Метопролол



Код АТХ:

- C07AB02

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, покрытые пленочной оболочкой от белого до желтовато-белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне.

	1 таб.
метопролола тартрат	100 мг

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный безводный, целлюлоза микрокристаллическая, натрия карбоксиметилкрахмал (тип А), магния стеарат.

Состав оболочки: гипромеллоза, полисорбат 80, тальк, титана диоксид (Е171).

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

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой розоватого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне.

	1 таб.
метопролола тартрат	50 мг

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный безводный, целлюлоза микрокристаллическая, натрия карбоксиметилкрахмал (тип А), магния стеарат.

Состав оболочки: гипромеллоза, полисорбат 80, тальк, титана диоксид (Е171), краситель пунцовый (Понсо 4R).

14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Метопролол относится к кардиоселективным блокаторам β-адренорецепторов, не обладающей внутренней симпатомиметической активностью и мембраностабилизирующими свойствами. Обладает гипотензивным, антиангинальным и антиаритмическим действием.

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

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

Острое антигипотензивное действие обусловлено уменьшением сердечного выброса, стабильный антигипертензивный эффект развивается в течение 2-3 недель и обусловлено снижением синтеза ренина, и накоплением ренина плазмы, угнетением активности ренин-ангиотензивной системы (имеет большое значение у больных с исходной гиперсекрецией ренина) и ЦНС восстановлением чувствительности барорецепторов дуги аорты (не происходит усиления их активности в ответ на снижение артериального давления) и, в итоге, уменьшением периферических симпатических влияний. Снижает повышенное АД в покое, при физическом напряжении и стрессе.

Антиангинальный эффект определяется снижением потребности миокарда в кислороде в результате уменьшения частоты сердечных сокращений (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. АД снижается через 15 мин, максимально - через 2 ч и продолжается в течение 6 ч, диастолическое АД изменяется медленнее: стабильное снижение наблюдается после нескольких недель регулярного приема.

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 AV-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, урежает частоту сердечных сокращений, 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-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

Метопролол быстро и почти полностью (95%) всасывается в ЖКТ. C_{max} в плазме крови достигается через 1-2 ч после приема внутрь. $T_{1/2}$ в среднем составляет 3.5 ч (в пределах от 1 ч до 9 ч).

Биодоступность составляет 50% при первом приеме и возрастает до 70% при повторном применении. Прием пищи повышает биодоступность на 20-40%. Биодоступность метопролола увеличивается при циррозе печени. Связь с белками плазмы в среднем 10%.

Препарат проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры. Выделяется в грудное молоко в незначительных количествах.

Метаболизируется в печени. Метаболиты не обладают фармакологической активностью. Около 5% препарата выводится в неизменном виде почками. Лечение больных со сниженной функцией почек не требует коррекции дозы препарата. Нарушение функции печени замедляет метаболизм препарата, и в случаях недостаточности функции печени, доза препарата должна быть снижена. Не удаляется при гемодиализе.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия (в качестве монотерапии или в комбинации с другими антигипертензивными средствами), в том числе гиперкинетический тип, тахикардия;

— ишемическая болезнь сердца: 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
- Ишемическая болезнь сердца
- Мигрень
- Миокардит
- Стенокардия
- Тахикардия
- Экстрасистолия

Противопоказания:

— кардиогенный шок;

— AV-блокада II-III степени;

— синоатриальная (SA) блокада;

— синдром слабости синусового узла;

— выраженная брадикардия;

— сердечная недостаточность в стадии 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);

— одновременный прием ингибиторов МАО или одновременное в/в введение верапамила;

— период лактации;

— возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

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

С *осторожностью* - сахарный диабет, метаболический ацидоз, бронхиальная астма, хроническая обструктивная болезнь легких (эмфизема легких, хронический обструктивный бронхит), облитерирующие заболевания периферических сосудов (перемежающаяся хромота, синдром Рейно), хроническая печеночная и/или почечная недостаточность, миастения, феохромоцитома, AV-блокада I степени, тиреотоксикоз, депрессия (в т.ч. в анамнезе), псориаз, беременность, пожилой возраст.

Способ применения и дозы:

Таблетки принимают внутрь с едой или сразу после еды, не разжевывая и запивая жидкостью.

Артериальная гипертензия

Начальная суточная доза составляет 50-100 мг в 1-2 приема (утром и вечером). При недостаточном терапевтическом эффекте суточная доза может быть постепенно повышена до 100-200 мг и/или дополнительное назначение других антигипертензивных средств. Максимальная суточная доза 200 мг.

Стенокардия, аритмии, профилактика приступов мигрени - 100-200 мг/сут в 2 приема (утром и вечером).

Вторичная профилактика инфаркта миокарда - 200 мг/сут 2 приема (утром и вечером).

Функциональные нарушения сердечной деятельности, сопровождающиеся тахикардией - 100 мг/сут в 2 приема (утром и вечером).

У **пожилых больных, при нарушениях функции почек, а также при необходимости проведения гемодиализа** дозу не изменяют.

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

Побочное действие:

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

Со стороны 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, кардиалгия.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, боль в животе, сухость во рту, диарея, запор, нарушение функции печени, изменение вкуса.

Со стороны кожных покровов: 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: гипогликемия (у больных, получающих инсулин), редко: гипергликемия (у больных сахарным диабетом), гипотиреоз.

Лабораторные показатели: редко - тромбоцитопения (необычные кровотечения и кровоизлияния), агранулоцитоз, лейкопения, повышение активности печеночных ферментов; крайне редко - гипербилирубинемия.

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

Прочие: боль в спине или суставах, как и все бета-адреноблокаторы в единичных случаях может вызывать незначительное увеличение массы тела, снижение либидо и/или потенции.

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, антриовентрикулярная блокада (вплоть до развития полной поперечной блокады и остановки сердца), кардиалгия.

Первые признаки передозировки проявляются через 20 мин - 2 час 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, с интервалом в 2-5 мин, бета-адреностимуляторы - до достижения желаемого эффекта или в/в 0.5-2 мг атропина сульфата.

При отсутствии положительного эффекта - допамин, добутамин или норэпинефрин (норадреналин).

В качестве последующих мер, возможно, назначение 1-10 мг глюкагона, постановка трансвенозного интракардиального электростимулятора. При бронхоспазме следует ввести в/в стимуляторы бета$_2$-адренорецепторов. Метопролол плохо выводится с помощью гемодиализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности назначают по строгим показаниям с учетом соотношения польза/риск (в связи с развитием у плода брадикардии, артериальной гипотензии, гипогликемии). При этом проводят тщательное наблюдение, особенно за развитием плода. Необходимо строгое наблюдение за новорожденными в течение 48-72 ч после родоразрешения.

Влияние метопролола на новорожденного, при кормлении грудью не изучено, поэтому женщинам, принимающим метопролол, следует прекратить кормление грудью.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Не рекомендуется одновременное применение с ингибиторами МАО вследствие значительного усиления гипотензивного действия. Перерыв в лечении 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.

Средства для ингаляционного наркоза (производные углеводородов) повышают риск угнетения функции миокарда и развития артериальной гипотензии.

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

Три- и тетрациклические антидепрессанты, антипсихотические лекарственные средства (нейролептики), седативные и снотворные лекарственные средства усиливают угнетение ЦНС.

Отмечается усиление угнетающего действия на ЦНС - с этанолом; суммация кардиодепрессивного эффекта - с наркозными средствами; увеличение риска нарушений периферического кровообращения - с алкалоидами спорыньи.

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

При сочетании с гипотензивными средствами, диуретиками, нитроглицерином или блокаторами медленных кальциевых каналов может развиться резкое снижение АД) особая осторожность необходима при сочетании с празозином); увеличение выраженности урежения ЧСС и угнетение AV-проводимости - при применении метопролола с верапамилом, дилтиаземом, антиаритмическими средствами (амиодароном), резерпином, альфа-метил допой, клонидином, гуанфацином, средствами для общей анестезии и сердечными гликозидами.

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 (циметидин, пероральные контрацептивы, фенотиазины) повышают концентрацию метопролола в плазме.

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.

Снижает клиренс ксантина (кроме дифиллина), особенно с исходно повышенным клиренсом теофиллина под влиянием курения.

Снижает клиренс лидокаина, повышает концентрацию лидокаина в плазме крови.

Усиливает и пролонгирует действие антидеполяризующих миорелаксантов; удлиняет антикоагулянтный эффект кумаринов.

При совместном применении с этанолом увеличивается риск выраженного снижения АД.

Особые указания и меры предосторожности:

Контроль за больными, принимающими бета-адреноблокаторы, включает регулярное наблюдение за ЧСС и АД, содержанием глюкозы крови у больных сахарным диабетом. При необходимости, для больных сахарным диабетом, дозу инсулина или гипогликемических средств, назначаемых внутрь, 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).

Может усилить симптомы нарушения периферического артериального кровообращения. Отмену препарата проводят постепенно, сокращая дозу в течение 10 дней.

При резком прекращении лечения может возникнуть синдром отмены (усиление приступов стенокардии, повышения 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 может маскировать тахикардию, вызванную гипогликемией. В отличие от несселективных бета-адреноблокаторов практически не усиливает вызванную инсулином гликемию и не задерживает восстановление концентрации глюкозы крови до нормального уровня.

При необходимости назначения пациентам с бронхиальной астмой, в качестве сопутствующей терапии используют бета$_2$-адреностимуляторы; при феохромоцитоме - альфа-адреноблокаторами.

При необходимости проведения хирургического вмешательства необходимо предупредить анестезиолога о проводимой терапии (выбор средства для общей анестезии с минимальным отрицательным инотропным действием), отмены 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 артериального давления 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 артериальное давление ниже 100 мм рт. ст.), AV-блокады, бронхоспазм, 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.

Из-за отсутствия достаточного количества клинических данных препарат не рекомендуется применять у детей.

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 определение безопасности дозы осуществляется индивидуально.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* - хроническая почечная недостаточность.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* - хроническая печеночная недостаточность.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* - пожилой возраст.

Применение в детском возрасте

Противопоказан:

— возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

Хранить в в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте, при температуре от 15° до 25°С.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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