Метопролол-Акри



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 белого с сероватым или желтоватым оттенком цвета, плоскоцилиндрические, с фаской.

	1 таб.
метопролол	50 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, крахмал картофельный, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат, повидон, натрия крахмала гликолат.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Метопролол относится к кардиоселективным блокаторам бета-адренорецепторов, не обладающим внутренней симпатомиметической активностью и мембраностабилизирующими свойствами. Обладает гипотензивным, антиангинальным и антиаритмическим действием. Блокируя в невысоких дозах бета$_1$-адренорецепторы сердца, уменьшает стимулированное катехоламинами образование цАМФ из 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 сопротивление в начале применения бета-адреноблокаторов (в первые 24 ч после приема внутрь) - увеличивается (в результате реципрокного возрастания активности альфа-адренорецепторов и устранения стимуляции бета$_2$-адренорецепторов), которое через 1-3 дня возвращается к исходному, а при длительном применении - снижается.

Гипотензивное действие обусловлено рефлекторным уменьшением сердечного выброса и синтеза ренина,

угнетением активности ренин-ангиотензин-альдостероновой системы (имеет большее значение у больных с исходной гиперсекрецией ренина) и центральной нервной системы, 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. Гипотензивный эффект развивается быстро (систолическое АД снижается через 15 мин, максимально - через 2 часа) и продолжается в течение 6 часов, диастолическое АД изменяется медленнее: стабильное снижение наблюдается после нескольких недель регулярного приема.

Антиангинальный эффект определяется снижением потребности миокарда в кислороде в результате урежения ЧСС (удлинения диастолы и улучшения перфузии миокарда) и сократимости, а также снижением чувствительности миокарда к воздействию симпатической иннервации. Уменьшает число и тяжесть приступов стенокардии и повышает толерантность к физической нагрузке.

Антиаритмический эффект обусловлен устранением аритмогенных факторов (тахикардии, повышенной активности симпатической нервной системы, увеличенного содержания цАМФ, артериальной гипертензии), уменьшением скорости спонтанного возбуждения синусового 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 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 бета$_2$-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 бета-адренорецепторов.

Фармакокинетика

Абсорбция при приеме внутрь полная (95%). C_{max} в плазме крови достигается через 1-2 часа после приема внутрь. $T_{1/2}$ в среднем составляет 3.5 ч (в пределах от 1 до 9 ч). Подвергается интенсивному пресистемному метаболизму, 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 крови - 10%. Проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры. Проникает в грудное молоко в незначительных количествах.

Метаболизируется в печени, 2 метаболита обладают бета-адреноблокирующей активностью. В метаболизме препарата принимает участие изофермент CYP2D6. Около 5% выводится в неизмененном 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);

— 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;

— атриовентрикулярная блокада (AV) II-III степени;

— синоатриальная (SA) блокада;

— синдром слабости синусового узла;

— выраженная брадикардия;

— хроническая 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);

— период лактации;

— одновременный прием ингибиторов МАО или одновременное внутривенное введение верапамила;

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

— непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция.

— 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 (при одновременном применении альфа-адреноблокаторов), AV блокада I степени, тиреотоксикоз, депрессия (в т.ч. и в анамнезе), псориаз, беременность, пожилой возраст.

Способ применения и дозы:

Таблетки принимают внутрь во время или сразу после приема пищи, не разжевывают, запивают небольшим количеством жидкости.

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 увеличена до 100-200 мг и/или дополнительное назначение других антигипертензивных средств. Максимальная суточная доза 200 мг.

Стенокардия, аритмии, профилактика приступов мигрени

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

Вторичная профилактика инфаркта миокарда

200 мг в сутки в два приема (утром и вечером).

Гипертиреоз

По 50 мг 2 раза в сутки (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:

Со стороны центральной 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 артериального давления, 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.

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 инсулинзависимым сахарным диабетом).

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 артериального давления, аритмия, желудочковая экстрасистолия, бронхоспазм, обморок, при острой передозировке - кардиогенный шок, потеря сознания, кома, атриовентрикулярная блокада (вплоть до развития полной поперечной блокады и остановки сердца), кардиалгия.

Первые признаки передозировки проявляются через 20 мин-2 часа после приема препарата.

Лечение: промывание желудка и прием адсорбирующих средств; симптоматическая терапия: при выраженном снижении артериального давления - больной должен находиться в положении Тренделенбурга; в случае чрезмерного снижения артериального давления, брадикардии и сердечной недостаточности - в/в, с интервалом в 2-5 мин, бета-адреномиметики - 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, введение 1-10 мг глюкагона, установка трансвенозного интракардиального электростимулятора. При бронхоспазме следует ввести в/в бета$_2$-адреномиметики. Метопролол плохо выводится с помощью гемодиализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Во время беременности назначают с учетом соотношения пользы для матери и риска для плода (в связи с развитием у плода брадикардии, артериальной гипотензии, гипогликемии). При этом проводят тщательное наблюдение, особенно за развитием плода. Необходимо наблюдение за новорожденными в течение 48-72 ч после родоразрешения.

Влияние метопролола на новорожденного при кормлении грудью не изучено, поэтому женщинам, принимающим Метопролол-Акри , 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 артериального давления.

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

Бета-адреномиметики, теофиллин, кокаин, эстрогены (задержка натрия), индометацин и другие нестероидные противовоспалительные препараты (задержка натрия и блокирование синтеза простагландина почками) ослабляют гипотензивный эффект.

Отмечается усиление угнетающего действия на центральную нервную систему - с этанолом; суммация кардиодепрессивного эффекта - со средствами для наркоза; 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 артериального давления).

При сочетании с гипотензивными средствами, диуретиками, нитроглицерином или блокаторами "медленных" кальциевых каналов может развиться резкое снижение артериального давления (особая осторожность необходима при сочетании с празозином); увеличение выраженности урежения частоты сердечных сокращений и угнетение атриовентрикулярной проводимости - при применении метопролола с верапамилом, дилтиаземом, антиаритмическими средствами (амиодароном), резерпином, метилдопой, 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 его концентрации 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 ан-тикоагулянтный 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 артериальным давлением, содержанием глюкозы в 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 в сутки 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 артериального давления).

Особое внимание при отмене препарата необходимо уделять больным стенокардией. При стенокардии напряжения подобранная доза препарата должна обеспечивать частоту сердечных сокращений 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 неселективных бета-адреноблокаторов практически не усиливает вызванную инсулином гипогликемию и не задерживает восстановление концентрации глюкозы в крови до нормального уровня.

При необходимости назначения пациентам с бронхиальной астмой, в качестве сопутствующей терапии используют бета$_2$-адреномиметики; 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), 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.), атриовентрикулярной 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.

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 при хронической почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

С осторожностью при хронической печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью пожилым пациентам.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 18 лет.

Условия хранения:

Список Б. В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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