Инструкция по применению
Метопролол МЭЗ Таблетки 50 мг 30 шт

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: МОСКОВСКИЙ ЭНДОКРИННЫЙ ЗАВОД
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Метопролол
Количество в упаковке: 30
Дозировка действующего вещества: 50 мг

Описание

Таблетки белого или белого с желтоватым оттенком цвета, плоскоцилиндрической формы с фаской.

Действующее вещество

Метопролол

Состав

1 таблетка содержит:Действующее вещество:метопролола тартрат - 50,00 мгВспомогательные вещества:лактозы моногидрат - 119,60 мгкрахмал картофельный - 10,88 мгповидон (поливинилпирролидонсреднемолекулярный медицинский) - 1,52 мгмагния стеарат - 2,00 мгкарбоксиметап крахмал натрия (примогель) - 6,00 мгтальк - 4,00 мгкремния диоксид коллоидный (аэросил) - 6,00 мг

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Метопролол быстро и почти полностью всасывается (95%) в желудочно- кишечном тракте. Растворимость в жирах умеренная. Подвергается интенсивному пресистемному метаболизму, биодоступность - 50% при первом приеме и возрастает до 70% при повторном применении. Связь с белками плазмы - 10%. Tcmax - 1,5-2 часа после приема. В ходе курсового лечения биодоступность возрастает. Прием пищи повышает биодоступность на 20-40%.Быстро распределяется в тканях, проникает через гематоэнцефалический барьер, плацентарный барьер. Проникает в материнское молоко (концентрация выше, чем в плазме).Метаболизируется в печени, 2 метаболита обладают #-адреноблокирующей активностью. В метаболизме препарата принимает участие изофермент CYP2D6. T1/2 - от 3,5 до 7 часов при приеме внутрь. Около 5% препарата выводится в неизменном виде почками. Не удаляется при гемодиализе.Значительное накопление метаболитов наблюдается у пациентов с креатинкиназой 5 мл/мин, при этом #-адреноблокирующая активность препарата не увеличивается.Лечение пациентов со сниженной функцией почек не требует коррекции дозы препарата.Нарушение функции печени замедляет метаболизм препарата, и в случаях недостаточности функции печени, доза препарата должна быть снижена.

Показания

Артериальная гипертензия, стенокардия, стабильная симптоматическая хроническая сердечная недостаточность с нарушением систолической функции левого желудочка (в качестве вспомогательной терапии к основному лечению хронической сердечной недостаточности), снижение смертности и частоты повторного инфаркта после острой фазы инфаркта миокарда, нарушение сердечного ритма, включая наджелудочковую тахикардию, снижение частоты сокращения желудочков при фибрилляции предсердий и желудочковых экстрасистолах, функциональные нарушения сердечной деятельности, сопровождающиеся тахикардией, профилактика приступов мигрени.

Способ применения и дозы

Внутрь, во время или сразу после приема пищи, таблетки можно делить пополам, но не разжевывать и запивать водой.При артериальной гипертензии начальная доза - 50-100 мг в 1-2 приема (утром и вечером), при недостаточном терапевтическом эффекте суточная доза может быть повышена до 100-200 мг или дополнительно применяют другие антигипертензивные средства.Максимальная суточная доза 200 мг.Вторичная профилактика инфаркта миокарда - 200 мг в сутки в два приема (утром и вечером). При стенокардии, аритмии, профилактике приступов мигрени - 100-200 мг в сутки в два приема (утром и вечером).При функциональных нарушениях сердечной деятельности, сопровождающихся тахикардией, гипертиреозе - по 50 мг 2 раза в сутки (утром и вечером).Пожилым пациентам рекомендуется начинать лечение с 50 мг /сут.Почечная недостаточность не требует коррекции дозы.При печеночной недостаточности может потребоваться коррекция дозы в зависимости от клинического состояния.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к метопрололу или другим компонентам препарата, другим #-адреноблокаторам, кардиогенный шок, атриовентрикулярная блокада II-III степени (без искусственного водителя ритма), синоатриальная блокада, синдром слабости синусового узла, синусовая брадикардия (частота сердечных сокращений менее 50 уд/мин), хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, стенокардия Принцметала, острый инфаркт миокарда (частота сердечных сокращений менее 45 уд/мин, интервал P-Q более 0,24 секунд, систолическое артериальное давление менее 100 мм рт.ст.), непереносимость лактозы, дефицит лактазы и синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции, одновременный прием ингибиторов моноаминоксидазы (МАО), одновременное введение блокаторов "медленных" кальциевых каналов (БМКК) типа верапамила, феохромоцитома (без одновременного использования #-адреноблокаторов), пациентам, получающим длительную или интермиттирующую терапию инотропными средствами и действующими на #-адренорецепторы, возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Применение при беременности и кормлении грудью

При беременности метопролол назначают по строгим показаниям в случае, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода (в связи с возможным развитием у плода брадикардии, артериальной гипотензии, гипогликемии). При этом проводят тщательное наблюдение, особенно за развитием плода. Необходимо строгое наблюдение за новорожденными в течение 48-72 часов после родоразрешения.Если прием препарата необходим в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Побочные действия

Классификация частоты побочных эффектов, рекомендуемая Всемирной организацией здравоохранения (ВОЗ):очень часто - ≥1/10часто - ≥ 1/100 до нечасто - ≥1/1000 до редко - ≥ 1/10000 до очень редко - частота неизвестна - не может быть оценена на основе имеющихся данных.Метопролол хорошо переносится пациентами, побочные эффекты, в основном, являются легкими и обратимыми.Со стороны кроветворной системы: очень редко - тромбоцитопения, лейкопения.Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - синусовая брадикардия, постуральные нарушения (очень редко сопровождающиеся обмороком), похолодание конечностей, ощущение сердцебиения, нечасто - временное усиление симптомов сердечной недостаточности, атриовентрикулярная блокада I степени, кардиогенный шок у пациентов с острым инфарктом миокарда, периферические отеки, боли в области сердца, редко - другие нарушения проводимости миокарда, аритмии, очень редко - гангрена у пациентов с предшествующими тяжелыми нарушениями периферического кровообращения.Со стороны центральной нервной системы: очень часто - повышенная утомляемость, часто - головная боль, головокружение, нечасто - парестезия, судороги, депрессия, снижение концентрации внимания, сонливость или бессонница, ночные кошмары, редко - повышенная нервная возбудимость, тревожность, импотенция/сексуальная дисфункция, болезнь Пейрони, очень редко - амнезия/нарушение памяти, подавленность, галлюцинации.Со стороны органов чувств: редко - нарушение зрения, сухость и/или раздражение глаз, конъюнктивит, нарушение слуха и шум в ушах.Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, боли в животе, диарея, запор, нечасто - рвота, редко - сухость слизистой оболочки полости рта, очень редко нарушение вкусовых ощущений.Со стороны печени: редко - нарушение функции печени, повышение активности "печеночных" трансаминаз, очень редко - гепатит.Со стороны кожных покровов: нечасто - кожная сыпь (по типу псориазной крапивницы), повышенное потоотделение, редко - алопеция, очень редко - фотосенсибилизация, обострение течения псориаза.Со стороны дыхательной системы: часто - одышка при физической нагрузке, нечасто - бронхоспазм, редко - ринит.Со стороны эндокринной системы: редко - гипо-, гипергликемия у пациентов с сахарным диабетом 1 типа, маскировка симптомов тиреотоксикоза.Со стороны опорно-двигательного аппарата: очень редко - артралгия. Со стороны обмена веществ: нечасто - увеличение массы тела, редко - усугубление латентнопротекающего сахарного диабета.Лабораторные показатели: очень редко - снижение концентрации холестерина высокой плотности и повышение триглицеридов в плазме крови.

Передозировка

Симптомы: выраженная тяжелая синусовая брадикардия, головокружение, атриовентрикулярная блокада (вплоть до развития полной поперечной блокады и остановки сердца), снижение артериального давления, обморочные состояния, аритмия, желудочковая экстрасистолия, сердечная недостаточность, кардиогенный шок, остановка сердца, бронхоспазм, потеря сознания, кома, тошнота, рвота, цианоз. Первые признаки передозировки проявляются через 20 минут-2 часа после приема препарата.Лечение: промывание желудка и назначение адсорбирующих лекарственных средств, симптоматическая терапия: при выраженном снижении артериального давления - пациент должен находиться в положении Тренделенбурга, в случае чрезмерного снижения артериального давления, брадикардии и сердечной недостаточности - внутривенно, с интервалом в 2-5 минут, #-адреностимуляторы - до достижения желаемого эффекта или внутривенно 0,5-2 мг атропина. При отсутствии положительного эффекта - допамин, добутамин или норэпинефрин. При гипогликемии - введение 1-10 мг глюкагона, установка трансвенозного интракардиального электростимулятора. При бронхоспазме следует ввести внутривенно стимуляторы #2-адренорецепторов. При судорогах - медленное внутривенное введение диазепама. Гемодиализ неэффективен.

Взаимодействие с другими препаратами

Метопролол является субстратом изофермента CYP2D6, в связи с чем, препараты, ингибирующие изофермент CYP2D6 (хинидин, тербинафин, пароксетин, флуоксетин, сертралин, целекоксиб, пропафенон и дифенгидрамин), могут влиять на плазменную концентрацию метопролола. Индукторы CYP2D6 (производные барбитуровой кислоты, рифампицин) снижают концентрацию метопролола в плазме крови.Комбинации, которых следует избегать: Производные барбитуровой кислоты: барбитураты усиливают метаболизм метопролола, вследствие индукции ферментов. Пропафенон: при применении пропафенона у четырех пациентов, получавших лечение метопрололом, отмечалось увеличение плазменной концентрации метопролола в 2-5 раз, при этом у двух пациентов отмечались побочные эффекты, характерные для метопролола. Данное взаимодействие было подтверждено в ходе исследования на 8 добровольцах, вероятно, взаимодействие обусловлено ингибированием пропафеноном, подобно хинидину, метаболизм метопролола посредством CYP2D6. Принимая во внимание тот факт, что пропафенон обладает свойствами #-адреноблокатора, одновременное применение метопролола и пропафенона не представляется целесообразным. Верапамил: комбинация #-адреноблокаторов (атенолол, пропранолол и пиндолол) и верапамила может вызывать брадикардию и приводить к снижению артериального давления. Верапамил и #-адреноблокаторы

имеют взаимодополняющий ингибирующий эффект на AV проводимость и функцию синусового узла.Комбинации, требующие изменения дозы препарата: Амиодарон: одновременное применение амиодарона и метопролола может приводить к выраженной синусовой брадикардии. Принимая во внимание крайне длительный T1/2 амиодарона (50 дней), следует учитывать возможное взаимодействие спустя продолжительное время после отмены амиодарона. Антиаритмические средства I класса и #-адреноблокаторы могут приводить к суммированию отрицательного инотропного эффекта препарата, который может приводить к серьезным гемодинамическим побочным эффектам у пациентов с нарушенной функцией левого желудочка. Также следует избегать подобной комбинации у пациентов с синдром слабости синусового узла и нарушением AV проводимости. Взаимодействие описано на примере дизопирамида. Нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП): ослабляют антигипертензивный эффект #-адреноблокаторов, за счет задержки Na+ и блокады синтеза простагландинов почками. Данное взаимодействие документировано для индометацина. Вероятно, описанное взаимодействие не будет отмечаться при взаимодействии с сулиндаком. Отсутствие взаимодействия было отмечено в исследованиях с диклофенаком. Дифенгидрамин: уменьшает клиренс метопролола до #-гидроксиметопролола в 2,5 раза. Одновременно наблюдается усиление действия метопролола. Дилтиазем: дилтиазем и #-адреноблокаторы взаимно усиливают ингибирующий эффект на AV проводимость и функцию синусового узла. При комбинации метопролола с дилтиаземом отмечались случаи выраженной брадикардии. Эпинефрин (адреналин): сообщалось о 10 случаях выраженной артериальной гипертензии и брадикардии у пациентов, принимавших одновременно неселективные #-адреноблокаторы (включая пиндолол и пропранолол) и эпинефрин (адреналин). Взаимодействие отмечено и в группе здоровых добровольцев. Предполагается, что подобные реакции могут наблюдаться и при применении эпинефрина одновременно с местными анестетиками при случайном попадании в сосудистое русло. Предполагается, что этот риск гораздо ниже при применении кардиоселективных #-адреноблокаторов. Фенилпропаноламин (норэфедрин): в разовой дозе 50 мг может вызывать повышение диастолического артериального давления до патологических значений у здоровых добровольцев. Пропранолол, в основном, препятствует повышению артериального давления, вызываемого фенилпропаноламином. Однако #-адреноблокаторы могут вызывать реакции пародоксальной артериальной гипертензии у пациентов, получающих высокие дозы фенилпропаноламина. Сообщалось о нескольких случаях развития гипертонического криза на фоне приема фенилпропаноламина. Хинидин: хинидин ингибирует метаболизм метопролола у особой группы пациентов с быстрым гидроксилированием (в Швеции примерно 90% населения), вызывая, главным образом, значительное увеличение плазменной концентрации метопролола и

усиление блокады #-адренорецепторов. Полагают, что подобное взаимодействие характерно и для других #-адреноблокаторов, в метаболизме которых участвует изофермент CYP2D6. Клонидин: гипертензивные реакции при резкой отмене могут усиливаться при одновременном приеме #-адреноблокаторов. При одновременном применении в случае необходимости отмены клонидина прекращение приема #-адреноблокаторов следует начинать за несколько дней до отмены клонидина. Рифампицин: рифампицин может усиливать метаболизм метопролола, уменьшая плазменную концентрацию метопролола.Аллергены, используемые для иммунотерапии, или экстракты аллергенов для кожных проб повышают риск возникновения тяжелых системных аллергических реакций или анафилаксии у пациентов, получающих метопролол.Йодсодержащие рентгеноконтрастные лекарственные средства для внутривенного введения повышают риск развития анафилактических реакций.Гипотензивный эффект ослабляют глюкокортикостероиды и эстрогены (задержка Na+).Фенитоин при внутривенном введении, лекарственные средства для ингаляционной общей анестезии (производные углеводородов) повышают выраженность кардиодепрессивного действия и вероятность снижения артериального давления.Метопролол изменяет эффективность инсулина и пероральных гипогликемических лекарственных средств, маскирует симптомы развивающейся гипогликемии (тахикардию, повышение артериального давления). Снижает клиренс лидокаина и ксантинов (кроме дифиллина) и повышает их концентрацию в плазме, особенно у пациентов с исходно повышенным клиренсом теофиллина под влиянием курения.Сердечные гликозиды, метилдопа, резерпин и гуанфацин, блокаторы медленных кальциевых каналов (верапамил, дилтиазем), амиодарон и другие антиаритмические лекарственные средства повышают риск развития или усугубления брадикардии, атриовентрикулярные блокады, остановки сердца и сердечной недостаточности.Нифедипин может приводить к значительному снижению артериального давления.Диуретики, клонидин, симпатолитики, гидралазин и др. гипотензивные лекарственные средства могут привести к чрезмерному снижению артериального давления.Удлиняет действие недеполяризующих миорелаксантов и антикоагулянтный эффект кумаринов.Три- и тетрациклические антидепрессанты, антипсихотические лекарственные средства (нейролептики), этанол, седативные и снотворные лекарственные средства усиливают угнетение центральной нервной системы.Селективные ингибиторы обратного захвата серотонина, например, пароксетин, флуоксетин, сертралин повышают концентрацию метопролола в плазме крови.Не рекомендуется одновременное применение с ингибиторами МАО, вследствие значительного усиления гипотензивного действия, перерыв в лечении между приемом ингибиторов МАО и метопролола должен составлять не менее 14 дней.Негидрированные алкалоиды спорыньи повышают риск развития нарушений периферического кровообращения.

Особые указания

Контроль за пациентами, принимающими #-адреноблокаторы, включает наблюдение за частотой сердечных сокращений и артериальным давлением (в начале приема - ежедневно, затем 1 раз в 3-4 месяца), концентрацией глюкозы в крови у пациентов с сахарным диабетом (1 раз в 4-5 месяцев). Следует обучить пациента методике подсчета частоты сердечных сокращений и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при частоте сердечных сокращений менее 50 уд/мин. Возможно усиление выраженности аллергических реакций (на фоне отягощенного аллергологического анамнеза) и отсутствие эффекта от введения обычных доз эпинефрина.У пожилых пациентов рекомендуется осуществлять контроль функции почек (1 раз в 4-5 месяцев). Препарат может усилить симптомы нарушения периферического артериального кровообращения. Отмену препарата проводят постепенно, сокращая дозу в течение 10 дней.При артериальной гипертензии эффект наступает через 2-5 дней, стабильное действие отмечается через 1-2 месяца.При стенокардии напряжения подобранная доза препарата должна обеспечивать частоту сердечных сокращений в покое в пределах 55-60 уд/мин, при нагрузке - не более 110 уд/мин. У "курильщиков" эффективность #- адреноблокаторов ниже.При комбинированной терапии с клонидином прием последнего следует прекращать через несколько дней после отмены метопролола, во избежание гипертонического криза. При дозе выше 200 мг/сут уменьшается кардиоселективность.Метопролол может маскировать некоторые клинические проявления тиреотоксикоза (например, тахикардию). Резкая отмена у пациентов с тиреотоксикозом противопоказана, поскольку способна усилить симптоматику.При сахарном диабете может замаскировать тахикардию, вызванную гипогликемией. В отличие от неселективных #-адреноблокаторов практически не усиливает вызванную инсулином гипогликемию и не задерживает восстановление концентрации глюкозы в крови до нормального уровня.При необходимости назначения пациентам с бронхиальной астмой в качестве сопутствующей терапии используют #2-адреностимуляторы, при феохромоцитоме - #-адреноблокаторы.При необходимости проведения хирургического вмешательства необходимо предупредить анестезиолога о проводимой терапии (выбор лекарственного средства для общей анестезии с минимальным отрицательным инотропным действием), отмена препарата не рекомендуется.Рецепрокную активацию n.vagus можно устранить внутривенным введением атропина (1-2 мг). Лекарственные средства, снижающие запасы катехоламинов (например, резерпин), могут усилить действие #-адреноблокаторов, поэтому пациенты, принимающие такие сочетания лекарственных средств, должны находиться под постоянным наблюдением врача на предмет выявления чрезмерного снижения артериального давления или

брадикардии.В случае появления пациентов пожилого возраста нарастающей брадикардии (менее 50 уд/мин), артериальной гипотензии (систолическое АД ниже 100 мм рт.ст.), атриовентрикулярной блокады, бронхоспазма, желудочковых аритмий, тяжелых нарушений функции печени и почек необходимо уменьшить дозу или прекратить лечение. Рекомендуется прекращать терапию при появлении кожных высыпаний и развитии депрессии, вызванной приемом #-адреноблокаторов.Отмену препарата проводят постепенно, сокращая дозу в течение 10 дней. При резком прекращении лечения может возникнуть синдром "отмены" (усиление приступов стенокардии, повышение артериального давления).Особое внимание при отмене препарата необходимо уделить пациентам со стенокардией.Пациенты, пользующиеся контактными линзами, должны учитывать, что на фоне лечения #-адреноблокаторами возможно уменьшение продукции слезной жидкости.Влияние на способность управлять трансп. ср. и мех.:В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения

В защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С.Хранить в недоступном для детей месте.