

Angina:

A maioria dos pacientes com angina pectoris responde a uma dose diária de 100 mg administrada oralmente como dose única ou como 50 mg administrados duas vezes ao dia. É improvável que se obtenha benefício adicional com o aumento da dose.

Arritmias:

Certas arritmias podem ser controladas com uma dose oral de 50-100 mg diárias, administrada em dose única.

Infarto do miocárdio:

Para pacientes que se apresentarem alguns dias após sofrerem um infarto agudo do miocárdio, recomenda-se uma dose oral de 100 mg diários de atenolol para profilaxia a longo prazo do infarto do miocárdio.

Crianças:

Não há experiência pediátrica com atenolol e, por esta razão, não é recomendado para uso em crianças.

Idosos:

Os requisitos da dose podem ser reduzidos, especialmente em pacientes com função renal comprometida.

Insuficiência renal:

Uma vez que atenolol é excretado por via renal, a dose deve ser ajustada nos casos de comprometimento grave de função renal. Não ocorre acúmulo significativo de atenolol em pacientes que tenham um clearance de creatinina superior a 35 mL/mim/1,73m² (a faixa normal é de 100-150 mL/mim/1,73m²). Para pacientes com clearance de creatinina de 15-35 mL/mim/1,73m² (equivalente a creatinina sérica de 300-600 mcml/litro), a dose diária deve ser de 50 mg diários. Para pacientes com clearance de creatinina menor que 15 mL/mim/1,73m² (equivalente a creatinina sérica > 600 mcml/litro) a dose oral deve ser de 25 mg diários ou 50 mg em dias alternados. Os pacientes que se submetem à hemodiálise devem receber 50 mg, por via oral, após cada diálise; isto deve ser feito sob supervisão hospitalar, uma vez que podem ocorrer acentuadas quedas na pressão arterial.

Superdosagem

Os sintomas de superdosagem podem incluir bradicardia, hipotensão, insuficiência cardíaca aguda e broncoespasmo. O broncoespasmo pode normalmente ser revertido por broncodilatadores.

O tratamento geral deve incluir: monitorização cuidadosa, tratamento em unidade de terapia intensiva, uso de lavagem gástrica, carvão ativado e laxante para prevenir a absorção de qualquer droga ainda presente no trato gastrointestinal, plasma ou substitutos do plasma para tratar hipotensão e choque. Hemodiálise ou hemoperfusão também podem ser consideradas. Bradicardia excessiva pode ser controlada com 1-2 mg de atropina por via intravenosa. Se necessário, esse procedimento pode ser seguido de uma dose em bolus de 10 mg de glucagon por via intravenosa. Se necessário, esse procedimento pode ser repetido ou seguido de uma infusão intravenosa de 1-10 mg/hora de glucagon, dependendo da resposta obtida. Se não houver resposta ao glucagon, ou se o mesmo não estiver disponível, pode-se administrar um estimulante beta-adrenérgico, tal como a dobutamina 2,5 lg a 10 lg/Kg/min por infusão intravenosa ou isoprenalina (10 a 25 lg, a velocidade de infusão não superior a 5 lg/mim). Dependendo da quantidade da superdose ingerida, para atingir a resposta desejada, podem ser necessárias doses maiores de dobutamina ou isoprenalina, de acordo com as condições clínicas do paciente. A dobutamina, por seu efeito inotrópico positivo, também poderia ser usada para tratar hipotensão e insuficiência cardíaca aguda. É provável que as doses indicadas sejam inadequadas para reverter os efeitos cardíacos do betabloqueio se uma grande dose tiver sido ingerida. Portanto, a dose de dobutamina deve, se necessário, ser aumentada para que se atinja a resposta exigida de acordo com condições clínicas do paciente. Broncoespasmo pode normalmente ser revertido por broncodilatadores.

Pacientes idosos:

Os requisitos da dose podem ser reduzidos, especialmente em pacientes com função renal comprometida.

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA

Reg. MS: nº 1.0235.0458

Farm. Resp.: Dr. Ronoel Caza de Dio
CRF - SP nº 19.710

Registrado por: EMS S/A

Rod. Jornalista F. A. Proença, km 08

Bairro Chácara Assay

CEP 13186-901 - Hortolândia/SP

CNPJ: 57.507.378/0003-65

INDÚSTRIA BRASILEIRA

Fabricado por: EMS S/A

São Bernardo do Campo - SP

"Lote, Fabricação e Validade: vide cartucho"

 **0800-191914**
www.ems.com.br

089264

atenolol



FORMA FARMACÊUTICA E APRESENTAÇÕES

Comprimidos de 25, 50 e 100mg.

25mg - Embalagem contendo 30 e 60 comprimidos.

50mg - Embalagem contendo 28, 30 e 60 comprimidos

100mg - Embalagem contendo 28, 30 e 60 comprimidos

25, 50 e 100mg - Embalagem Hospitalar contendo 300 comprimidos

25, 50 e 100mg - Embalagem Fracionável contendo 90 comprimidos

USO ORAL

USO ADULTO

COMPOSIÇÃO

Cada comprimido de 25 mg contém:

atenolol25 mg
excipiente* q.s.p.1 com
*talco, croscarmelose sódica, lactose monoidratada, laurilsulfato de sódio, estearato de magnésio, carbonato de magnésio, celulose microcristalina, dióxido de silício, ácido estearico.

Cada comprimido de 50 mg contém:

atenolol50 mg
excipiente* q.s.p.1 com
*talco, croscarmelose sódica, lactose monoidratada, laurilsulfato de sódio, estearato de magnésio, carbonato de magnésio, celulose microcristalina, dióxido de silício, ácido estearico.

Cada comprimido de 100 mg contém:

atenolol100 mg
excipiente* q.s.p.1 com
*talco, croscarmelose sódica, lactose monoidratada, laurilsulfato de sódio, estearato de magnésio, carbonato de magnésio, celulose microcristalina, dióxido de silício, ácido estearico.

INFORMAÇÕES AO PACIENTE

O atenolol é um agente anti-hipertensivo e anti-anginoso.

Mantê-lo à temperatura ambiente (15°C a 30°C). Proteger da luz e manter em lugar seco.

O número de lote e as datas de fabricação e validade deste medicamento estão carimbados na embalagem do produto. Este produto não deve ser utilizado vencido sob risco do efeito esperado não ocorrer.

Informe seu médico a ocorrência de gravidez na vigência do tratamento ou após o seu término. Informar ao médico se está amamentando.

Siga a orientação do seu médico, respeitando sempre os horários, as doses e a duração do tratamento.

Não interromper o tratamento sem o conhecimento do seu médico.

Informe seu médico o aparecimento de reações desagradáveis, tais como cansaço, distúrbios do sono, distúrbios gastrointestinais, manifestações da pele e olhos secos.

TODO MEDICAMENTO DEVE SER MANTIDO FORA DO ALCANCE DAS CRIANÇAS.

A alimentação pode interferir na ação de atenolol; portanto evitar ingerir juntamente com alimentos.

Informe seu médico sobre qualquer medicamento que esteja usando, antes do início, ou durante o tratamento.

Não deve ser utilizado durante a gravidez e a lactação.

Efeito sobre a habilidade de dirigir autos e operar máquinas: o uso de atenolol não resultará em comprometimento da habilidade dos pacientes em dirigir autos ou operar máquinas. Entretanto, deve ser levado em consideração que ocasionalmente pode ocorrer tontura ou fadiga.

NÃO TOME REMÉDIO SEM O CONHECIMENTO DO SEU MÉDICO, PODE SER PERIGOSO PARA A SAÚDE.

INFORMAÇÕES TÉCNICAS

Características

Trata-se de um agente anti-hipertensivo e anti-anginoso.

É cardioseletivo de ação longa, que atua primariamente sobre os receptores β -1.

O atenolol é um betabloqueador β -1 seletivo (isto é, age preferencialmente sobre os receptores adrenérgicos β -1 do coração). A seletividade diminui com o aumento da dose. O atenolol não possui atividade simpatomimética intrínseca nem atividade estabilizadora da membrana. Assim como outros betabloqueadores, o atenolol possui efeitos inotrópicos negativos, e portanto, deve ser evitado na insuficiência cardíaca descompensada. Como ocorre com outras drogas betabloqueadoras, seu modo de ação no tratamento da hipertensão não está completamente elucidado. É provável que a ação do atenolol na redução da frequência e contractilidade cardíaca faça com que ele se mostre eficaz na eliminação ou redução de sintomas de pacientes com angina. O atenolol é bem tolerado na maioria das populações étnicas apesar de sua resposta poder ser menor em pacientes negros.

O atenolol apresenta o grupo benzenodietilamida ligado ao anel aromático. Trata-se do composto com a seguinte fórmula química $C_{17}H_{27}N_2O_2$ com peso molecular igual a 266,34 e nome químico, 4-[2'-hidroxil-3'[(1-metiletil)amino]propoxil] benzenoacetamida. Possui as seguintes características: pó branco ou quase branco; livremente solúvel em metanol; solúvel em ácido acético; pouco solúvel em etanol 96%; ligeiramente solúvel em água, isopropanol; muito pouco solúvel em acetona, dioxano; praticamente insolúvel em acetônitrila, etilacetato, clorofórmio.

A absorção do atenolol após a administração oral é consistente mas incompleta (aproximadamente 40-

BU - 852/LAETUS 131



50%), com picos de concentração plasmática que ocorrem 2-4 horas após a administração da dose. Os níveis sanguíneos de atenolol são consistentes e sujeitos à pequena variabilidade. O atenolol penetra muito pouco nos tecidos devido à sua baixa solubilidade lipídica, e sua concentração no cérebro é baixa. Sua ligação às proteínas plasmáticas é baixa (aproximadamente 3%). Não há metabolismo hepático significativo e mais de 90% da quantidade absorvida alcança a circulação sistêmica inalteradas. A meia-vida plasmática é cerca de 6 horas, mas pode se elevar na presença de comprometimento renal grave, uma vez que os rins são a principal via de eliminação. Os rins são a principal via de eliminação. Aproximadamente 3% do material recuperado na urina estava representado pelo metabólito hidroxilado, sendo demonstrado em estudos realizados em animais como sendo responsável por 10% da atividade farmacológica de atenolol. Aproximadamente 47 a 53% é eliminado na urina e nas fezes, respectivamente.

Indicações

Controle da hipertensão arterial.
Controle da angina pectoris.
Controle de arritmias cardíacas.
Tratamento do infarto do miocárdio.

Contra-indicações

O atenolol não deve ser administrado a crianças. E assim como outros betabloqueadores, não deve ser usado na presença das seguintes situações: hipersensibilidade à substância; bradicardia; choque cardiogênico; hipotensão; acidose metabólica; distúrbios severos da circulação arterial periférica; bloqueio cardíaco de segundo ou terceiro grau; síndrome do nó sinusal; feocromocitoma não tratado; insuficiência cardíaca descompensada; gravidez e Síndrome de Raynaud.

Precauções e Advertências

Deve-se tomar cuidado especial com pacientes cuja reserva cardíaca esteja diminuída. Os betabloqueadores devem ser evitados na insuficiência cardíaca descompensada, entretanto, podem ser usados em pacientes cujos sinais de insuficiência tenham sido controlados.

Oferem risco de maior depressão de contratilidade miocárdica, por isso devem ser administrados com cautela aos que sofrem de insuficiência cardíaca congestiva.

O atenolol pode aumentar o número e a duração dos ataques de angina em pacientes com angina de Prinzmetal, devido à vasoconstrição da artéria coronária mediada por receptores α_1 .

Uma vez que o atenolol é um betabloqueador β_1 seletivo, este deve ser usado com o máximo de cautela. Uma das ações farmacológicas de atenolol é reduzir a frequência cardíaca. Nos raros casos em que os sintomas possam ser atribuíveis à baixa frequência cardíaca, a dose pode ser reduzida.

O atenolol pode modificar a taquicardia da hipoglicemia, nos pacientes tratados com insulina ou hipoglicemiantes orais, e pode mascarar os sinais da tireotoxicose.

O atenolol deve ser administrado com cautela em pacientes com bloqueio cardíaco de primeiro grau, devido ao efeito negativo sobre o tempo de condução.

O atenolol não deve ser descontinuado abruptamente em pacientes que sofrem de doença cardíaca isquêmica. Os beta-bloqueadores, de uma maneira geral, oferecem risco de exacerbação da angina, infarto do miocárdio e arritmias com a interrupção abrupta do tratamento aos pacientes que sofrem de doenças das artérias coronárias.

A suspensão do tratamento deve ser com redução gradual das doses.

O atenolol deve ser usado com cuidado em pacientes com doença obstrutiva crônica das vias respiratórias. Ocasionalmente pode ocorrer aumento na resistência das vias respiratórias em pacientes asmáticos.

Normalmente, este quadro pode ser revertido através da administração das doses comumente usadas de broncodilatadores, tais como o salbutamol ou a isoprenalina.

O atenolol pode agravar os distúrbios da circulação arterial periférica, reduzindo a circulação, principalmente nos pacientes que sofrem de síndrome de Raynaud e outras doenças vasculares periféricas.

O atenolol pode causar reação mais grave à uma variedade de alérgenos quando administrado à pacientes com história de reação anafilática a tais alérgenos. Tais pacientes podem não responder às doses usuais de adrenalina utilizadas no tratamento de reações alérgicas.

Os betabloqueadores devem ser utilizados com cautela nos pacientes que sofrem de insuficiência renal ou hepática, hipertireoidismo e depressão mental.

PEDIATRIA: O atenolol não deve ser administrado a crianças.

GRAVIDEZ E LACTAÇÃO: O atenolol atravessa a barreira placentária e aparece no sangue no cordão umbilical. Há acumulação significativa de atenolol no leite materno. Não foram realizados estudos sobre o uso de atenolol no primeiro trimestre e a possibilidade de danos fetais não pode ser excluída. O atenolol tem sido utilizado sob supervisão cuidadosa para o tratamento de hipertensão no terceiro trimestre. A administração de atenolol a gestantes para o controle de hipertensão leve a moderada foi associada a retardar no crescimento intra-uterino. O uso de atenolol em mulheres que estejam grávidas, amamentando ou que possam engravidar requer que os benefícios antecipados sejam avaliados contra os possíveis riscos, particularmente no primeiro e no segundo trimestre de gravidez.

EFETO SOBRE A HABILIDADE DE DIRIGIR AUTOS E OPERAR MÁQUINAS: o uso de atenolol não resultará em comprometimento da habilidade dos pacientes em dirigir autos ou operar máquinas. Entretanto, deve ser levado em consideração que ocasionalmente pode ocorrer tontura ou fadiga.

Interações medicamentosas

O uso combinado de betabloqueadores e bloqueadores do canal de cálcio com efeitos inotrópicos negativos, como por exemplo, verapamil e diltiazem, pode levar a um aumento destes efeitos, particularmente em pacientes com função ventricular comprometida e/ou anormalidades de condução sinoatrial ou atrioventricular. Isto pode resultar em hipotensão grave, bradicardia e insuficiência cardíaca.

Nenhuma das drogas deve ser administrada intravenosamente antes da descontinuação da outra por 48 horas.

A terapia concomitante com di-hidropiridinas, por exemplo, nifedipino, pode aumentar o risco de hipotensão e pode ocorrer comprometimento cardíaco em pacientes com insuficiência cardíaca latente.

Com xantina, especialmente aminofilina e teofilina, podem provocar inibição mútua dos efeitos terapêuticos.

A associação de glicosídeos digitálicos com betabloqueadores pode aumentar o tempo de condução atrioventricular.

Os betabloqueadores podem exacerbar a hipertensão de rebote que pode ocorrer após a retirada de clonidina. Se as duas drogas estiverem sendo coadministradas o betabloqueador deve ser descontinuado por vários dias, antes da retirada da clonidina. Ao se substituir a terapia com clonidina por terapia com betabloqueadores, a introdução do betabloqueador deve ser adiada por alguns dias após a administração de clonidina ter sido interrompida.

Deve-se tomar cuidado ao se prescrever um betabloqueador juntamente com agentes antiarrítmicos Classe 1, tal como a disopiramida.

A reserpina administrada concomitantemente com betabloqueadores provoca bloqueio, β -adrenérgico aditivo e possivelmente aditivo.

Com agentes antidiabéticos ou insulina, os betabloqueadores podem aumentar o risco de hipoglicemia ou hiperglicemia.

A cimelidina aumenta o efeito, β -bloqueador, por reduzir sua depuração e inibir sua biotransformação.

Os estrogênios podem diminuir seus efeitos antihipertensivos.

O uso concomitante de agentes simpatomiméticos, por exemplo: adrenalina, pode neutralizar os efeitos dos betabloqueadores.

O uso concomitante de inibidores da prostaglandina sintetase (por exemplo, ibuprofeno, indometacina) pode diminuir os efeitos hipotensores dos betabloqueadores.

Os pacientes com história de reação anafilática a vários alérgenos podem não responder às doses usuais de adrenalina utilizadas no tratamento de tais reações.

O atenolol deve ser administrado com cautela quando forem usados agentes anestésicos. O anestesista deve ser informado e a escolha do anestésico deve recair sobre um agente com a menor atividade rotatória negativa possível. O uso de betabloqueadores com drogas anestésicas pode resultar em atenuação da taquicardia de reflexo e aumento do risco de hipotensão. Agentes anestésicos causadores de depressão miocárdica devem ser evitados.

Os betabloqueadores podem potencializar e prolongar a ação de bloqueadores neuromusculares não-despolarizantes.

Podem também diminuir a biotransformação hepática e aumentar o risco de toxicidade de lidocaína.

Interações alimentares

Os alimentos reduzem a biodisponibilidade de atenolol. Portanto, atenolol não deve ser administrado próximo às refeições.

Reações adversas/colaterais

O atenolol é bem tolerado. Em estudos clínicos, os efeitos colaterais relatados foram normalmente atribuíveis às ações farmacológicas do atenolol.

As seguintes reações adversas foram relatadas com atenolol:

Cardiovasculares: bradicardia (casos isolados), piora da insuficiência cardíaca, hipotensão postural que pode estar associada à síncope e extremidades frias. Em pacientes suscetíveis pode ocorrer precipitação de bloqueio cardíaco, aumento da claudicação intermitente, se esta já estiver presente e o fenômeno de Raynaud.

Sistema nervoso central: confusão, tontura, cefaleia, alterações de humor, pesadelos, alucinações e psicoses e distúrbios do sono do tipo observado com outras drogas betabloqueadoras.

Gastrointestinais: distúrbios gastrointestinais e boca seca. Pouco frequentemente foram observadas elevações das transaminases e raros casos de toxicidade hepática, incluindo colestase intra-hepática.

Hematológicas: púrpura e trombocitopenia.

Tegumentares: alopecia, olhos secos, reações cutâneas semelhantes à psoríase, exacerbação da psoríase e rashs cutâneos.

Neurológicas: parestesia.

Respiratórias: pode ocorrer broncoespasmo em pacientes com asma brônquica ou história de queixas asmáticas.

Outras: distúrbios visuais, fadiga, um aumento de anticorpos antinucleares (ANA) foi observado, entretanto, a relevância clínica deste evento não está elucidada.

A incidência clínica é pequena, e na maioria dos casos, os sintomas desaparecem quando o tratamento é suspenso. Deve-se considerar a possibilidade de descontinuação da droga, se qualquer reação não for explicável por outra droga.

Alteração de exames laboratoriais

Não existe na literatura, dados suficientemente seguros em que a administração de atenolol provoque alteração em exames laboratoriais.

Posologia

Adultos:

Hipertensão:

A maioria dos pacientes responde a uma dose única oral diária de 50 a 100 mg. O efeito pleno será alcançado após uma a duas semanas. Pode-se conseguir uma redução adicional na pressão arterial combinando-se atenolol com outros agentes antihipertensivos. Por exemplo, a administração concomitante de atenolol com um diurético, tal como a clortalidona, propicia um tratamento anti-hipertensivo altamente eficaz.

