

Беталок



Код АТХ:

- [C07AB02](#)

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Метопролол](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)
[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}
[PLC VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Раствор для в/в введения прозрачный, бесцветный.

	1 мл	1 амп.
метопролола тартрат	1 мг	5 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, вода д/и.

5 мл - ампулы бесцветного стекла (5) - поддоны пластиковые (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- [Вегетотропные средства](#)

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

У пациентов с инфарктом миокарда внутривенное введение метопролола уменьшает боль в груди и снижает риск развития мерцания и трепетания предсердий. Внутривенное введение метопролола при первых симптомах (в течение 24 часов после появления первых симптомов) снижает риск развития инфаркта миокарда. Раннее начало лечения метопрололом приводит к улучшению дальнейшего прогноза лечения инфаркта миокарда.

Достигается уменьшение частоты сердечных сокращений (ЧСС) при пароксизмальной тахикардии и мерцании (трепетании) предсердий.

Метопролол - β_1 -адреноблокатор, блокирующий β_1 -рецепторы в дозах значительно меньших, чем дозы, требующиеся для блокирования β_2 -рецепторов. Метопролол обладает незначительным мембраностабилизирующим действием и не проявляет активности частичного агониста. Метопролол снижает или ингибирует агонистическое действие, которое оказывают на сердечную деятельность катехоламины, образующиеся при нервных и физических стрессах. Это означает, что метопролол обладает способностью препятствовать увеличению частоты сердечных сокращений, минутного объема и усилению сократимости миокарда, а также подъему АД, вызываемых режим выбросом

катехоламинов. Пациентам с симптомами обструктивных заболеваний легких при необходимости можно назначать метопролол в сочетании с β_2 -адреномиметиками. При совместном использовании с β_2 -адреномиметиками Беталок в терапевтических дозах в меньшей степени влияет на вызываемую β_2 -адреномиметиками бронходилатацию, чем неселективные β -адреноблокаторы.

Метопролол в меньшей степени, чем неселективные β -адреноблокаторы, влияет на продукцию инсулина и углеводный обмен. Влияние препарата Беталок на реакцию сердечно-сосудистой системы в условиях гипогликемии значительно менее выражено по сравнению с неселективными β -адреноблокаторами. Улучшение качества жизни при лечении препаратом Беталок наблюдали у пациентов после инфаркта миокарда.

Фармакокинетика

Метопролол подвергается окислительному метаболизму в печени с образованием трех основных метаболитов, ни один из которых не обладает клинически значимым β -блокирующим эффектом. Около 5% от принятой дозы выводится с мочой в неизмененном виде. Средний $T_{1/2}$ метопролола из плазмы крови составляет около 3-5 часов.

Показания к применению:

- наджелудочковая тахикардия;
- профилактика и лечение ишемии миокарда, тахикардии и боли при инфаркте миокарда или подозрении на него.

Относится к болезням:

- [Миокардит](#)
- [Тахикардия](#)

Противопоказания:

- атриовентрикулярная блокада II и III степени;
- сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;
- клинически значимая синусовая брадикардия;
- синдром слабости синусового узла,;
- кардиогенный шок;
- выраженные нарушения периферического кровообращения;
- артериальная гипотензия;
- больные с острым инфарктом миокарда при ЧСС менее 45 ударов в минуту, интервалом PQ более 0.24 секунд или систолическим артериальным давлением менее 100 мм рт.ст;
- при серьезных периферических сосудистых заболеваниях при угрозе гангрены;
- пациентам, получающим β -адреноблокаторы, противопоказано внутривенное введение блокаторов «медленных» кальциевых каналов типа верапамила;
- возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);
- известная повышенная чувствительность к метопрололу и его компонентам или к другим β -адреноблокаторам.

С осторожностью: атриовентрикулярная блокада I степени, стенокардия Принцметала, хроническая обструктивная болезнь легких (эмфизема легких, хронический обструктивный бронхит, бронхиальная астма), сахарный диабет, тяжелая почечная недостаточность.

Способ применения и дозы:

Наджелудочковая тахикардия.

Начинают введение с 5 мг (5 мл) препарата Беталок со скоростью 1- 2 мг/мин. Можно повторить введение с 5-ти минутным интервалом до достижения терапевтического эффекта. Обычно суммарная доза составляет 10-15 мг (10-15 мл). Рекомендуемая максимальная доза при внутривенном введении составляет 20 мг (20 мл).

Профилактика и лечение ишемии миокарда, тахикардии и боли при инфаркте миокарда или подозрении на него.

Внутривенно 5 мг (5 мл) препарата. Можно повторить введение с 2 минутным интервалом, максимальная доза - 15 мг (15 мл). Через 15 минут после последней инъекции назначают метопролол для приема внутрь в дозе 50 мг (Беталок) каждые 6 часов в течение 48 часов.

Нарушение функции почек

Нет необходимости корректировать дозу у пациентов с нарушением функции почек.

Нарушение функции печени

Обычно из-за низкой степени связи с белками плазмы, коррекция дозы не требуется. Однако, при тяжелом нарушении функции печени (у пациентов с портокавальными анастомозом) может потребоваться снижение дозы.

Пожилой возраст

Нет необходимости корректировать дозу у пациентов пожилого возраста.

Дети

Опыт применения препарата Беталок у детей ограничен.

Побочное действие:

Беталок хорошо переносится пациентами и побочные эффекты в основном являются легкими и обратимыми.

В результате клинических исследований или при применении препарата Беталок (метопролола тартрат) в клинической практике были описаны следующие нежелательные побочные эффекты. Во многих случаях, причинно-следственная связь с лечением препаратом Беталок не была установлена. Для оценки частоты случаев применяли следующие критерии: очень часто (>10%), часто (1-9.9%), нечасто (0.1-0.9%), редко (0.01-0.09%) и очень редко (<0.01%).

Сердечно-сосудистая система

Часто: брадикардия, постуральные нарушения (очень редко сопровождающиеся обмороком), похолодание конечностей, сердцебиение. Нечасто: временное усиление симптомов сердечной недостаточности, кардиогенный шок у пациентов с острым инфарктом миокарда; AV блокада I степени. Редко: другие нарушения сердечной проводимости, аритмии. Очень редко: гангрена у пациентов с предшествующими тяжелыми нарушениями периферического кровообращения.

ЦНС

Очень часто: повышенная утомляемость. Часто: головокружение, головная боль. Редко: повышенная нервная возбудимость, тревожность, импотенция/сексуальная дисфункция. Нечасто: парестезии, судороги, депрессия, ослабление внимания, сонливость или бессонница, ночные кошмары. Очень редко: амнезия/нарушения памяти, подавленность, галлюцинации

ЖКТ

Часто: тошнота, боли в области живота, диарея, запор. Нечасто: рвота. Редко: сухость во рту.

Печень

Редко: нарушения функции печени.

Кожные покровы

Нечасто: сыпь (в виде крапивницы), повышенная потливость. Редко: выпадение волос. Очень редко: фотосенсибилизация, обострение псориаза.

Органы дыхания

Часто: одышка при физическом усилии. Нечасто: бронхоспазм у пациентов с бронхиальной астмой. Редко: ринит.

Органы чувств

Редко: нарушения зрения, сухость и/или раздражение глаз, конъюнктивит. Очень редко: звон в ушах, нарушения вкусовых ощущений.

Обмен веществ

Нечасто: увеличение массы тела.

Со стороны скелетно-мышечной системы:

Очень редко: артралгия

Кровь

Очень редко: тромбоцитопения.

Передозировка:

Токсичность

Метопролол в дозе 7.5 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 1.4 г и 2.5 г метопролола взрослыми вызвал умеренную и тяжелую интоксикацию, соответственно. Прием 7.5 г взрослым привел к крайне тяжелой интоксикации.

Симптомы

При передозировке метопрололом наиболее серьезными являются симптомы со стороны сердечно-сосудистой системы, но иногда, особенно у детей и подростков, могут преобладать симптомы со стороны ЦНС и подавление легочной функции. Брадикардия, атриовентрикулярная блокада I-III степени, асистолия, выраженное снижение АД, слабая периферическая перфузия, сердечная недостаточность, кардиогенный шок, угнетение функции легких, апноэ, повышенная усталость, нарушение сознания, потеря сознания, тремор, судороги, повышенное потоотделение, парестезии, бронхоспазм, тошнота, рвота, возможен эзофагальный спазм, гипогликемия (особенно у детей) или гипергликемия, гиперкальцемиа, воздействие на почки, транзиторный миастенический синдром. Сопутствующий прием алкоголя, антигипертензивных препаратов, 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 (0.25-0.5 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 1.0-2.0 мг в/в, при необходимости повторяют введение (особенно в случае вагусных симптомов). В случае (подавления) депрессии миокарда показано инфузионное введение добутамина или допамии. 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 увеличении желудочкового комплекса (QRS) 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.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Беременность

Как и большинство препаратов, Беталок не следует назначать во время беременности и в период грудного кормления, за исключением тех случаев, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Как и другие антигипертензивные средства, β-адреноблокаторы могут вызывать побочные эффекты, например, брадикардию у плода, новорожденных или детей, находящихся на грудном вскармливании, в связи с чем следует быть особенно осторожными при назначении β-адреноблокаторов в последний триместр беременности и непосредственно перед родами.

Период лактации

Количество метопролола, выделяющееся в грудное молоко, и β- блокирующее действие у ребенка, находящегося на грудном вскармливании (при приеме матерью метопролола в терапевтических дозах), являются незначительными.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Следует избегать совместного назначения препарата Беталок со следующими препаратами:

Производные барбитуровой кислоты: барбитураты (исследование проводилось с фенобарбиталом) незначительно усиливают метаболизм метопролола, вследствие индукции ферментов.

Пропафенон: при назначении пропафенона четырем пациентам, получавшим лечение метопрололом, отмечаются 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 хинидии, метаболизма метопролола посредством системы цитохрома P4502D6. Принимая во внимание тот факт, что пропафенон обладает свойствами β-адреноблокатора, совместное назначение метопролола и пропафенона не представляется целесообразным.

Верапамил: комбинация β-адреноблокаторов (атенолола, пропранолола и пиндолола) и верапамила может вызывать брадикардию и приводить к снижению АД. Верапамил и β-адреноблокаторы имеют взаимодополняющий ингибирующий эффект на атрио-вентрикулярную проводимость и функцию синусового узла.

Комбинация препарата Беталок со следующими препаратами при которой может потребоваться коррекции дозы:

Антиаритмические средства I класса: Антиаритмические средства I класса и β-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 атриовентрикулярной проводимости. Взаимодействие описано на примере дизопирамида.

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.

Нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП): НПВП ослабляют антигипертензивный эффект β-адреноблокаторов. Данное взаимодействие наиболее документировано для индометацина. Не отмечено описанного взаимодействия для сулиндака. В исследованиях с диклофенаком описанной реакции не отмечалось.

Дифенгидрамин: Дифенгидрамин уменьшает клиренс метопролола до α-гидроксиметопролола в 2.5 раза. Одновременно наблюдается усиление действия метопролола.

Эпинефрин (адреналин): Сообщалось о 10 случаях выраженной артериальной гипертензии и брадикардии у пациентов, принимавших неселективные β-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 β-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, β-адреноблокаторы могут вызывать реакции нарлоксальной 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 гидроксированием (в Швеции примерно 90% населения), вызывая, главным образом, значительное увеличение плазменной концентрации метопролола и усиление β-блокады. Полагают, что подобное взаимодействие характерно и для других β-адреноблокаторов в метаболизме которых участвует цитохром P4502D6.

Клонидин: Гипертензивные реакции при резкой отмене клонидина могут усиливаться при совместном приеме β-адреноблокаторов. При совместном применении, в случае отмены клонидина, прекращение приема β-адреноблокаторов следует начинать за несколько дней до отмены клонидина.

Рифампицин: Рифампицин может усиливать метаболизм метопролола, уменьшая плазменную концентрацию метопролола.

Концентрация метопролола в плазме крови может повышаться при сочетанном применении с цимегидином, гидратазипом, селективными ингибиторами серотонина, такими как пароксетин, флуоксетин и сертратин. Пациенты, одновременно принимающие метопролол и другие β-адреноблокаторы (глазные капли) или ингибиторы моноаминоксидазы (МАО), должны находиться под тщательным наблюдением. На фоне приема β-адреноблокаторов ингаляционные анестетики усиливают кардиодепрессивное действие. На фоне приема β-адреноблокаторов пациентам, получающим пероральные гипогликемические средства может потребоваться коррекция дозы последних. Сердечные гликозиды при совместном применении с β-адреноблокаторами могут увеличивать время атриовентрикулярной проводимости и вызывать брадикардию.

Особые указания и меры предосторожности:

Беталок

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

Пациентам, принимающим β -адреноблокаторы, не следует вводить внутривенно блокаторы «медленных» кальциевых каналов типа верапамила. Пациентам, страдающим бронхиальной астмой или обструктивным заболеванием легких, должна быть назначена сопутствующая бронходилатирующая терапия. В случае необходимости следует увеличить дозу β_2 -адреномиметика. При использовании β_1 -адреноблокаторов риск их влияния на углеводный обмен или возможность маскирования гипогликемии значительно меньше, чем при использовании неселективных β -адреноблокаторов.

У больных с хронической сердечной недостаточностью в стадии декомпенсации необходимо добиться стадии компенсации как до, так и во время лечения препаратом.

Пациентам, страдающим стенокардией Принцметала, не рекомендуется назначать неселективные β -адреноблокаторы.

Очень редко у пациентов с нарушением атриовентрикулярной проводимости может наступать ухудшение (возможный исход - атриовентрикулярная блокада). Если на фоне лечения развилась брадикардия, дозу Беталока необходимо уменьшить. Метопролол может ухудшать симптомы нарушения периферического артериального кровообращения вследствие снижения артериального давления. Следует проявлять осторожность при назначении препарата пациентам, страдающим тяжелой почечной недостаточностью, при метаболическом ацидозе, совместном назначении с сердечными гликозидами. У пациентов, принимающих β -адреноблокаторы, анафилактический шок протекает в более тяжелой форме. Пациентам, страдающим феохромоцитомой, параллельно с препаратом Беталок следует назначать альфа-адреноблокатор. В случае хирургического вмешательства следует проинформировать врача-анестезиолога, что пациент принимает β -адреноблокатор. Не следует назначать повторную дозу - вторую или третью при частоте сердечных сокращений менее 40 ударов в минуту, интервалом PQ более 0.26 секунд и систолическим артериальным давлением менее 90 мм рт.ст.

При нарушениях функции почек

С осторожностью при тяжелых нарушениях функции почек.

Нет необходимости корректировать дозу у пациентов с нарушением функции почек.

При нарушениях функции печени

Из-за низкой степени связи с белками плазмы коррекция дозы у пациентов с нарушением функции печени не требуется. Однако, при тяжелом нарушении функции печени (у пациентов с портокавальными анастомозом) может потребоваться снижение дозы.

Применение в пожилом возрасте

Нет необходимости корректировать дозы у пациентов пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 18 лет.

Условия хранения:

В защищенном от света месте, при температуре ниже 25°C. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Betalok>