO CLÍNICO

En adultos:

En comprimidos está indicado en:

- Hipertensión leve, moderada o grave.
- Angina de pecho con hipertensión coexistente.

En solución inyectable está indicado en:

- Hipertensión grave, cuando sea esencial un rápido control de la presión sanguínea.
- Anestesia, cuando esté indicada una técnica hipotensora.
- Episodios hipertensivos tras infarto agudo de miocardio.

En niños (E: *off-label*):

- Hipertensión.
- Emergencia hipertensiva.

DOSIS Y PAUTAS DE ADMINISTRACIÓN

Hipertensión (E: *off-label*): niños y adolescentes:

- Oral. Dosis inicial: 1-3 mg/kg/día dividido en 2-4 dosis (dosis máxima: 100 mg/12 h). Aumentar c/2 días hasta 6 mg/kg/ 6-12 h dosis diaria máxima 10-12 mg/kg/día, hasta 1200 mg/día.
- Vía intravenosa (*bolus* e infusión intermitente). 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 (E: *off-label*): lactantes, niños y adolescentes:

- 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.

Preparación y administración:

Oral: debe administrarse con alimento y se puede administrar con la NE.

Vía intravenosa: preparación: se diluye el con suero glucosado (SG) al 5%, solución de cloruro sódico al 0,18% en dextrosa al 4%, solución cloruro potásico al 0,3% en dextrosa al 5% y solución Ringer lactato, hasta alcanzar concentraciones de 1-5 mg/ml.

Administración:

Para el bolo la máxima concentración posible es 5 mg/ml (= puro) y administrar en 2-3 minutos; máximo 2 mg/minuto. Para la infusión continua, la concentración más usual en Pediatría es 1 mg/ml.

CONTRAINDICACIONES

- Bloqueo auriculoventricular de segundo o tercer grado, *shock* cardiogénico y otros estados asociados a hipotensión prolongada y grave o a bradicardia grave.
- Asma o historia de obstrucción de las vías respiratorias.
- Hipersensibilidad conocida al fármaco o sus excipientes (los comprimidos contienen amarillo anaranjado S (E-110) y lactosa).
- En episodios hipertensivos tras infarto agudo de miocardio, cuando existe vasoconstricción periférica que sugiere bajo gasto cardiaco.

PRECAUCIONES

- Puede producirse lesión hepatocelular grave; realizar pruebas analíticas adecuadas al primer signo o síntoma de disfunción hepática y si esta se constata o apareciese 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.

EFECTOS SECUNDARIOS

Se describen solo las reacciones adversas obtenidas de los ensayos clínicos y de los datos de vigilancia poscomercialización muy frecuentes ($\geq 10\%$) y frecuentes ($\geq 1/100$ a $< 1/10$) en adultos; el resto consultar ficha técnica.

- Trastornos del sistema nervioso: dolor de cabeza, cansancio, vértigo, depresión y letargia.
Trastornos gastrointestinales: náuseas, vómitos.
- Trastornos cardiovasculares: hipotensión postural, bradicardia.

- Trastornos generales y alteraciones en el lugar de la administración: congestión nasal, sudoración.

INTERACCIONES FARMACOLÓGICAS

- Halotano u otros anestésicos: puede potenciar efectos hipotensores.
- Agentes antiarrítmicos de clase I o con antagonistas del calcio del tipo verapamilo.
- Antidepresivos tricíclicos.
- Cimetidina.
- La presencia de metabolitos del labetalol en orina puede producir niveles elevados falsos en orina de catecolaminas, metanefrina, normetanefrina y ácido vanilmandélico (VMA).

DATOS FARMACÉUTICOS

Excipientes:

- Comprimidos: lactosa anhidra, celulosa microcristalina, estearato de magnesio, hipromelosa, benzoato de sodio, dióxido de titanio (E-171), amarillo anaranjado S (E-110). Los pacientes con intolerancia hereditaria a galactosa, insuficiencia de lactasa de Lapp o malabsorción de glucosa o galactosa no deben tomar este medicamento.
- Solución inyectable: hidróxido de sodio, ácido clorhídrico, agua para preparaciones inyectables.

Conservación: Trandate® solución inyectable debe protegerse de la luz. Las mezclas no utilizadas deben descartarse 24 horas después de su preparación.

Presentaciones comerciales: las presentaciones disponibles en España pueden consultarse *online* en el Centro de Información de Medicamentos de la AEMPS (CIMA), <http://www.aemps.gob.es/cima>, y en <https://www.aeped.es/comite-medicamentos/pediamecum> en el enlace "Presentaciones" correspondiente a cada ficha.

BIBLIOGRAFÍA

- Fichas técnicas del Centro de Información *online* de Medicamentos de la AEMPS-CIMA [base de datos en Internet]. Madrid, España: Agencia Española de Medicamentos y Productos Sanitarios (AEMPS) [consultado el 21/10/2020]. Disponible en: <https://cima.aemps.es/cima/publico/home.html>
- Allen LV Jr, Erickson MA. Stability of Labetalol Hydrochloride, Metoprolol Tartrate, Verapamil Hydrochloride, and Spironolactone with Hydrochlorothiazide in Extemporaneously Compounded Oral Liquids. *Am J Health Syst Pharm.* 1996;53:2304-9.
- Flynn JT, Tullus K. Severe hipertensión in children and adolescents: pathophysiology and treatment. *Pediatr Nephrol.* 2009;24:1101-12.
- Lurbe E, Cifkova R, Cruickshank JK, *et al.* Manejo de la hipertensión arterial en niños y adolescentes: recomendaciones de la Sociedad Europea de Hipertensión. *Hipertens Riesgo Vasc.* 2010;27(2):47-74.
- Micromedex Healthcare® Series [base de datos en Internet]. Greenwood Village, Colorado: Thomson Micromedex Drugdex® System. 1974-2012 [consultado el 21/11/2021]. Disponible en: <http://www.thomsonhc.com/home/dispatch>
- National High Blood Pressure Education Program Working Group on High Blood Pressure in

Children and Adolescents. U.S. Department of Health and Human Services. The fourth report on the Diagnosis, evaluation, and treatment of high blood pressure in children and adolescents. *Pediatrics*. 2004;114(Suppl 2):555-76.

- Robinson RF, Nahata MC, Batisky DL, *et al*. Pharmacologic treatment of chronic pediatric hypertension. *Paediatr Drugs*. 2005;7(1):27-40.
- Thomas CA, Moffett BS, Wagner JL, *et al*. Safety and efficacy of intravenous labetalol for hypertensive crisis in infants and small children. *Pediatr Crit Care Med*. 2011;12(1):28-32.
- UpToDate (Pediatric drug information) [base de datos en Internet]. Waltham, MA: Wolters Kluwer Health Clinical Solutions 2020 [consultado el 21/11/2021]. Disponible en: www.uptodate.com

Fecha de actualización: noviembre de 2020.

La información disponible en cada una de las fichas del Pediamécum ha sido revisada por el Comité de Medicamentos de la Asociación Española de Pediatría y se sustenta en la bibliografía citada. Estas fichas no deben sustituir en ningún caso a las aprobadas para cada medicamento por la Agencia Española del Medicamento y Productos Sanitarios (AEMPS) o la Agencia Europea del Medicamento (EMA).