Метопролол-Obl



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]

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Кардиоселективный бета$_1$-адреноблокатор без внутренней симпатомиметической активности. Оказывает гипотензивное, антиангинальное и антиаритмическое действие. Понижает автоматизм синусового узла, уменьшает ЧСС, замедляет AV-проводимость, снижает сократимость и возбудимость миокарда, уменьшает минутный объем сердца, снижает потребность миокарда в кислороде. Подавляет стимулирующее влияние катехоламинов на сердце при физической и психоэмоциональной нагрузке.

Вызывает гипотензивный эффект, который стабилизируется к концу 2-й недели курсового применения. При стенокардии напряжения метопролол снижает частоту и тяжесть приступов. Нормализует сердечный ритм при наджелудочковой тахикардии и мерцании предсердий. При инфаркте миокарда способствует ограничению зоны ишемии сердечной мышцы и уменьшает риск развития фатальных аритмий, снижает возможность возникновения рецидивов инфаркта миокарда. При применении в средних терапевтических дозах оказывает менее выраженное влияние на гладкую мускулатуру бронхов и периферических артерий, чем неселективные бета-адреноблокаторы.

Фармакокинетика

После приема внутрь метопролол быстро и почти полностью всасывается из ЖКТ, C_{max} активного вещества в плазме крови достигается через 1-2 ч. Интенсивно метаболизируется в печени с образованием неактивных метаболитов.

$T_{1/2}$ метопролола из плазмы составляет 3-4 ч и во время курса лечения не изменяется. Более 95% принятой дозы выделяется почками, из них только 3% - в неизмененном виде.

Показания к применению:

Артериальная гипертензия, профилактика приступов стенокардии, нарушения ритма сердца (наджелудочковая тахикардия, экстрасистолия), вторичная профилактика после перенесенного инфаркта миокарда, гиперкинетический кардиальный синдром (в т.ч. при гипертиреозе, НЦД). Профилактика приступов мигрени.

Относится к болезням:

- Гипертензия
- Кардит
- Мигрень
- Миокардит
- Стенокардия
- Тахикардия
- Экстрасистолия

Противопоказания:

AV-блокада II и III степени, синоатриальная блокада, брадикардия (ЧСС менее 50 ударов/мин), СССУ, артериальная гипотензия, хроническая сердечная недостаточность IIБ-III стадии, острая сердечная недостаточность, кардиогенный шок, метаболический ацидоз, выраженные нарушения периферического кровообращения, повышенная чувствительность к метопрололу.

Способ применения и дозы:

При приеме внутрь средняя доза составляет 100 мг/сут в 1-2 приема. При необходимости суточную дозу постепенно увеличивают до 200 мг. При в/в введении разовая доза - 2-5 мг; при отсутствии эффекта повторное введение возможно через 5 мин.

Максимальные дозы: при приеме внутрь суточная доза - 400 мг, при в/в введении разовая доза - 15-20 мг.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: возможны брадикардия, артериальная гипотензия, нарушения AV-проводимости, появление симптомов сердечной недостаточности.

Со стороны пищеварительной системы: в начале терапии возможны сухость во рту, тошнота, рвота, диарея, запор; в отдельных случаях - нарушения функции печени.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: в начале терапии возможны слабость, утомляемость, головокружение, головная боль, мышечные судороги, ощущение холода и парестезии в конечностях; возможны уменьшение секреции слезной жидкости, конъюнктивит, ринит, депрессия, нарушения сна, кошмарные сновидения.

Со стороны системы кроветворения: в отдельных случаях - тромбоцитопения.

Со стороны эндокринной системы: гипогликемические состояния у больных с сахарным диабетом.

Со стороны дыхательной системы: у предрасположенных пациентов возможно появление симптомов бронхиальной обструкции.

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение при беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Метопролол проникает через плацентарный барьер. В связи с возможным развитием у новорожденного брадикардии, артериальной гипотензии, гипогликемии и остановки дыхания метопролол необходимо отменить за 48-72 ч до планируемого срока родоразрешения. После родоразрешения необходимо обеспечить строгий контроль за состоянием новорожденного в течение 48-72 ч.

Метопролол в незначительных количествах выделяется с грудным молоком. Применение в период лактации не рекомендуется.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с антигипертензивными средствами, диуретиками, антиаритмическими средствами, нитратами, возникает риск развития выраженной артериальной гипотензии, брадикардии, AV-блокады.

При одновременном применении с барбитуратами ускоряется метаболизм метопролола, что приводит к уменьшению его эффективности.

При одновременном применении с гипогликемическими средствами возможно усиление действия гипогликемических средств.

При одновременном применении с НПВС возможно уменьшение гипотензивного действия метопролола.

При одновременном применении с опиоидными анальгетиками взаимно усиливается кардиодепрессивный эффект.

При одновременном применении с периферическими миорелаксантами возможно усиление нервно-мышечной блокады.

При одновременном применении со средствами для ингаляционного наркоза повышается риск угнетения функции миокарда и развития артериальной гипотензии.

При одновременном применении с пероральными контрацептивами, гидралазином, ранитидином, циметидином повышается концентрация метопролола в плазме крови.

При одновременном применении с амиодароном возможны артериальная гипотензия, брадикардия, фибрилляция желудочков, асистолия.

При одновременном применении с верапамилом повышается C_{max} в плазме крови и AUC метопролола. Снижается минутный и ударный объем сердца, частота пульса, артериальная гипотензия. Возможно развитие сердечной недостаточности, диспноэ и блокады синусового узла.

При в/в введении верапамила на фоне приема метопролола существует угроза остановки сердца.

При одновременном применении возможно усиление брадикардии, вызванной гликозидами наперстянки.

При одновременном применении с декстропропоксифеном повышается биодоступность метопролола.

При одновременном применении с диазепамом возможно снижение клиренса и увеличение AUC диазепама, что может привести к усилению его эффектов и уменьшению скорости психомоторных реакций.

При одновременном применении с дилтиаземом повышается концентрация метопролола в плазме крови вследствие ингибирования его метаболизма под влиянием дилтиазема. Аддитивно угнетается влияние на деятельность сердца в связи с замедлением проведения импульса через AV-узел, вызываемым дилтиаземом. Возникает риск развития выраженной брадикардии, значительного уменьшения ударного и минутного объема.

При одновременном применении с лидокаином возможно нарушение выведения лидокаина.

При одновременном применении с мибефрадилом у пациентов с низкой активностью изофермента CYP2D6 возможно повышение концентрации метопролола в плазме крови и увеличение риска развития токсических эффектов.

При одновременном применении с норэпинефрином, эпинефрином, другими адрено- и симпатомиметиками (в т.ч. в форме глазных капель или в составе противокашлевых средств) возможно некоторое повышение АД.

При одновременном применении с пропафеноном повышается концентрация метопролола в плазме крови и развивается токсическое действие. Полагают, что пропафенон ингибирует метаболизм метопролола в печени, уменьшая его клиренс и повышая сывороточные концентрации.

При одновременном применении с резерпином, гуанфацином, метилдопой, клонидином возможно развитие выраженной брадикардии.

При одновременном применении с рифампицином уменьшается концентрация метопролола в плазме крови.

Метопролол может вызвать небольшое уменьшение клиренса теофиллина у курящих пациентов.

Флуоксетин ингибирует изофермент CYP2D6, это приводит к угнетению метаболизма метопролола и его кумуляции, что может усиливать кардиодепрессивное действие и вызывать брадикардию. Описан случай развития летаргии.

Флуоксетин и главным образом его метаболиты характеризуются длительным $T_{1/2}$, поэтому вероятность лекарственного взаимодействия сохраняется даже через несколько дней после отмены флуоксетина.

Имеются сообщения об уменьшении клиренса метопролола из организма при одновременном применении с ципрофлоксацином.

При одновременном применении с эрготамином возможно усиление нарушений периферического кровообращения.

При одновременном применении с эстрогенами уменьшается антигипертензивное действие метопролола.

При одновременном применении метопролол повышает концентрацию этанола в крови и удлиняет его выведение.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют у пациентов с хроническими обструктивными заболеваниями дыхательных путей, сахарным диабетом (особенно при лабильном течении), болезнью Рейно и облитерирующими заболеваниями периферических артерий, феохромоцитомой (следует применять в сочетании с альфа-адреноблокаторами), выраженными нарушениями функции почек и печени.

На фоне лечения метопрололом возможно уменьшение продукции слезной жидкости, что имеет значение для пациентов, пользующихся контактными линзами.

Завершение продолжительного курса лечения метопрололом следует проводить постепенно (минимум в течение 10 дней) под наблюдением врача.

Не рекомендуется одновременное применение метопролола с ингибиторами МАО.

При комбинированной терапии с клонидином прием последнего следует прекращать через несколько дней после отмены метопролола, во избежание гипертонического криза. При одновременном применении с гипогликемическими средствами требуется коррекция их режима дозирования.

За несколько дней перед проведением наркоза необходимо прекратить прием метопролола или подобрать средство для наркоза с минимальным отрицательным инотропным действием.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

У пациентов, деятельность которых требует повышенного внимания, вопрос о применении метопролола амбулаторно следует решать только после оценки индивидуальной реакции пациента.

При нарушениях функции почек

С осторожностью применяют у пациентов с выраженными нарушениями функции почек.

При нарушениях функции печени

С осторожностью применяют у пациентов с выраженными нарушениями функции печени.

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