

[Беталок \(таблетки\)](#)



Код АТХ:

- [C07AB02](#)

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Метопролол](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)

[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Таблетки белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской и гравировкой "A/mE" на одной стороне.

	1 таб.
метопролола тартрат	100 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, магния стеарат, целлюлоза микрокристаллическая, карбоксиметилкрахмал натрия, кремния диоксид коллоидный безводный, повидон.

100 шт. - флаконы пластиковые (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- [Вегетотропные средства](#)

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Метопролол - β_1 -адреноблокатор, блокирующий β_1 -рецепторы в дозах значительно меньших, чем дозы, требующиеся для блокирования β_2 -рецепторов. Метопролол обладает незначительным мембраностабилизирующим эффектом и не

Беталок (таблетки)

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

проявляет активности частичного агониста. Метопролол снижает или ингибирует агонистическое действие, которое оказывают на сердечную деятельность катехоламины, выделяющиеся при нервных и физических стрессах. Это означает, что метопролол обладает способностью препятствовать увеличению ЧСС, минутного объема и усилению сократимости сердца, а также повышению АД, вызываемых резким 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 метаболизм. Влияние препарата Беталок на реакцию сердечно-сосудистой системы в условиях гипогликемии значительно менее выражено по сравнению с неселективными β -адреноблокаторами.

Клинические исследования показали, что Беталок может вызывать незначительное повышение уровня триглицеридов и уменьшение содержания свободных жирных кислот в крови. В некоторых случаях отмечалось незначительное уменьшение фракции липопротеинов высокой плотности (ЛПВП), что менее выражено, чем в случае применения неселективных β -адреноблокаторов. Однако в одном из клинических исследований было показано значительное снижение уровня общего холестерина в сыворотке крови при лечении метопрололом в течение нескольких лет.

Качество жизни в период лечения препаратом Беталок не ухудшается или улучшается. Улучшение качества жизни при лечении препаратом Беталок наблюдали у пациентов после инфаркта миокарда.

Фармакокинетика

Метопролол почти полностью абсорбируется после приема внутрь. При приеме препарата в пределах терапевтических доз концентрация препарата в плазме крови находится в линейной зависимости от принятой дозы. $T_{C_{max}}$ 1.5-2 часа после приема препарата.

После приема внутрь первой дозы метопролола системного кровообращения достигает около 50% дозы. При повторных приемах показатель системной биодоступности возрастает до 70%. Прием препарата вместе с пищей может повысить системную биодоступность на 30-40%. Связь с белками плазмы крови низкая, около 5-10%.

Метаболизм и выведение

Метопролол подвергается окислительному метаболизму в печени с образованием 3-х основных метаболитов, ни один из которых не обладает клинически значимым β -блокирующим эффектом.

Около 5% от принятой дозы выводится с мочой в неизменном виде, в отдельных случаях этот показатель может достигать 30%.

Средний $T_{1/2}$ метопролола из плазмы крови составляет около 3.5 часов (минимально - 1 час, максимально - 9 часов). Плазменный клиренс составляет приблизительно 1 л/мин.

У пациентов пожилого возраста не наблюдается значительных изменений в фармакокинетике метопролола по сравнению с пациентами молодого возраста. Системная биодоступность и выведение метопролола не меняется у пациентов со сниженной функцией почек. Выведение метаболитов у таких пациентов, однако, снижено. Значительное накопление метаболитов наблюдалось у пациентов со скоростью клубочковой фильтрации менее 5 мл/мин. Однако, такое накопление метаболитов не усиливает β -блокирующий эффект. У пациентов со сниженной функцией печени фармакокинетика метопролола (в связи с низким уровнем связи с белками) меняется незначительно. Однако у пациентов с тяжелой формой цирроза печени или портокавальным анастомозом, биодоступность метопролола может увеличиваться, а общий клиренс уменьшаться. У пациентов с портокавальным анастомозом общий клиренс составлял приблизительно 300 мл/мин, а площадь под кривой концентрация в плазме крови - время (AUC) была в 6 раз больше, по сравнению с аналогичным показателем у здоровых пациентов.

Показания к применению:

- артериальная гипертензия: снижение артериального давления и уменьшение риска сердечно-сосудистой и коронарной смерти (включая внезапную смерть);
- стенокардия;
- нарушения ритма сердца, включая суправентрикулярную тахикардию;
- в комплексной терапии после инфаркта миокарда;
- функциональные нарушения сердечной деятельности, сопровождающиеся тахикардией;
- профилактика приступов мигрени;

— гипертиреоз (комплексная терапия).

Относится к болезням:

- [Артериальная гипертензия](#)
- [Гипертензия](#)
- [Мигрень](#)
- [Миокардит](#)
- [Стенокардия](#)
- [Тахикардия](#)

Противопоказания:

- атриовентрикулярная блокада II и III степени;
- сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;
- пациенты, получающие длительную или интермиттирующую терапию инотропными средствами и действующими на бета-адренорецепторы;
- клинически значимая синусовая брадикардия;
- синдром слабости синусового узла;
- кардиогенный шок;
- выраженные нарушения периферического кровообращения;
- артериальная гипотензия;
- беталок противопоказан больным 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:

Таблетки можно принимать как вместе с пищей, так и натощак.

Артериальная гипертензия

100-200 мг препарата Беталок однократно утром или в два приема; утром и вечером. При необходимости дозу можно увеличить или добавить другое антигипертензивное средство.

Длительная антигипертензивная терапия 100-200 мг препарата Беталок в сутки позволяет снизить общую смертность, включая внезапную смерть, а также частоту возникновения мозговых инсультов и нарушений коронарного кровообращения у пациентов с артериальной гипертензией.

Стенокардия

100-200 мг в сутки в два приема; утром и вечером. При необходимости к терапии может быть добавлен другой антиангинальный препарат.

Нарушения ритма сердца

100-200 мг в сутки в два приема; утром и вечером. При необходимости к терапии может быть добавлен другой антиаритмический препарат.

Беталок (таблетки)

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

Поддерживающая терапия после инфаркта миокарда.

Поддерживающая доза составляет 200 мг в сутки в два приема; утром и вечером. Назначение Беталока в дозе 200 мг в сутки позволяет снизить смертность у пациентов, перенесших инфаркт миокарда, и снизить риск развития повторного инфаркта миокарда (в том числе и у пациентов с сахарным диабетом).

Функциональные нарушения сердечной деятельности, сопровождающиеся тахикардией

100 мг препарата Беталок один раз в сутки, рекомендуется принимать таблетку утром. При необходимости доза может быть увеличена.

Профилактика приступов мигрени

100-200 мг в сутки в два приема; утром и вечером.

Гипертиреоз

150-200 мг в сутки в 3-4 приема.

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 метопролола не требуется. Однако при тяжелом нарушении функции печени (у пациентов с тяжелой формой цирроза печени или 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, побочные эффекты в основном являются легкими и обратимыми.

В результате клинических исследований или при применении препарата Беталок (метопролол тартрат) в клинической практике были описаны следующие нежелательные побочные эффекты. Во многих случаях, причинно-следственная связь с приемом препарата 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, АВ блокада I степени; кардиогенный шок у пациентов с острым инфарктом миокарда. 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. Очень редко: гепатит.

Кожные покровы

Беталок (таблетки)

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

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

Органы дыхания

Часто: одышка при физическом усилии. Нечасто: бронхоспазм. Редко: ринит.

Органы чувств

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

Со стороны скелетно-мышечной системы:

Очень редко: артралгия.

Обмен веществ

Нечасто: увеличение массы тела.

Кровь

Очень редко: тромбоцитопения.

Передозировка:

Симптомы

Последствиями передозировки препарата Беталок могут быть выраженное снижение АД, синусовая брадикардия, атриовентрикулярная блокада, сердечная недостаточность, кардиогенный шок, остановка сердца, бронхоспазм, нарушение сознания/кома, тошнота, рвота и цианоз.

Сопутствующее употребление алкоголя, прием антигипертензивных средств, хинидина или барбитуратов могут привести к ухудшению состояния пациента. Первые признаки передозировки могут проявляться в течение 20 минут-2-х часов после приема препарата.

Лечение

Принять активированный уголь, при необходимости промывание желудка. В случае выраженного снижения АД, брадикардии или угрозы сердечной недостаточности следует вводить β_1 -адреномиметик (например, добутамин) внутривенно с интервалом 2-5 минут или инфузионно до достижения терапевтического эффекта. В случае недоступности селективного P₁-агониста можно вводить внутривенно допамин или атропин сульфат для блокады блуждающего нерва.

Если терапевтический эффект не достигнут, можно использовать другие симпатомиметики, такие как добутамин или норадреналин.

Можно ввести глюкагон в дозе 1-10 мг. Иногда может возникнуть необходимость применения водителя сердечного ритма. Для купирования бронхоспазма следует вводить внутривенно β_2 -адреномиметик.

Необходимо учитывать, что дозы антидотов, необходимые для устранения симптомов, возникающих при передозировке β -адреноблокаторов, намного выше терапевтических, поскольку β -адренорецепторы находятся в связанном состоянии с β -адреноблокатором.

Применение при беременности и кормлении грудью:

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 и/или ребенка. Как и другие антигипертензивные средства, β -адреноблокаторы могут вызывать побочные эффекты, например, брадикардию у плода, новорожденных или детей, находящихся на грудном вскармливании.

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 фенофарбиталом) незначительно 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 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 пиндоллола) 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 может потребовать 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 AV 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.

Дилтиазем: Дилтиазем и β-адреноблокаторы взаимно усиливают ингибирующий эффект на AV проводимость и функцию синусового узла. При комбинации метопролола с дилтиаземом отмечались случаи выраженной брадикардии.

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 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 гидроксигированием (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 р-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 циметидином, гидралазином, селективными ингибиторами серотонина, такими как пароксетин, флуоксетин и сертралин. Пациенты, одновременно принимающие метопролол и другие р-адреноблокаторы (глазные капли) или ингибиторы моноаминооксидазы (MAO), 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:

Пациентам, принимающим β -адреноблокаторы, не следует вводить внутривенно блокаторы «медленных» кальциевых каналов типа верапамила. Пациентам, страдающим обструктивной болезнью легких, не рекомендуется назначать β -адреноблокаторы. В случае плохой переносимости других антигипертензивных средств или их неэффективности, можно назначать метопролол, поскольку он является селективным препаратом. Необходимо назначать минимально эффективную дозу, при необходимости возможно назначение β_2 -адреномиметика.

При использовании β_1 -адреноблокаторов риск их влияния на углеводный обмен или возможность маскирования симптомов 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 AV проводимости может наступать ухудшение (возможный исход - AV блокада). Если на фоне лечения развилась брадикардия, дозу Беталока необходимо уменьшить или следует постепенно отменить препарат.

Метопролол может ухудшать симптомы нарушения периферического кровообращения в основном вследствие снижения артериального давления. Следует проявлять осторожность при назначении препарата пациентам, страдающим тяжелой почечной недостаточностью, при метаболическом ацидозе, совместном назначении с сердечными гликозидами. Пациентам, страдающим феохромоцитомой, параллельно с препаратом Беталок следует назначать альфа-адреноблокатор.

У пациентов с циррозом печени биодоступность метопролола увеличивается. В случае хирургического вмешательства следует проинформировать врача-анестезиолога, что пациент принимает β -адреноблокатор.

Следует избегать резкой отмены препарата. При необходимости отмены препарата, отмену следует проводить постепенно. У большинства пациентов прием препарата можно отменить за 14 дней. Дозу препарата снижают постепенно, в несколько приемов, до достижения конечной дозы 25 мг один раз в сутки. Пациенты с ишемической болезнью сердца должны находиться под тщательным наблюдением врача во время отмены препарата. У пациентов, принимающих β -адреноблокаторы, анафилактический шок протекает в более тяжелой форме.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

При применении препарата возможны эпизоды головокружения или общей слабости, в связи с чем необходимо воздержаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С осторожностью при тяжелой почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

С осторожностью при тяжелых нарушениях функции печени.

Применение в пожилом возрасте

Нет необходимости корректировать дозу у пациентов пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 18 лет.

Условия хранения:

При температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Betalok_tabletki