Метокард



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Метопролол

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с делительной риской.

	1 таб.
метопролола тартрат	50 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, повидон, тальк, магния стеарат, целлюлоза микрокристаллическая, крахмал рисовый.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Таблетки белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с делительной риской.

	1 таб.
метопролола тартрат	100 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, повидон, тальк, магния стеарат, целлюлоза микрокристаллическая, крахмал рисовый.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Кардиоселективный бета$_1$-адреноблокатор, не обладающий внутренней симпатомиметической активностью и мембраностабилизирующими свойствами. Оказывает антигипертензивное, антиангинальное, антиаритмическое действие.

Блокируя в невысоких дозах β_1-адренорецепторы сердца, уменьшает стимулированное катехоламинами образование цАМФ из АТФ, снижает внутриклеточный ток Ca^{2+}, оказывает отрицательное хроно-, дромо-, батмо- и инотропное действие (урежает ЧСС, угнетает проводимость и возбудимость, снижает сократимость миокарда).

ОПСС в начале применения бета-адреноблокаторов (в первые 24 ч после перорального приема) - увеличивается (в результате реципрокного возрастания активности α-адренорецепторов и устранения стимуляции β_2-адренорецепторов), которое через 1-3 дня возвращается к исходному, а при длительном назначении - снижается.

Острое антигипертензивное действие обусловлено уменьшением сердечного выброса, стабильный антигипертензивный эффект развивается в течение 2-3 недель и обусловлен снижением синтеза ренина и

накоплением ренина плазмы, угнетением активности ренин-ангиотензиновой системы (имеет большое значение у пациентов с исходной гиперсекрецией ренина) и ЦНС, восстановлением чувствительности барорецепторов дуги аорты (не происходит усиления их активности в ответ на снижение АД) и, в итоге, уменьшением периферических симпатических влияний. Снижает повышенное АД в покое, при физическом напряжении и стрессе.

АД снижается через 15 мин, максимально - через 2 ч и снижение продолжается в течение 6 ч, диастолическое АД изменяется медленнее: стабильное снижение наблюдается после нескольких недель регулярного приема.

Антиангинальный эффект определяется снижением потребности миокарда в кислороде в результате уменьшения ЧСС (удлинение диастолы и улучшение перфузии миокарда) и сократимости, а также снижением чувствительности миокарда к воздействию симпатической иннервации. Уменьшает число и тяжесть приступов стенокардии и повышает переносимость физической нагрузки.

Антиаритмический эффект обусловлен устранением аритмогенных факторов (тахикардии, повышенной активности симпатической нервной системы, увеличенного содержания цАМФ, артериальной гипертензии), уменьшением скорости спонтанного возбуждения синусного и эктопического водителей ритма и замедлением атриовентрикулярной проводимости (преимущественно в антеградном и, в меньшей степени, в ретроградном направлениях через AV-узел) и по дополнительным путям.

При суправентрикулярной тахикардии, мерцании предсердий, синусовой тахикардии при функциональных заболеваниях сердца и гипертиреозе, препарат урежает ЧСС или даже может привести к восстановлению синусового ритма. Предупреждает развитие мигрени.

При применении в средних терапевтических дозах, в отличие от неселективных бета-адреноблокаторов, оказывает менее выраженное влияние на органы, содержащие β_2-адренорецепторы (поджелудочная железа, скелетные мышцы, гладкая мускулатура периферических артерий, бронхов и матки) и на углеводный обмен. При применении в больших дозах (более 100 мг/сут) оказывает блокирующий эффект на оба подтипа β-адренорецепторов.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь быстро и почти полностью (95%) абсорбируется из ЖКТ. C_{max} метопролола в плазме крови достигается через 1-2 ч после приема внутрь. Биодоступность составляет 50% при первом приеме и возрастает до 70% при повторном применении. Прием пищи повышает биодоступность на 20-40%.

Распределение

Связывание с белками плазмы крови составляет в среднем 10%.

Проникает через ГЭБ и плацентарный барьер. Выделяется с грудным молоком в незначительных количествах.

Метаболизм

Биотрансформируется в печени. Метаболиты не обладают фармакологической активностью.

Выведение

$T_{1/2}$ составляет в среднем 3.5 ч (от 1 до 9 ч). Около 5% препарата выводится в неизменном виде почками. Не удаляется при гемодиализе.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Биодоступность метопролола увеличивается при циррозе печени. Нарушение функции печени замедляет метаболизм препарата.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия (в т.ч. гиперкинетический тип) в виде монотерапии или в комбинации с другими антигипертензивными средствами;

— ИБС: инфаркт миокарда (вторичная профилактика - комплексная терапия), профилактика приступов стенокардии;

— нарушения ритма сердца (наджелудочковая тахикардия, желудочковая экстрасистолия);

— гипертиреоз (комплексная терапия);

— профилактика приступов мигрени.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Желудочковая экстрасистолия
- Инфаркт миокарда
- Мигрень
- Миокардит
- Стенокардия
- Тахикардия
- Экстрасистолия

Противопоказания:

— кардиогенный шок;

— AV-блокада II или III степени;

— синоатриальная блокада;

— СССУ;

— выраженная брадикардия;

— хроническая сердечная недостаточность в фазе декомпенсации;

— стенокардия Принцметала;

— артериальная гипотензия (в случае использования при вторичной профилактике инфаркта миокарда - систолическое АД менее 100 мм рт.ст., ЧСС менее 45 уд./мин);

— период лактации;

— одновременный прием с ингибиторами МАО;

— одновременное в/в введение верапамила;

— возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к метопрололу или другим компонентам препарата, другим бета-адреноблокаторам.

С *осторожностью* следует назначать препарат при сахарном диабете, метаболическом ацидозе, бронхиальной астме, хронической обструктивной болезни легких (эмфизема легких, хронический обструктивный бронхит), облитерирующих заболеваниях периферических сосудов (перемежающаяся хромота, синдром Рейно), хронической печеночной и/или почечной недостаточности, миастении, феохромоцитоме, AV-блокаде I степени, тиреотоксикозе, депрессии (в т.ч. в анамнезе), псориазе, беременности, а также пациентам пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь одновременно с приемом пищи или сразу после еды. Таблетки можно делить пополам, но не разжевывать, и запивать жидкостью.

При *артериальной гипертензии* начальная доза составляет 50-100 мг/сут в 1-2 приема. При необходимости суточную дозу постепенно увеличивают до 100-200 мг. При отсутствии удовлетворительного терапевтического эффекта Метокард можно назначать в комбинации с другими антигипертензивными средствами. Максимальная суточная доза - 200 мг.

При *стенокардии, аритмии, профилактике приступов мигрени* назначают по 100-200 мг/сут в 2 приема (утром и вечером).

При *вторичной профилактике инфаркта миокарда* назначают в дозе 200 мг/сут в 2 приема (утром и вечером).

При *функциональных нарушениях сердечной деятельности, сопровождающихся тахикардией,* препарат назначают в дозе 100 мг/сут в 2 приема (утром и вечером).

У **пациентов пожилого возраста,** при **нарушениях функции почек,** а также **при необходимости проведения гемодиализа** не требуется коррекции дозы препарата.

При **нарушениях функции печени** дозу препарата следует снизить в зависимости от клинического состояния.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: повышенная утомляемость, слабость, головная боль, замедление скорости психических и двигательных реакций; редко - парестезии в конечностях (у больных с перемежающейся хромотой и синдромом Рейно), депрессия, беспокойство, снижение внимания, сонливость, бессонница, кошмарные сновидения, спутанность сознания или кратковременное нарушение памяти, мышечная слабость.

Со стороны органов чувств: редко - снижение зрения, снижение секреции слезной жидкости, сухость и болезненность глаз, конъюнктивит, шум в ушах.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: синусовая брадикардия, сердцебиение, снижение АД, ортостатическая гипотензия, головокружение, иногда - потеря сознания; редко - снижение сократимости миокарда, временное усугубление симптомов хронической сердечной недостаточности (отеки, отечность стоп и/или нижней части голеней, одышка), аритмии, проявление ангиоспазма (усиление нарушения периферического кровообращения, похолодание нижних конечностей, синдром Рейно), нарушение проводимости миокарда.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, боль в животе, сухость во рту, диарея, запор, изменение вкуса, нарушение функции печени, повышение активности печеночных ферментов; крайне редко - гипербилирубинемия.

Дерматологические реакции: крапивница, кожный зуд, сыпь, обострение псориаза, псориазоподобные кожные реакции, гиперемия кожи, экзантема, фотодерматоз, усиление потоотделения, обратимая алопеция.

Со стороны дыхательной системы: заложенность носа, затруднение выдоха (бронхоспазм при назначении в высоких дозах - утрата селективности и/или у предрасположенных пациентов), одышка.

Со стороны эндокринной системы: гипергликемия у больных инсулиннезависимым сахарным диабетом, гипотиреоз.

Со стороны системы кроветворения: редко - тромбоцитопения (необычные кровотечения и кровоизлияния), агранулоцитоз, лейкопения.

Влияние на плод: возможна внутриутробная задержка роста, гипогликемия, брадикардия.

Прочие: боль в спине или суставах; в единичных случаях - незначительное увеличение массы тела, снижение либидо и/или потенции.

Побочные эффекты зависят от индивидуальной чувствительности больного. Обычно они незначительные и исчезают после отмены препарата.

Передозировка:

Симптомы: выраженная тяжелая синусовая брадикардия, головокружение, тошнота, рвота, цианоз, выраженное снижение АД, аритмия, желудочковая экстасистолия, бронхоспазм, обморок, при острой передозировке - кардиогенный шок, потеря сознания, кома, AV-блокада (вплоть до развития полной поперечной блокады и остановки сердца), кардиалгия. Первые признаки передозировки проявляются через 20 мин-2 ч после приема препарата.

Лечение: промывание желудка и назначение адсорбирующих средств, симптоматическая терапия: при выраженном снижении АД больной должен находиться в положении Тренделенбурга; в случае чрезмерного снижения АД, брадикардии и сердечной недостаточности - в/в введение (с интервалом в 2-5 мин) бета-адреностимуляторов - до достижения желаемого эффекта или в/в введение 0.5-2 мг атропина сульфата. При отсутствии положительного эффекта - введение допамина, добутамина или норэпинефрина (норадреналина). В качестве последующих мер, возможно, назначение 1-10 мг глюкагона, постановка трансвенозного интракардиального электростимулятора. При бронхоспазме следует ввести в/в стимуляторы β_2-адренорецепторов.

Метопролол плохо выводится с помощью гемодиализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности Метокард должен применяться только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Метопролол проникает через плацентарный барьер. При необходимости применения препарата во время беременности в связи с возможным развитием у новорожденного брадикардии, артериальной гипотензии, гипогликемии необходимо обеспечить тщательное наблюдение за развитием плода. После родоразрешения необходимо обеспечивать строгий контроль за состоянием новорожденного в течение 48-72 ч.

Метопролол выделяется с грудным молоком. Влияние метопролола на новорожденного не изучено, поэтому при необходимости применения Метокарда в период лактации кормление грудью следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Не рекомендуется одновременное применение с ингибиторами МАО ввиду значительного усиления гипотензивного действия. Перерыв между приемом ингибиторов МАО и метопролола должен составлять не менее 14 дней.

Одновременное в/в введение верапамила может спровоцировать остановку сердца. Одновременное назначение нифедипина приводит к значительному снижению АД.

На фоне одновременного применения с Метокардом средства для ингаляционной общей анестезии (производные углеводородов) повышают риск угнетения функции миокарда и развития артериальной гипотензии.

Бета-адреностимуляторы, теофиллин, кокаин, этрогены (задержка натрия), индометацин и другие НПВС (задержка натрия и блокирование синтеза простагландина почками) ослабляют гипотензивный эффект.

Отмечается усиление угнетающего действия на ЦНС при одновременном применении с эталоном; суммация кардиодепрессивного эффекта - со средствами для общей анестезии; увеличение риска нарушений периферического кровообращения - с алкалоидами спорыньи.

При совместном приеме с пероральныыми гипогликемическими средствами возможно снижение их эффекта; с инсулином - повышение риска развития гипогликемии, усиление ее выраженности и длительности, маскировка некоторых симптомов гипогликемии (тахикардия, потливость, повышение АД).

При сочетании с антигипертензивными средствами, диуретиками, нитроглицерином или блокаторами медленных кальциевых каналов может развиться резкое снижение АД (особая осторожность необходима при сочетании с празозином).

При применении Метокарда с верапамилом, дилтиаземом, антиаритмическими средствами (амиодарон), резерпином, альфа-метилдопой, клонидином, гуанфацином, средствами для общей анестезии и сердечными гликозидами наблюдается увеличение выраженности урежения ЧСС и угнетение AV-проводимости.

Если метопролол и клонидин принимают одновременно, то при отмене метопролола клонидин отменяют через несколько дней (в связи с риском возникновения синдрома отмены).

Индукторы микросомальных ферментов печени (рифампицин, барбитураты) приводят к усилению метаболизма метопролола, к снижению концентрации метопролола в плазме крови и уменьшению эффекта. Ингибиторы микросомальных ферментов печени (циметидин, пероральные контрацептивы, фенотиазины) - повышают концентрацию метопролола в плазме крови.

Аллергены, используемые для иммунотерапии, или экстракты аллергенов для кожных проб при совместном применении с метопрололом повышают риск возникновения системных аллергических реакций или анафилаксии; йодсодержащие рентгеноконтрастные вещества для в/в введения - повышают риск развития анафилактических реакций.

Метопролол при одновременном применении снижает клиренс ксантина (кроме дифиллина), особенно с исходно повышенным клиренсом теофиллина под влиянием курения; снижает клиренс лидокаина, повышает концентрацию лидокаина в плазме крови.

Метокард при одновременном применении усиливает и пролонгирует действие антидеполяризующих миорелаксантов, удлиняет антикоагулянтный эффект кумаринов.

При совместном применении Метокарда с этанолом увеличивается риск выраженного снижения АД.

Три- и тетрациклические антидепрессанты, антипсихотические средства (нейролептики), седативные и снотворные препараты при совместном применении с метопрололом усиливают угнетение ЦНС.

Особые указания и меры предосторожности:

Контроль за больными, принимающими Метокард, включает регулярное наблюдение за ЧСС и АД, содержанием глюкозы крови у больных сахарным диабетом. При необходимости дозу инсулина или пероральных гипогликемических препаратов для больных сахарным диабетом следует подобрать индивидуально.

Следует обучить больного методике подсчета ЧСС и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при ЧСС менее 50 уд./мин. При приеме дозы выше 200 мг/сут уменьшается кардиоселективность.

При сердечной недостаточности лечение метопрололом начинают только после достижения стадии компенсации.

Возможно усиление выраженности реакций повышенной чувствительности (на фоне отягощенного аллергологического анамнеза) и отсутствие эффекта от введения обычных доз эпинефрина (адреналина).

На фоне приема Метокарда могут усилиться симптомы нарушения периферического артериального кровообращения.

Отмену препарата проводят постепенно, уменьшая дозу в течение 10 дней.

При резком прекращении лечения может возникнуть синдром отмены (усиление приступов стенокардии, повышение АД). Особое внимание при отмене препарата необходимо уделять больным стенокардией.

При стенокардии напряжения подобранная доза препарата должна обеспечивать ЧСС в покое в пределах 55-60 уд./мин, при нагрузке - не более 110 уд./мин.

Больные, пользующиеся контактными линзами, должны учитывать, что на фоне лечения бета-адреноблокаторами возможно уменьшение продукции слезной жидкости.

Метопролол может маскировать некоторые клинические проявления гипертиреоза (например, тахикардию). Резкая отмена у больных с тиреотоксикозом противопоказана, поскольку способна усилить симптоматику.

При сахарном диабете Метокард может маскировать тахикардию, вызванную гипогликемией. В отличие от неселективных бета-адреноблокаторов практически не усиливает вызванную инсулином гипогликемию и не задерживает восстановление концентрации глюкозы крови до нормального уровня.

При необходимости назначения пациентам с бронхиальной астмой в качестве сопутствующей терапии используют стимуляторы β_2-адренорецепторов; при феохромоцитоме - альфа-адреноблокаторы.

При необходимости проведения хирургического вмешательства необходимо предупредить анестезиолога о проводимой терапии (выбор средства для общей анестезии с минимальным отрицательным инотропным действием), отмена препарата не рекомендуется.

Препараты, снижающие запасы катехоламинов (например, резерпин), могут усилить действие бета-адреноблокаторов, поэтому больные, принимающие такие сочетания препаратов, должны находиться под постоянным наблюдением врача на предмет выявления чрезмерного снижения АД и брадикардии.

У пожилых пациентов рекомендуется регулярно осуществлять контроль функции печени. Коррекция режима дозирования требуется только в случае появления у больного пожилого возраста нарастающей брадикардии (менее 50 уд/мин), выраженного снижения АД (систолическое АД ниже 100 мм рт. ст.), AV-блокады, бронхоспазма, желудочковых аритмий, тяжелых нарушений функции печени, иногда необходимо прекратить лечение.

Пациентам с тяжелой почечной недостаточностью рекомендуется осуществлять контроль функции почек.

Следует проводить особый контроль за состоянием больных с депрессивными расстройствами, принимающими метопролол; в случае развития депрессии, вызванной приемом бета-адреноблокаторов, рекомендуется прекратить терапию.

Использование в педиатрии

Безопасность и эффективность применения препарата у **детей и подростков в возрасте до 18 лет** не установлена.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В начале лечения метопрололом больные могут испытывать головокружение, усталость. В этом случае они должны воздержаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций. В дальнейшем решать это вопрос следует после оценки индивидуальной реакции пациента на проводимую терапию.

При нарушениях функции почек

С осторожностью следует применять препарат при выраженных нарушениях функции почек.

При нарушениях функции печени

С осторожностью следует применять препарат при выраженных нарушениях функции печени.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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