Метокор Адифарм



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Раствор для в/в введения	**1 мл**
метопролола тартрат	1 мг

5 мл - ампулы (10) - поддоны пластиковые (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Кардиоселективный бета1-адреноблокатор. Метопролол обладает незначительным мембраностабилизирующим действием и не обладает внутренней симпатомиметической активностью. Обладает гипотензивным, антиангинальным и антиаритмическим действием.

Блокируя бета1-адренорецепторы сердца, уменьшает стимулированное катехоламинами образование циклического аденозинмонофосфата (цАМФ) из аденозинтрифосфорной кислоты (АТФ), снижает внутриклеточный ток ионов кальция, оказывает отрицательное хроно-, дромо-, батмо- и инотропное действие (урежает ЧСС), угнетает проводимость и возбудимость, снижает сократимость миокарда).

Общее периферическое сосудистое сопротивление (ОПСС) в начале применения бета-адреноблокаторов (в первые 24 ч после приема внутрь) увеличивается (в результате реципрокного возрастания активности альфа-адренорецепторов и устранения стимуляции бета2-адренорецепторов), которое через 1-3 дня возвращается к исходному, а при длительном применении снижается.

Гипотензивное действие обусловлено рефлекторным уменьшением минутного объема крови и синтеза ренина, угнетением активности ренин-ангиотензин-альдостероновой системы (РААС) (имеет большее значение у больных с исходной гиперсекрецией ренина) и центральной нервной системы (ЦНС), восстановлением чувствительности барорецепторов дуга аорты (не происходит усиления их активности в ответ на снижение АД) и в итоге уменьшением периферических симпатических влияний.

Антиангинальный эффект определяется снижением потребности миокарда в кислороде в результате урежения ЧСС (удлинение диастолы и улучшение перфузии миокарда) и сократимости, а также снижением чувствительности миокарда к воздействию симпатической иннервации.

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 атриовентрикулярного (АВ) проведения (преимущественно в антеградном и в меньшей степени в ретроградном направлениях через АВ узел) и по дополнительным путям.

В отличие от неселективных бета-адреноблокаторов при назначении в средних терапевтических дозах оказывает

менее выраженное влияние на органы, содержащие бета2-адрснорсцепторы (поджелудочная железа, скелетные мышцы, гладкая мускулатура периферических артерий, бронхов и матки). При применении в больших дозах (более 100 мг/сут) оказывает блокирующий эффект на оба подтипа бета-адренорецепторов.

При инфаркте миокарда в/в введение уменьшает выраженность загрудинной боли, снижает риск развития мерцания и трепетания предсердий. При первых симптомах инфаркта миокарда (в течение 24 ч после их появления) снижает риск дальнейшего прогрессирования инфаркта миокарда. Раннее начало лечения улучшает дальнейший прогноз лечения инфаркта миокарда.

При в/в инфузии метопролола в течение 10 мин и более максимальное действие развивается через 20 мин, урежение сердечного ритма при дозах 5 и 10 мг составляет 10 и 15% соответственно.

Фармакокинетика

Время достижения C_{max} в плазме крови составляет 20 мин - после в/в введения.

Связь с белками плазмы крови - 10%. C_{max} достигается в плазме крови через 1 ч после в/в введения 20 мг - 200 нмоль/л. Быстро распределяется в тканях, проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьер. Проникает в материнское молоко (концентрация выше, чем в плазме крови).

Метаболизируется в печени, 2 метаболита обладают бета-адреноблокирующей активностью. В метаболизме препарата принимает участие изофермент CYP2D6. Свыше 95% в/в введенной дозы выделяется почками, 5% - в неизмененном виде. $T_{1/2}$ - 5-15 мин - при в/в введении. Системный клиренс при в/в введении - 1 л/мин. Не удаляется при гемодиализе. Значительное накопление метаболитов наблюдается у пациентов с клиренсом креатинина 5 мл/мин, при этом бета-адреноблокирующая активность препарата не увеличивается.

Биодоступность увеличивается при циррозе печени, при этом сокращается его общий клиренс (больные с наложенным портокавальным анастомозом имеют общий клиренс после в/в введения около 300 мл/мин, а AUC - в 6 раз выше, чем у здоровых добровольцев).

Показания к применению:

— наджелудочковая тахикардия;

— профилактика и лечение ишемии миокарда, тахикардии и болевого синдрома при инфаркте миокарда или при подозрении на него.

Относится к болезням:

- Миокардит
- Тахикардия

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к препарату;

— острый инфаркт миокарда (ЧСС менее 45 уд./мин, интервал PQ более 0.24 с; систолическое АД менее 100 мм рт.ст.);

— кардиогенный шок;

— атриовентрикулярная блокада (AV) блокада II-III степени;

— синдром слабости синусового узла;

— клинически значимая синусовая брадикардия;

— хроническая сердечная недостаточность (в стадии декомпенсации);

— артериальная гипотензия (для лечения наджелудочковой тахикардии - систолическое АД менее 110 мм рт.ст.);

— выраженные нарушения периферического кровообращения, угроза гангрены; одновременное в/в введение верапамила;

— возраст до 18 лет.

С осторожностью: AV блокада I степени, стенокардия Принцметала, хроническая обструктивная болезнь легких, сахарный диабет, выраженная почечная недостаточность.

Способ применения и дозы:

Парентеральное введение препарата Метокор Адифарм должно проводиться специально подготовленным персоналом, при наличии кардиореспираторного контроля и возможности проведения реанимационных мероприятий. Для купирования пароксизмальной суправентрикулярной тахикардии вводится парентерально, в условиях стационара, в/в медленно в дозе 2-5 мг (1-2 мг/мин). При отсутствии терапевтического эффекта введение можно повторить через 5 мин. Увеличение дозы свыше 15 мг обычно не приводит к большей выраженности действия.

После купирования приступа аритмии больных переводят на прием препарата внутрь в дозе 50 мг 4 раза в сут, причем первая доза принимается через 15 мин после прекращения в/в введения.

В острой стадии инфаркта миокарда немедленно после госпитализации пациента (при постоянном контроле за гемодинамикой: ЭКГ, частоты сердечных сокращений, AV проводимостью, АД) следует ввести в/в болюсно 5 мг, при необходимости введение повторяют каждые 2 мин до достижения суммарной дозы 15 мг. Через 15 мин после последнего в/в введения и при хорошей переносимости, необходимо назначить метопролол для приема внутрь - 50 мг метопролола каждые 6 ч в течение 2 дней.

Применение у больных с почечной недостаточностью. Коррекции дозы не требуется.

Применение у больных с печеночной недостаточностью. Обычно больным с циррозом печени коррекцию дозы не проводят; в случае тяжелого нарушения функции печени может возникнуть необходимость в снижении дозы.

Применение у больных пожилого возраста. Коррекции дозы не требуется.

Побочное действие:

Частота: очень часто (более 10%), часто (1-10%), нечасто (0.1-1%), редко (0.01-0.1%), очень редко (менее 0.1%).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - брадикардия, ортостатическая гипотензия (в т.ч. с обмороком), похолодание нижних конечностей, ощущение сердцебиения; нечасто - временное усиление симптомов сердечной недостаточности, кардиогенный шок у пациентов с инфарктом миокарда, AV блокада I степени; редко - нарушения проводимости, аритмия; очень редко - гангрена (у пациентов с нарушениями периферического кровообращения).

Со стороны нервной системы: очень часто - повышенная утомляемость; часто -головокружение, головная боль; редко - повышенная нервная возбудимость, тревога, импотенция/сексуальная дисфункция; нечасто - парестезии, судороги, депрессия, снижение концентрации внимания, сонливость, бессонница, "кошмарные" сновидения; очень редко - амнезия/нарушение памяти, подавленность, галлюцинации.

Со стороны органов чувств: редко - нарушение зрения, сухость и/или раздражение глаз, конъюнктивит, очень редко - звон в ушах, нарушение вкусовых ощущении.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: часто - тошнота, боль в животе, запор или диарея; нечасто - рвота; редко - сухость слизистой оболочки полости рта, нарушение функции печени.

Со стороны кожных покровов: нечасто - крапивница, усиление потоотделения; редко -алопеция; очень редко - фотосенсибилизация, обострение псориаза.

Со стороны дыхательной системы: часто - одышка при физическом усилии; нечасто - бронхоспазм у пациентов с бронхиальной астмой; редко - ринит.

Прочие: нечасто - увеличение массы тела; очень редко - артралгия, тромбоцитопения.

Передозировка:

Симптомы: выраженная тяжелая синусовая брадикардия, головокружение, AV блокада (вплоть до развития полной поперечной блокады и остановки сердца), выраженное снижение АД, слабая периферическая перфузия, повышенная утомляемость, обморок, аритмия, желудочковая экстрасистолия, сердечная недостаточность, кардиогенный шок, угнетение функции легких, апноэ, асистолия, бронхоспазм, нарушение сознания, вплоть до его утраты, тремор, судороги, усиление потоотделения, парестезии, кома, тошнота, рвота, гипо- или гипергликемия, гиперкалиемия, транзиторная мышечная слабость. Первые признаки передозировки проявляются через 20 мин - 2ч после введения препарата.

Лечение: симптоматическое.

При выраженном снижении АД - больной должен находиться в положении Тренделенбурга; в случае чрезмерного снижения АД, брадикардии и сердечной недостаточности - в/в, с интервалом в 2-5 мни, бета-адреномиметики - до достижения желаемого эффекта или в/в 0.5-2 мг атропина. При отсутствии положительного эффекта - допамин,

добутамин или норэпинефрин.

В качестве последующих мер возможно применение 1-10 мг глюкагона, постановка трансвенозного интракардиального электростимулятора.

При броихоспазме следует ввести в/в стимуляторы бета2-адреномиметики. При судорогах - медленное в/в введение диазепама. Гемодиализ неэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности Метокор Адифарм назначают только по строгим показаниям в случае, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода (в связи с возможным развитием у плода брадикардии, артериальной гипертензии, гипогликемии). При этом проводят тщательное наблюдение, особенно за развитием плода. Необходимо строгое наблюдение за новорожденными в течение 48-72 ч после родоразрешения.

Если применение препарата Метокор Адифарм необходимо в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Барбитураты усиливают метаболизм метопролола вследствии индукции микросомальных ферментов печени.

Пропафенон повышает пламзенную концентрацию метопролола в 2-5 раз (вероятно в результате ингибирования пропафеноном изофермента CYP2D6).

Одновременное в/в введение верапамила может вызвать брадикардию и выраженное снижение АД.

Антиаритмические средства I класса могут приводить к суммированию отрицательного инотропного эффекта с развитием выраженных гемодинамических побочных эффектов у пациентов с нарушением функции левого желудочка (следует избегать данной комбинации у пациентовс синдромом слабости синусового узла и нарушением AV проводимости).

Амиодарон - риск развития выраженной синусовой брадикардии (в т.ч. спустя продолжительное время после отмены амиодарона, вследствие его длительного периода полувыведения).

Дилтиазем - риск развития выраженной брадикардии (взаимное усиление ингибирующего влияния на AV проводимость и функцию синусового узла). Гипотензивный эффект ослабляют нестероидные противовоспалительные препараты (задержка натрия и блокада синтеза простаглаидинов почками). Дифенгидрамин снижает клиренс метопролола, усиливая его действие. Эпинсфрин - риск развития выраженного снижения АД и брадикардии. Феннлпропаноламин в высоких дозах - парадоксальное повышение АД (вплоть до гипертонического криза).

Хинидин ингибирует метаболизм метопролола у быстрых ацетиляторов, приводя к значительному повышению концентрации метопролола в плазме и усилению его бета-адреноблокирующего действия.

Клонидин - риск выраженного повышения АД при резкой отмене клонидина на фоне одновременного приема бета-адреноблокаторов, поэтому в случае отмены клонидина, постепенное прекращение приема бета-адреноблокаторов необходимо начинать за несколько дней до его отмены.

Рифампицин - усиливает метаболизм метопролола снижая концентрацию в плазме.

Циметидин, гидралазин, селективные ингибиторы обратного захвата серотонина (в т.ч. пароксетин, флуоксетин, сертралин) повышают концентрацию метопролола в плазме крови.

Лекарственные средства для ингаляционной анестезин усиливают кардиодепресивное действие метопролола.

При применении др. бета-адреноблокаторов в глазных каплях и ингибиторов моноаминооксидазы (МАО) следует соблюдать осторожность.

На фоне применения метопролола может потребоваться коррекция доз гипогликемических средств для приема внутрь.

Сердечные гликозиды повышают риск развития брадикардин.

Аллергены, используемые для иммунотерапии, или экстракты аллергенов для кожных проб повышают риск возникновения тяжелых системных аллергических реакций или анафилаксии у больных, получающих метопролол.

Йодсодержащие рентгеноконтрастные средства для в/в введения повышают риск развития анафилактических реакций.

Особые указания и меры предосторожности:

При комбинированной терапии с клонидином прием последнего следует прекращать через несколько дней после отмены препарата Метокор Адифарм, во избежание гипертонического криза.

При необходимости применения у пациентов с сопутствующей бронхиальной астмой необходимо дополнительно применять бета2-адреномнмстики; при феохромоцитоме -альфа-адреноблокаторы.

При необходимости проведения хирургического вмешательства необходимо предупредить анестезиолога о проводимой терапии (выбор лекарственного средства для общей анестезии с минимальным отрицательным инотропным действием). У пациентов с исходным нарушением AV проводимости на фоне лечения метопрололом может наступить ухудшение (возможный исход - AV блокада). При развитии брадикардии его дозу снижают.

Метокор Адифарм может ухудшать симптомы нарушения периферического кровообращения, в основном вследствие снижения ЛД.

Не следует вводить повторную дозу при частоте сердечных сокращений менее 40 уд/мин, интервалом PQ более 0.26 с и систолическим АД менее 90 мм рт.ст.

Влияние на способность управления транспортными средствами и механизмами. Поскольку при применении препарата могут развиться головокружение и слабость, следует соблюдать осторожность при управлении автотранспортом и работе с потенциально опасными механизмами.

При нарушениях функции почек

Применение у больных с почечной недостаточностью: коррекции дозы не требуется. С осторожностью: выраженная почечная недостаточность.

При нарушениях функции печени

Обычно больным с циррозом печени коррекцию дозы не проводят; в случае тяжелого нарушения функции печени может возникнуть необходимость в снижении дозы.

Применение в пожилом возрасте

Коррекции дозы у пожилых пациентов не требуется.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

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

Срок годности. 3 года. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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