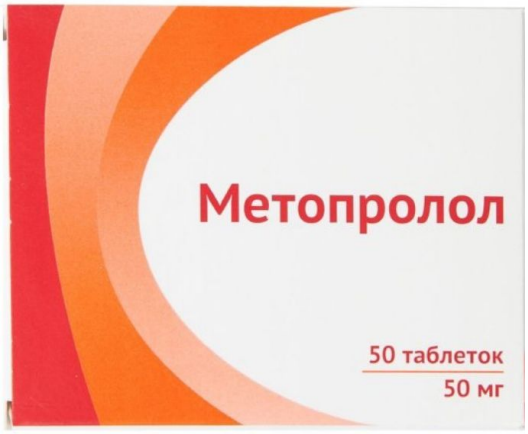
Инструкция по применению
Метопролол-Озон Таблетки 50 мг 60 шт

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: Озон
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Метопролол
Количество в упаковке: 60
Дозировка действующего вещества: 50 мг

Описание

Круглые, плоскоцилиндрические таблетки белого или белого с сероватым оттенком цвета, с фаской и риской.

Действующее вещество

Метопролол

Состав

На одну таблетку: Действующее вещество:метопролола тартрат - 50,0 мг. Вспомогательные вещества (ядро): лактозы моногидрат (сахар молочный), целлюлоза микрокристаллическая, кроскармеллоза натрия, карбоксиметилкрахмал натрия, повидон-К25, магния стеарат, кремния диоксид коллоидный.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Всасывание Метопролол полностью абсорбируется после приема внутрь. Системная биодоступность после приема внутрь однократной дозы составляет приблизительно 30-40 %. Распределение Длительность терапевтического эффекта после приема препарата в лекарственной форме таблетки с пролонгированным высвобождением покрытые пленочной оболочкой составляет более 24 часов при этом достигается постоянная скорость высвобождения действующего вещества в течение 20 часов. Связь с белками плазмы крови низкая примерно 5-10 %. Метаболизм Метопролол подвергается окислительному метаболизму в печени. Три основных метаболита метопролола не обнаруживали клинически значимого #-блокирующего эффекта. Выведение Около 5 % принятой внутрь дозы метопролола выводится с мочой в неизмененном виде остальная часть выводится в виде метаболитов. Период полувыведения составляет в среднем 35 часа.

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, - нарушения 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

Препарат предназначен для ежедневного приема один раз в сутки рекомендуется принимать препарат утром. Таблетку следует проглатывать запивая жидкостью. Таблетки не следует разжевывать или крошить. Прием пищи не влияет на биодоступность препарата. При подборе дозы необходимо избегать развития брадикардии. Артериальная гипертензия 50-100 мг один раз в сутки. При необходимости дозу можно увеличить до 200 мг в сутки или добавить другое гипотензивное средство предпочтительнее диуретик и блокатор "медленных" кальциевых каналов дигидропиридинового ряда. Стенокардия 100-200 мг один раз в сутки. При необходимости к терапии может быть добавлен другой антиангинальный препарат. Стабильная симптоматическая хроническая сердечная недостаточность с нарушением систолической функции левого желудочка Пациенты должны находиться в стадии стабильной хронической сердечной недостаточности без эпизодов

обострения в течение последних 6 недель и без изменений в основной терапии в течение последних 2 недель. Терапия сердечной недостаточности #-адреноблокаторами иногда может привести к временному ухудшению симптоматической картины. В некоторых случаях возможно продолжение терапии или снижение дозы в ряде случаев может возникнуть необходимость отмены препарата. Стабильная хроническая сердечная недостаточность II функциональный класс по классификации NYHA Рекомендуемая начальная доза препарата первые 2 недели 25 мг один раз в сутки. После 2 недель терапии доза может быть увеличена до 50 мг один раз в сутки и далее может удваиваться каждые 2 недели. Поддерживающая доза для длительного лечения 200 мг метопролола один раз в сутки. Стабильная хроническая сердечная недостаточность III-IVфункциональный класс по классификации NYHA Рекомендуемая начальная доза первые 2 недели 125 мг метопролола один раз в сутки. Для обеспечения режима дозирования метопролола по 125 мг рекомендуется назначить препараты метопролола в лекарственной форме "таблетки 25 мг" с риской. Доза подбирается индивидуально. В период увеличения дозы пациент должен находиться под наблюдением так как у некоторых пациентов симптомы сердечной недостаточности могут ухудшиться. Через 1-2 недели доза может быть увеличена до 25 мг метопролола один раз в сутки. Затем по прошествии 2 недель доза может быть увеличена до 50 мг один раз в сутки. Пациентам которые хорошо переносят препарат можно удваивать дозу каждые 2 недели до достижения максимальной дозы 200 мг метопролола один раз в сутки. В случае артериальной гипотензии и/или брадикардии может понадобиться уменьшение сопутствующей терапии или снижение дозы метопролола. Артериальная гипотензия в начале терапии не обязательно указывает что данная доза метопролола не будет переноситься при дальнейшем длительном лечении. Однако доза не должна повышаться до тех пор пока состояние не стабилизируется. Может потребоваться контроль функции почек. Нарушения сердечного ритма 100-200 мг один раз в сутки. Поддерживающее лечение после инфаркта миокарда 200 мг один раз в сутки. Функциональные нарушения сердечной деятельности сопровождающиеся тахикардией 100 мг один раз в сутки. При необходимости дозу можно увеличить до 200 мг в сутки. Профилактика приступов мигрени 100-200 мг один раз в сутки. Пациенты с нарушением функции почек Нет необходимости корректировать дозу у пациентов с нарушением функции почек. Пациенты с нарушением функции печени Обычно из-за низкой степени связывания с белками плазмы крови коррекции дозы метопролола не требуется. Однако при тяжелом нарушении функции печени (у пациентов с тяжелой формой цирроза печени или портокавальным анастомозом) может потребоваться снижение дозы. Пациенты пожилого возраста Нет необходимости корректировать дозу у пациентов пожилого возраста. Дети Опыт применения метопролола у детей ограничен.

Противопоказания

- Атриовентрикулярная блокада II и III степени, - сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, - постоянная или интермиттирующая терапия инотропными препаратами действующими на #-адренорецепторы, - клинически значимая синусовая брадикардия, - синдром слабости синусового узла, - кардиогенный шок, - тяжелые нарушения периферического кровообращения в том числе и при угрозе гангрены, - артериальная гипотензия (систолическое АД менее 100 мм рт. ст.), - подозрение на острый инфаркт миокарда при ЧСС менее 45 ударов в минуту интервалом PQ на электрокардиограмме (ЭКГ) более 024 секунды или систолическим АД менее 100 мм рт. ст., - известная повышенная чувствительность к метопрололу любым другим компонентам препарата или к другим #-адреноблокаторам, - совместное назначение с блокаторами "медленных" кальциевых каналов типа верапамила для внутривенного введения, - возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены), - феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов).

Применение при беременности и кормлении грудью

Как и большинство препаратов метопролол не следует назначать во время беременности и в период грудного вскармливания за исключением тех случаев когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода и/или ребенка. Как и другие антигипертензивные средства #-адреноблокаторы могут вызывать побочные эффекты например брадикардию у плода новорожденных или детей находящихся на грудном вскармливании. Количество метопролола выделяющееся в грудное молоко и #-блокирующее действие у ребенка находящегося на грудном вскармливании (при приеме матерью метопролола в терапевтических дозах) являются незначительными.

Побочные действия

Метопролол хорошо переносится пациентами побочные эффекты в основном являются легкими и обратимыми. Классификация частоты развития побочных эффектов согласно рекомендациям Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): очень часто ⩾ 1/10, часто от ⩾ 1/100 до < 1/10, нечасто от ⩾ 1/1000 до < 1/100, редко от ⩾ 1/10000 до < 1/1000, очень редко < 1/10000 включая отдельные сообщения, частота неизвестна - по имеющимся данным установить частоту возникновения не представляется возможным. Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: очень редко - тромбоцитопения. Нарушения со стороны обмена веществ и питания: нечасто - увеличение массы тела. Нарушения со стороны нервной системы: очень часто - повышенная утомляемость, часто - головокружение головная боль, нечасто - парестезия судороги депрессия снижение концентрации внимания сонливость или бессонница ночные кошмары, редко - повышенная нервная возбудимость тревожность, очень редко - амнезия/нарушения памяти подавленность галлюцинации нарушение вкусовых ощущений. Нарушения со стороны органа зрения: редко - нарушения зрения сухость и/или раздражение глаз конъюнктивит. Нарушения со стороны органов слуха и лабиринтные нарушения: очень редко - звон в ушах. Нарушения со стороны сердца: часто - брадикардия ощущение сердцебиения, нечасто - временное усиление симптомов сердечной недостаточности AV блокада I степени кардиогенный шок у пациентов с острым инфарктом миокарда боль в области сердца, редко - другие нарушения проводимости аритмии. Нарушения со стороны сосудов: часто - ортостатическая гипотензия (очень редко сопровождающаяся обмороком) похолодание конечностей, нечасто - отеки, очень редко - гангрена у пациентов с предшествующими тяжелыми нарушениями периферического кровообращения. Нарушения со стороны дыхательной системы органов грудной клетки и средостения: часто - одышка при физической нагрузке, нечасто - бронхоспазм, редко - ринит. Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: часто - тошнота боли в области живота диарея запор, нечасто - рвота, редко - сухость слизистой оболочкой полости рта. Нарушения со стороны печени и желчевыводящих протоков: редко - нарушения функции печени, очень редко - гепатит. Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто - кожная сыпь (по типу псориазоподобной крапивницы) повышенное потоотделение, редко - выпадение волос, очень редко - фотосенсибилизация обострение течения псориаза. Нарушения со стороны скелетно-мышечной системы и соединительной ткани: очень редко - артралгия. Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез: редко - импотенция/сексуальная дисфункция.

Передозировка

Токсичность: метопролол в дозе 75 г у взрослого вызвал интоксикацию с летальным исходом. У 5-ти летнего ребенка принявшего 100 мг метопролола после промывания желудка не отмечалось признаков интоксикации. Прием 450 мг метопролола подростком 12 лет привел к умеренной интоксикации. Прием 14 г и 25 г метопролола взрослыми вызвал умеренную и тяжелую интоксикацию соответственно. Прием 75 г взрослым привел к крайне тяжелой интоксикации. Симптомы: при передозировке метопрололом наиболее серьезными являются симптомы со стороны сердечно-сосудистой системы однако иногда особенно у детей и подростков могут преобладать симптомы со стороны ЦНС и подавление легочной функции брадикардия AV блокада I-III степени асистолия выраженное снижение АД слабая периферическая перфузия сердечная недостаточность кардиогенный шок, угнетение функции легких апноэ а также повышенная усталость нарушение сознания потеря сознания тремор судороги повышенное потоотделение парестезии бронхоспазм тошнота рвота возможен эзофагеальный спазм гипогликемия (особенно у детей) или гипергликемия гиперкалиемия, воздействие на почки, транзиторный миастенический синдром. Сопутствующий прием алкоголя антигипертензивных средств хинидина или барбитуратов может ухудшить состояние пациента. Первые признаки передозировки могут наблюдаться через 20 мин-2 часа после приема препарата. Лечение: назначение активированного угля в случае необходимости промывание желудка. ВАЖНО! Атропин (025-05 мг в/в для взрослых 10-20 мкг/кг для детей) должен быть назначен до промывания желудка (из-за риска стимулирования блуждающего нерва). При необходимости поддержание проходимости дыхательных путей (интубация) и адекватная вентиляция легких. Восполнение объема циркулирующей крови и инфузии глюкозы. Контроль ЭКГ. Атропин 10-20 мг в/в при необходимости повторяют введение (особенно в случае вагусных симптомов). В случае депрессии миокарда показано инфузионное введение добутамина или допамина. Можно также применять глюкагон 50-150 мкг/кг в/в с интервалом в 1 минуту. В некоторых случаях может быть эффективно добавление к терапии адреналина. При аритмии и обширном желудочковом (QRS) комплексе инфузионно вводят растворы натрия (хлорид или бикарбонат). Возможна установка искусственного водителя ритма. При остановке сердца вследствие передозировки могут понадобиться реанимационные мероприятия в течение нескольких часов. Для купирования бронхоспазма может применяться тербуталин (инъекционно или с помощью ингаляций). Проводится симптоматическое лечение.

Взаимодействие с другими препаратами

Метопролол является субстратом CYP2D6 в связи с чем препараты ингибирующие

CYP2D6 (хинидин тербинафин пароксетин флуоксетин сертралин целекоксиб пропафенон и дифенгидрамин) могут влиять на плазменную концентрацию метопролола. Следует избегать совместного применения со следующими лекарственными средствами: Производные барбитуровой кислоты: барбитураты (исследование проводилось с пентобарбиталом) усиливают метаболизм метопролола вследствие индукции ферментов. Пропафенон: при назначении пропафенона четырем пациентам получавшим 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 метаболизма метопролола посредством системы цитохрома P450 CYP2D6. Принимая во внимание тот факт что пропафенон обладает свойствами #-адреноблокатора совместное назначение метопролола и пропафенона не представляется целесообразным. Верапамил: комбинация #-адреноблокаторов (атенолола пропранолола и пиндолола) и верапамила может вызывать брадикардию и приводить к снижению АД. Верапамил и #-адреноблокаторы имеют взаимодополняющий ингибирующий эффект на атриовентрикулярную проводимость и функцию синусового узла. Комбинация со следующими препаратами может потребовать коррекции дозы: Амиодарон: совместное применение амиодарона и метопролола может приводить к выраженной синусовой брадикардии. Принимая во внимание крайне длительный период полувыведения амиодарона (50 дней) следует учитывать возможное взаимодействие спустя продолжительное время после отмены амиодарона. Антиаритмические средства I класса: антиаритмические средства I класса и р-адреноблокаторы могут приводить к суммированию отрицательного инотропного эффекта который может приводить к серьезным гемодинамическим побочным эффектам у пациентов с нарушенной функцией левого желудочка. Также следует избегать подобной комбинации у пациентов с синдромом слабости синусового узла и нарушением AV проводимости. Взаимодействие описано на примере дизопирамида. Нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП):НПВП ослабляют антигипертензивный эффект #-адреноблокаторов. Данное взаимодействие документировано для индометацина. Вероятно описанное взаимодействие не будет отмечаться при взаимодействии с сулиндаком. Отрицательное взаимодействие было отмечено в исследованиях с диклофенаком. Дифенгидрамин: дифенгидрамин уменьшает клиренс метопролола до #-гидроксиметопролола в 25 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 неселективные #-адреноблокаторы (включая пиндолол и пропранолол) и получавших эпинефрин (адреналин). Взаимодействие отмечено и в группе здоровых добровольцев. Предполагается что подобные реакции могут наблюдаться и при применении эпинефрина совместно с местными анестетиками при случайном попадании в сосудистое русло. Предполагается что этот риск гораздо ниже при применении кардиоселективных #-адреноблокаторов. Фенилпропаноламин: фенилпропаноламин (норэфедрин) в разовой дозе 50 мг может вызывать повышение диастолического АД до патологических значений у здоровых добровольцев. Пропранолол в основном препятствует повышению АД вызываемому фенилпропаноламином. Однако #-адреноблокаторы могут вызывать реакции парадоксальной 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. Полагают что подобное взаимодействие характерно и для других #-адреноблокаторов в метаболизме которых участвует цитохром P450 CYP2D6. Клонидин: гипертензивные реакции при резкой отмене клонидина могут усиливаться при совместном приеме #-адреноблокаторов. При совместном применении в случае отмены клонидина прекращение приема #-адреноблокаторов следует начинать за несколько дней до отмены клонидина. Рифампицин: рифампицин может усиливать метаболизм метопролола уменьшая плазменную концентрацию метопролола. Пациенты одновременно принимающие метопролол и другие #-адреноблокаторы (глазные капли) или ингибиторы моноаминооксидазы (МАО) должны находиться под тщательным наблюдением. На фоне приема #-адреноблокаторов ингаляционные анестетики усиливают кардиодепрессивное действие. На фоне приема #-адреноблокаторов пациентам получающим гипогликемические средства для приема внутрь может потребоваться коррекция дозы последних. Плазменная концентрация метопролола может повышаться при приеме циметидина или гидралазина. Сердечные гликозиды при совместном применении с #-адреноблокаторами могут увеличивать время атриовентрикулярной проводимости и вызывать брадикардию.

Особые указания

Пациентам принимающим #-адреноблокаторы не следует вводить внутривенно блокаторы "медленных" кальциевых каналов типа верапамила. Пациентам с бронхиальной астмой или хронической обструктивной болезнью легких должна быть

назначена сопутствующая терапия #2-адреномиметиком. Необходимо назначать минимально эффективную дозу метопролола при этом может потребоваться увеличение дозы #2-адреномиметика. Не рекомендуется назначать неселективные #-адреноблокаторы пациентам со стенокардией Принцметала. Данной группе пациентов #-селективные адреноблокаторы следует назначать с осторожностью. При применении #1-адреноблокаторов риск их влияния на углеводный обмен или возможность маскирования симптомов гипогликемии значительно меньше чем при применении неселективных #-адреноблокаторов. У пациентов с хронической сердечной недостаточностью в стадии декомпенсации необходимо добиться стадии компенсации как до так и во время лечения препаратом. Очень редко у пациентов с нарушением AV проводимости может наступать ухудшение (возможный исход - AV блокада). Если на фоне лечения развилась брадикардия дозу препарата необходимо уменьшить или следует постепенно отменить препарат. Метопролол может усугублять течение имеющихся нарушений периферического кровообращения в основном вследствие снижения артериального давления. Следует проявлять осторожность при назначении препарата пациентам с тяжелой почечной недостаточностью при метаболическом ацидозе одновременном применении с сердечными гликозидами. У пациентов принимающих #-адреноблокаторы анафилактический шок протекает в более тяжелой форме. Применение эпинефрина (адреналина) в терапевтических дозах не всегда приводит к достижению желаемого клинического эффекта на фоне приема метопролола. Пациентам с феохромоцитомой одновременно с метопрололом следует назначать #-адреноблокатор. Резкая отмена #-адреноблокаторов опасна особенно у пациентов группы высокого риска в связи с чем ее следует избегать. При необходимости отмены препарата ее следует производить постепенно в течение по крайней мере 2 недель с двукратным снижением дозы препарата на каждом этапе до достижения конечной дозы 125 мг (половина таблетки метопролола 25 мг с риской) которую следует принимать как минимум 4 дня до полной отмены препарата. При появлении симптомов (например усиление симптомов стенокардии повышение артериального давления) рекомендуется более медленный режим отмены. Резкая отмена #-адреноблокатора может привести к утяжелению течения хронической сердечной недостаточности и повышению риска инфаркта миокарда и внезапной смерти. В случае хирургического вмешательства следует проинформировать врача-анестезиолога что пациент принимает метопролол. Пациентам которым предстоит хирургическое вмешательство не рекомендуется прекращение терапии #-адреноблокаторами. Следует избегать назначения высоких доз без предварительной титрации доз препарата у пациентов с факторами сердечно-сосудистого риска подвергающихся некардиологическим операциям в связи с повышенным риском брадикардии артериальной гипотензии и инсульта в том числе с летальным исходом. Данные клинических исследований по эффективности и безопасности у пациентов с

тяжелой стабильной симптоматической хронической сердечной недостаточностью (IV класс по классификации NYHA) ограничены. Лечение таких пациентов должно проводиться врачами обладающими специальными знаниями и опытом. Пациенты с симптоматической сердечной недостаточностью в сочетании с острым инфарктом миокарда и нестабильной стенокардией исключались из исследований на основании которых определялись показания к назначению. Эффективность и безопасность метопролола для данной группы пациентов не описана. Применение при нестабильной сердечной недостаточности в стадии декомпенсации противопоказано.

Срок хранения после открытия

3 года. Не применять по истечении срока годности.

Условия хранения

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