

Состав

действующее вещество: metoprolol;

1 таблетка содержит метопролола тартрата 50 мг в пересчете на сухое 100% вещество;

вспомогательные вещества: крахмал картофельный, лактоза, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный.

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства: таблетки белого цвета, с плоской поверхностью, риской и фаской. На поверхности таблеток допускаются серые вкрапления.

Фармакотерапевтическая группа

Селективные блокаторы бета-адренорецепторов.

Код АТХ С07А В02.

Фармакодинамика

Метопролола тартрат является кардиоселективным β -адренорецепторов без ВСА и мембраностабилизирующей действия. Влияет преимущественно на β_1 -адренорецепторы сердца, имеет антиангинальное, гипотензивное и антиаритмическое эффекты. У больных, перенесших инфаркт миокарда, снижает риск повторного инфаркта миокарда, а у больных артериальной гипертензией - уменьшает риск сердечно-сосудистых осложнений (инсульта). Доказана его антиишемическая действие в случае безболевого ишемии миокарда и уменьшение гипертрофии левого желудочка у больных с артериальной гипертензией.

Антиангинальный эффект обусловлен уменьшением частоты сердечных сокращений, сократимости миокарда, системного артериального давления, что приводит к уменьшению потребности миокарда в кислороде. Благодаря удлинению диастолы (вследствие отрицательного хронотропным эффекта), улучшается перфузия миокарда.

В отличие от неселективных β -адреноблокаторов метопролола тартрат при применении в средних терапевтических дозах оказывает менее выраженное действие на гладкую мускулатуру бронхов и периферических артерий, высвобождение инсулина, углеводный и липидный обмен.

Фармакокинетика

После приема внутрь абсорбция Метопролола тартрата из желудочно-кишечного тракта почти полная (90%) и не зависит от приема пищи, однако биодоступность составляет около 50% в связи с интенсивным метаболизмом при первом прохождении через печень (65-80%). При длительном применении биодоступность увеличивается благодаря снижению кровообращения в печени и насыщению печеночных ферментов. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 1-2 часа, но влияние на артериальное давление и частоту сердечных сокращений наблюдается (после однократного приема 100 мг) в течение 12 часов.

Период полувыведения - 3-7 ч. При почечной недостаточности он увеличивается до 27 часов и более. Выводится почками в виде метаболитов. При печеночной недостаточности препарат может кумулироваться в организме. Он хорошо проникает через гематоэнцефалический, плацентарный барьер и в грудное молоко. Курение, употребление алкоголя, прием некоторых лекарственных препаратов изменяет метаболизм метопролола тартрата (например, барбитураты, дифенин, рифампицин - повышают, хлорпромазин - уменьшает). Метаболизм в печени снижается при циррозе, поэтому таким пациентам дозу снижают, а концентрацию в плазме крови - контролируют.

Показания

Артериальная гипертензия; стенокардия (в том числе постинфарктная) аритмии (включая суправентрикулярная тахикардия). Предупреждение сердечной смерти и повторного инфаркта после острой фазы инфаркта миокарда. В составе комплексной терапии при тиреотоксикозе. Профилактика приступов мигрени.

Противопоказания

Кардиогенный шок. Синдром слабости синусового узла. Блокада II и III степени. Сердечная недостаточность в стадии декомпенсации (отек легких, гипоперфузия или артериальная гипотензия) длительная или периодическая инотропное терапия, направленная на стимулирование бета-рецепторов. Симптоматическая брадикардия или артериальная гипотензия. Нелеченная феохромоцитома.

Метаболический ацидоз

Подозрение на острый инфаркт миокарда при частоте сердечных сокращений <45 уд / мин, PQ интервале> 0,24 с, систолическое АД <100 мм рт. ст., сердечной блокаде I степени и / или тяжелой сердечной недостаточности. При наличии симптомов сердечной недостаточности состояние пациентов с повторяющимися показателями артериального давления ниже 100 мм рт. ст. в положении лежа перед началом лечения необходимо повторно оценить. Серьезное заболевание периферических сосудов с угрозой гангрены.

Повышенная чувствительность к компонентам препарата или к другим бета-блокаторов.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Метопролол является субстратом фермента CYP 2D6. На концентрацию метопролола в плазме крови могут влиять препараты, ингибирующие CYP 2D6, например хинидин, тербинафин, пароксетин, флуоксетин, сертралин, целекоксиб, пропafenон и дифенгидрамин. В начале лечения этими препаратами может возникнуть необходимость уменьшить дозы метопролола тартрат.

Следует избегать одновременного приема препарата метопролола тартрат с такими лекарственными средствами

Производные барбитуровой кислоты: барбитураты (исследовано для пентобарбитала) стимулируют метаболизм метопролола путем индукции фермента.

Пропafenон: у 4 пациентов, получавших лечение метопрололом, после приема пропafenона концентрации метопролола в плазме крови увеличивались в 2-5 раз, а у 2 пациентов возникли побочные эффекты, типичные для метопролола. Взаимодействие была подтверждена в 8 здоровых добровольцев. Это взаимодействие, возможно, объясняется тем, что пропafenон, подобно хинидина, угнетает метаболизм метопролола через систему цитохрома P450 2D6. Результат такой комбинации непредсказуемый, поскольку пропafenон также бета-блокирующие свойства.

Верапамил: в комбинации с бета-блокаторами (описано для атенолола, пропранолола и Пиндолол) верапамил может вызвать развитие брадикардии и снижение артериального давления. Верапамил и бета-блокаторы имеют аддитивную ингибирующее действие на AV-проводимость и функцию синусового

узла.

Одновременное применение препарата метопролола тартрата с нижеуказанным препаратами может потребовать корректировки доз

Амиодарон: клинические случаи подтверждают то, что у пациентов, принимающих амиодарон, может развиваться выраженная синусовая брадикардия в случае одновременного применения с метопрололом. Амиодарон имеет чрезвычайно длительный период полувыведения (примерно 50 суток) - это означает, что взаимодействие может возникать в течение длительного времени после отмены препарата.

Антиаритмические препараты класса I: антиаритмические средства I класса и бета-блокаторы имеют аддитивную отрицательное инотропное действие, что может приводить к серьезным гемодинамическим побочным эффектам у пациентов с нарушенной функцией левого желудочка. Также следует избегать применения этой комбинации при синдроме слабости синусового узла и нарушении AV проводимости. Такое взаимодействие лучше описано для дизопирамида.

Нестероидные противовоспалительные / противоревматические препараты (НПВП): показано, что НПВП противодействуют антигипертензивное действие бета-блокаторов. Главным образом изучали индометацин. Вероятно, что это взаимодействие не происходит с сулиндаком. Исследование негативного взаимодействия было проведено с диклофенаком.

Гликозиды наперстянки: одновременный прием гликозидов наперстянки и блокаторов бета-рецепторов может увеличивать время AV проводимости и вызвать брадикардию.

Дифенгидрамин: дифенгидрамин уменьшает (в 2,5 раза) метаболизм метопролола к альфа-гидроксиметопрололу через систему CYP 2D6 у лиц, имеющих быструю гидроксиляцию. Эффекты метопролола усиливаются.

Дилтиазем: дилтиазем и блокаторы β -рецепторов имеют аддитивную ингибирующее действие на атриовентрикулярную проводимость и функцию синусового узла. При лечении дилтиаземом наблюдалась выраженная брадикардия.

Эпинефрин: после введения эпинефрина (адреналина) пациентам, которые применяли неселективные блокаторы бета-рецепторов (включая пиндолол и пропранолол), развивалась выраженная артериальная гипертензия и брадикардия (примерно 10 случаев). Кроме того, было сделано предположение, что эпинефрин, который находится в анестетиков местного действия, может

спровоцировать развитие этих реакций при внутрисосудистого введения препарата. Риск, вероятно, меньше в случае применения с кардиоселективным блокаторами бета-рецепторов.

Фенилпропаноламин: фенилпропаноламин (норэфедрин) в разовой дозе 50 мг может приводить к патологическому увеличению диастолического артериального давления у здоровых добровольцев. Пропранолол целом противодействует повышению артериального давления фенилпропаноламином. Однако блокаторы бета-рецепторов могут провоцировать парадоксальные гипертензивные реакции у пациентов, применяющих высокие дозы фенилпропаноламин. Было описано 2 случая гипертонического криза при лечении только фенилпропаноламином.

Хинидин: хинидин ингибирует метаболизм метопролола в так называемых быстрых метаболизаторов со значительным повышением уровней в плазме крови и усилением вследствие этого блокады бета-рецепторов. Соответствующая взаимодействие может наблюдаться с другими бета-блокаторами, которые метаболизируются тем же ферментом (цитохром P450 2D6).

Клонидин: бета-блокаторы могут усиливать гипертензивную реакцию при внезапной отмене клонидина. Если необходимо отменить сопутствующую терапию клонидином, бета-блокатор следует отменить за несколько дней до отмены клонидина.

Рифампицин: рифампицин может стимулировать метаболизм метопролола, что приводит к уменьшению его уровней в плазме крови.

Пациенты, получающие одновременно с метопрололом другие бета-блокаторы (например, глазные капли) или ингибиторы моноаминоксидазы (МАО), должны находиться под тщательным наблюдением. Назначение ингаляционных анестетиков пациентам, которые получают лечение блокаторами бета-рецепторов, усиливает кардиодепрессивный эффект. У пациентов, получающих бета-блокаторы, может возникнуть необходимость в повторном коррекции дозы пероральных противодиабетических средств. Концентрация метопролола в плазме крови может увеличиться, если одновременно вводить циметидин или гидралазин.

Концентрация метопролола в плазме крови может увеличиться, если одновременно употреблять алкоголь.

Пациенты, получающие одновременно с метопрололом блокаторы симпатических ганглиев, должны находиться под тщательным наблюдением.

Метопролол может нарушать элиминацию лидокаина.

Необходимо с осторожностью назначать метопролол пациентам, которые применяют стимуляторы β 2-рецепторов и β 1-рецепторов, а также дигидропиридина.

Может возникнуть необходимость в дополнительной коррекции дозы инсулина у пациентов, получающих бета-блокаторы.

Следует проявлять осторожность при одновременном применении метопролола с эрготамином.

Нужно с осторожностью комбинировать метопролол с другими препаратами с антигипертензивным эффектом.

Особенности применения

Пациентам, получающим лечение бета-блокаторами, не следует вводить верапамил.

Метопролол может приводить к нарушениям периферического артериального кровообращения, таких как перемежающаяся хромота. Пациентам с тяжелыми нарушениями функции почек, с серьезными острыми состояниями и пациентам, которые получают комбинированное лечение препаратами наперстянки, следует уделять особое внимание.

У пациентов со стенокардией Принцметала частота и тяжесть приступов стенокардии может увеличиться вследствие опосредованного альфа-рецепторами сужение коронарных сосудов. Поэтому таким пациентам не следует назначать неселективные бета-блокаторы. Селективные β 1-блокаторы следует применять с осторожностью.

При лечении больных с бронхиальной астмой или другими обструктивными заболеваниями легких следует одновременно назначить адекватную бронхолитическое терапию. Возможно, будет необходимо увеличение дозы стимуляторов β 2-рецепторов.

Во время лечения метопрололом риск влияния на метаболизм углеводов или риск возникновения скрытой гипогликемии меньше, чем при применении неселективных бета-блокаторов.

Очень редко состояние пациентов с нарушением AV проводимости средней степени тяжести может ухудшиться (возможно, до AV-блокады).

Терапия бета-блокаторами может ухудшать эффективность лечения анафилактической реакции. Лечение адреналином в обычных дозах не всегда

приводит к ожидаемому терапевтического эффекта.

Больным с феохромоцитомой при лечении метопролола тартрат необходимо одновременно назначить альфа-блокатор.

Данные контролируемых клинических исследований по эффективности и безопасности применения препарата у пациентов с тяжелой стабильной симптоматической сердечной недостаточностью (класс IV по NYHA (New York Heart Association)) ограничены. Лечение таких пациентов должны проводить только врачи со специальными навыками и опытом (см. Раздел «Способ применения и дозы»).

Пациенты с симптоматической сердечной недостаточностью, сопровождающейся острым инфарктом миокарда и нестабильной стенокардией, были исключены из исследования, в котором устанавливали возможность применения препарата при сердечной недостаточности. Итак, эффективность и безопасность лечения острого инфаркта миокарда, сопровождается сердечной недостаточностью, не имеет документального подтверждения. Противопоказано применять метопролола тартрат при нестабильной, некомпенсированной сердечной недостаточности.

Внезапная отмена бета-блокаторов опасна, особенно у пациентов группы высокого риска, и может ухудшать хронической сердечной недостаточностью, а также повышать риск развития инфаркта миокарда и внезапной летальному исходу. Поэтому прекращать лечение препаратом метопролола с каким-либо причинам необходимо, по возможности, постепенно, в течение не менее 2 недель, когда доза на каждом этапе уменьшается вдвое до последней дозы 12,5 мг (половина таблетки 25 мг). Наименьшую дозу следует принимать в течение не менее 4 суток до полной отмены препарата. В случае возобновления симптомов рекомендуется замедлить снижение дозы.

В случае хирургического вмешательства необходимо предупредить анестезиолога, что пациент принимает метопролола тартрат. Пациентам, которым должно быть проведено хирургическое вмешательство, прекращать лечение бета-блокаторами не рекомендуется. Если отмена метопролола считается необходимым, то она, по возможности, должна происходить не менее чем за 48 часов до общей анестезии. Срочного инициирования применения высоких доз метопролола у пациентов, перенесших несердцеви хирургические вмешательства, следует избегать, поскольку это связано с развитием брадикардии, артериальной гипотензии и инсульта, включая летальные исходы у пациентов с сердечно-сосудистыми факторами риска.

Однако для некоторых пациентов желателен использование бета-блокаторов как премедикации. В таких случаях необходимо выбирать анестетик с незначительным отрицательным инотропным эффектом с целью минимизации риска угнетения деятельности миокарда.

Следует тщательно контролировать гемодинамический статус у пациентов с подозреваемым или определенным инфарктом миокарда.

Применение метопролола может вызвать усиление менее тяжелых нарушений периферического кровообращения.

У пациентов с сердечной недостаточностью в анамнезе или с бедным сердечным резервом следует учитывать потребность в сопутствующей терапии диуретиками.

Применение метопролола может привести к развитию брадикардии у пациентов.

Следует с осторожностью назначать метопролол пациентам с сердечной блокадой I степени.

Метопролол может маскировать ранние симптомы острой гипогликемии при тахикардии, а также симптомы тиреотоксикоза.

Следует уделять серьезное внимание пациентам с псориазом.

При применении метопролола у пациентов с лабильным и сахарным диабетом I типа может возникнуть потребность в коррекции дозы гипогликемического препарата.

Препарат содержит лактозу, поэтому не следует его назначать больным с наследственным дефицитом лактазы, непереносимостью галактозы или нарушениями метаболизма глюкозы / галактозы.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Во время лечения метопролола тартрат может возникнуть головокружение и утомляемость. Пациентов, деятельность которых требует повышенного внимания (управление автомобилем, работа с механизмами), следует предупредить о возможности возникновения таких эффектов.

Применение в период беременности или кормления грудью

Метопролола тартрат не следует применять в период беременности и кормления грудью, если врач не считает, что польза превышает возможный вред для плода / ребенка. Бета-блокаторы уменьшают плацентарный кровоток, что может привести к внутриутробной гибели плода, незрелости и преждевременных родов.

Грудное вскармливание не рекомендуется. Количество метопролола, что попадает в грудное молоко, не должна повлечь значительные бета-блокирующие эффекты у новорожденных, если мать применяет обычные терапевтические дозы.

Способ применения и дозы

Дозу метопролола тартрата устанавливают индивидуально. Максимальная суточная доза составляет 400 мг. Таблетки принимают внутрь с небольшим количеством жидкости, не разжевывая, после еды.

Продолжительность курса лечения устанавливается индивидуально и может составлять 3 года.

При артериальной гипертензии начальная доза составляет 100 мг в сутки однократно или разделена на два приема (утром и вечером). При необходимости суточную дозу можно увеличить до 200 мг.

При стенокардии назначают по 50-100 мг метопролола тартрата 2-3 раза в сутки.

При аритмиях назначают по 50 мг 2-3 раза в сутки. При необходимости суточную дозу увеличивают до 300 мг, разделенную на 2-3 приема.

При гипертиреозе (тиреотоксикозе) назначают по 50 мг 4 раза в сутки. При достижении терапевтического эффекта дозу постепенно уменьшают.

При инфаркте миокарда (лечение желательно начать в течение первых 12 часов после появления боли в груди): по 50 мг каждые 6 часов в течение 48 часов, поддерживающая рекомендуемая суточная доза - 200 мг, в 2 приема. Курс лечения - не менее 3 месяцев.

Профилактика приступов мигрени: назначают метопролола тартрат в дозе 100-200 мг в сутки, разделенную на 2 приема.

Требуется коррекция режима дозирования у пациентов с нарушением функции печени.

Пациентам пожилого возраста и пациентам с почечной недостаточностью коррекция дозы не требуется.

Дети

Применение метопролола тартрата детям противопоказано.

Передозировка

Токсичность: у взрослого человека прием дозы 7,5 г стал причиной летального интоксикации. Прием 100 мг 5-летним ребенком не сопровождался симптомами интоксикации после промывания желудка. Умеренную интоксикацию вызвала доза 450 мг в 12-летнего ребенка и доза 1,4 г у взрослого человека, серьезную интоксикацию у взрослого человека вызывала доза 2,5 г, а доза 7,5 г - очень серьезную интоксикацию.

Симптомы: наиболее важными являются сердечно-сосудистые симптомы, однако в некоторых случаях, особенно у детей и лиц молодого возраста, могут преобладать симптомы со стороны центральной нервной системы и угнетение дыхания. Брадикардия, блокада I-III степени, удлинение интервала QT (исключительный случай), асистолия, снижение артериального давления, недостаточная периферическая перфузия, сердечная недостаточность, кардиогенный шок. Угнетение дыхания, остановка дыхания. Другие: утомляемость, спутанность сознания, потеря сознания, дрибно-розмашистый тремор, судороги, потливость, парестезии, бронхоспазм, тошнота, рвота, спазм пищевода, гипогликемия (особенно у детей) или гипергликемия, гиперкалиемия.

Влияние на почки. Временный миастенический синдром. Одновременное употребление алкоголя, гипотензивных препаратов, хинидина или барбитуратов может ухудшить состояние пациента. Первые признаки передозировки могут наблюдаться через 20 минут - 2 часа после приема препарата.

Лечение: в случае необходимости - промывание желудка, прием активированного угля. Атропин (0,25-0,5 мг взрослым, 10-20 мкг / кг массы тела - детям) следует ввести в промывание желудка (из-за риска вагусной стимуляции). Может потребоваться интубация и использования аппарата искусственного дыхания; адекватное восстановление объема; инфузия глюкозы мониторинг ЭКГ; повторное введение атропина 1-2 мг (главным образом при вагусных симптомах). В случае угнетения функции миокарда инфузия добутамина или допамина и кальция глюбионату 9 мг / мл, 10-20 мл. Можно ввести глюкагон 50-150 мкг / кг в течение 1 минуты с последующей инфузией, а также амринон. В некоторых случаях было эффективным добавления эпинефрина (адреналина). Инфузия натрия (натрия или бикарбоната) в случае продления QRS-комплекса и аритмии. Можно использовать кардиостимулятор. В случае остановки кровообращения могут потребоваться меры по реанимации в течение нескольких часов. При

бронхоспазме назначать тербуталин (инъекция или ингаляция).
Симптоматическая терапия.

Побочные реакции

Побочные реакции наблюдаются примерно у 10% пациентов, обычно они дозозависимы. Побочные реакции, связанные с применением метопролола, приведенные ниже в зависимости от класса органов и частоты. Частоту определены следующим образом: очень часто ($> 1/10$); часто ($> 1/100 - <1/10$); нечасто ($> 1/1000 - <1/100$); редко ($> 1/10000 - <1/1000$); очень редко ($<1/10000$); частота неизвестна (не может быть оценена, исходя из имеющихся данных).

Со стороны крови и лимфатической системы	
редко	тромбоцитопения
Психические расстройства	
нечасто	Депрессия, ночные кошмары, нарушения сна
редко	Нарушение памяти, спутанность сознания, галлюцинации, нервозность, тревожность
частота неизвестна	Ослабление концентрации внимания
Со стороны центральной и периферической нервной системы	
очень часто	утомляемость
часто	Головокружение, головная боль
нечасто	парестезии
редко	нарушение вкуса
частота неизвестна	мышечные судороги
Со стороны органов зрения	

редко	Нарушение зрения, сухость и / или раздражение глаз
частота неизвестна	Симптомы, напоминающие конъюнктивит
Со стороны органов слуха и равновесия	
редко	Звон в ушах
Сердечные расстройства	
часто	Холодные конечности, брадикардия, сердцебиение
нечасто	Временное ухудшение симптомов сердечной недостаточности, кардиогенный шок у пациентов с острым инфарктом миокарда
редко	Удлинение AV проводимости, сердечная аритмия
частота неизвестна	Гангрена у пациентов с тяжелыми нарушениями периферических сосудов
Со стороны дыхательной системы	
часто	Одышка при физической активности
нечасто	Бронхоспазм у пациентов с бронхиальной астмой или астматическими проблемами
частота неизвестна	ринит
Со стороны желудочно-кишечного тракта	
часто	Боль в животе, тошнота, рвота, диарея, запор
частота неизвестна	Сухость во рту
Со стороны печени и желчевыводящей системы	

редко	Повышение уровня трансаминаз
частота неизвестна	гепатит
Со стороны кожи и подкожно-жировой клетчатки	
нечасто	Реакции гиперчувствительности кожи
редко	Обострение псориаза, фотосенсибилизация, гипергидроз, выпадение волос
Со стороны костно-мышечной системы и соединительной ткани	
частота неизвестна	артралгия
Со стороны репродуктивной системы и молочных желез	
редко	Оборотная дисфункция либидо
Общие расстройства	
нечасто	Боль в грудной клетке, отеки, увеличение массы тела

Также при применении метопролола могут наблюдаться бессонница, сонливость, амнезия, сердечная блокада I степени, усиление имеющейся AV-блокады, постуральные расстройства (очень редко с синкопе), феномен Рейно, усиление симптомов перемежающейся хромоты, сыпь (в виде псориатиформной крапивницы и дистрофических поражений кожи), импотенция / сексуальная дисфункция, прекардиальный боль, появление антинуклеарных антител (не связанных с системной красной волчанкой).

Срок годности

3 года.

Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 ° С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток в блистере. По 2 блистера в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

АО «Фармак».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 04080, г. Киев, ул. Кирилловская, 74.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).