

Состав

действующее вещество: metoprolol;

1 таблетка содержит метопролола тартрата 100 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 C07A B02.

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 антигипертензивному действию 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 анестетиках местного действия, может

спровоцировать развитие этих реакций при внутрисосудистого введения препарата. Риск, вероятно, меньше в случае применения с кардиоселективными 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 повторной 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 желательно 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, дрибнорозмашистий 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](#).