Метопролол Органика



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 или белого с желтоватым оттенком цвета плоскоцилиндрической формы с фаской.

	1 таб.
метопролола тартрат	25 мг

Вспомогательные вещества: кальция гидрофосфата дигидрат 20 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (примогель) 8.9 мг, целлюлоза микрокристаллическая 34 мг, повидон K90 (пласдон K90) 1.2 мг.

магния стеарата моногидрат 0.9 мг

20 шт. - банки (1) светозащитного стекла - пачки картонные.
30 шт. - банки (1) светозащитного стекла - пачки картонные.
50 шт. - банки (1) светозащитного стекла - пачки картонные.
60 шт. - банки (1) светозащитного стекла - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (5) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (6) - пачки картонные.
20 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
30 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
50 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
60 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.

Таблетки белого или белого с желтоватым оттенком цвета плоскоцилиндрической формы с фаской.

	1 таб.
метопролола тартрат	50 мг

Вспомогательные вещества: кальция гидрофосфата дигидрат 40 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (примогель) 17.8 мг, целлюлоза микрокристаллическая 68 мг, повидон K90 (пласдон K90) 2.4 мг.

магния стеарата моногидрат 1.8 мг

20 шт. - банки (1) светозащитного стекла - пачки картонные.
30 шт. - банки (1) светозащитного стекла - пачки картонные.
50 шт. - банки (1) светозащитного стекла - пачки картонные.
60 шт. - банки (1) светозащитного стекла - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (5) - пачки картонные.

10 шт. - упаковки контурные ячейковые (6) - пачки картонные.
20 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
30 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
50 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
60 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Метопролол Органика относится к кардиоселективным блокаторам β_1-адренорецепторов, не обладающих внутренней симпатомиметической активностью и мембраностабилизирующими свойствами. Обладает антигипертензивным, антиангинальным и антиаритмическим действием.ОПСС в начале применения бета-адреноблокаторов (в первые 24 ч после приема внутрь) – увеличивается (в результате реципрокного возрастания активности альфа-адренорецепторов и устранения стимуляции β_2-адренорецепторов), которое через 1-3 дня возвращается к исходному, а при длительном назначении – снижается.

Антигипертензивное действие обусловлено уменьшением сердечного выброса и синтеза ренина в почках, угнетением активности ренин-ангиотензин-альдостероновой системы (имеет большее значение у больных с исходной гиперсекрецией ренина) иЦНС, 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.

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. 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 отличии 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

После приема препарата внутрь практически полностью (приблизительно 95%) абсорбируется из ЖКТ. C_{max} в плазме крови достигается через 1.5-2 ч. Биодоступность увеличивается при приеме пищи на 20-40% и возрастает в ходе курсового лечения. Связывание с белками плазмы - 10%. Проникает через ГЭБ и плацентарный барьер, выделяется с грудным молоком. Интенсивно биотрансформируется в печени с образованием метаболитов, два метаболита Метопролола Органика обладают бета-адреноблокирующей активностью. В метаболизме Метопролола Органика участвует изофермент CYP2D6. $T_{1/2}$ из плазмы составляет около 3.5 ч. Общая скорость выведения из плазмы (клиренс) составляет приблизительно 1 л/мин. Выводится в основном почками (95%), около 3% - в неизмененном виде, остальное - в виде метаболитов. При нарушении функции почек снижается выведение метаболитов и практически не меняется выведение неизмененного Метопролола Органика.

При циррозе печени биодоступность Метопролола Органика увеличивается.

У пациентов пожилого возраста не наблюдается значительного изменения в фармакокинетике Метопролола Органика по сравнению с пациентами молодого возраста.

Нарушение функции почек не требует снижения дозы препарата, а при нарушений функции печени доза препарата должна быть снижена.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия (в монотерапии или в комбинации с другими гипотензивными средствами);

— функциональные нарушения сердечной деятельности, сопровождающиеся тахикардией;

— 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
- Гипотензия
- Желудочковая экстрасистолия
- Инфаркт миокарда
- Мигрень
- Миокардит
- Стенокардия
- Тахикардия
- Экстрасистолия

Противопоказания:

— кардиогенный шок;

— AV-блокада II-III степени (без искусственного водителя ритма);

— синоатриальная блокада;

— синдром слабости синусового узла;

— тяжелая брадикардия (ЧСС менее 50 уд./мин);

— хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;

— стенокардия Принцметала;

— острый инфаркт миокарда (ЧСС менее 45 уд./мин, интервал PQ более 0.25 сек, систолическое АД менее 100 мм рт.ст.);

— период лактации;

— одновременный прием ингибиторов МАО;

— одновременное в/в введение блокаторов медленных кальциевых каналов типа верапамила, дилтиазема;

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

— феохромоцитома (без одновременного использования альфа-адреноблокаторов);

— тяжелые нарушения периферического кровообращения;

— тяжелые формы бронхиальной астмы и хронической обструктивной болезни легких;

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

Способ применения и дозы:

Таблетки принимают внутрь одновременно с приемом пищи или сразу после еды, таблетки можно делить пополам, но не разжевывать и запивать 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 увеличена до 100-200 мг и/или дополнительно назначены другие антигипертензивные средства. Максимальная суточная доза - 200 мг.

Вторичная профилактика инфаркта миокарда

200 мг/сут в два приема (утром и вечером).

Стенокардия, аритмии, профилактика приступов мигрени

100-200 мг/сутки в 2 приема (утром и вечером).

Функциональные нарушения сердечной деятельности, сопровождающиеся тахикардией

100 мг/сут в 2 приема (утром и вечером)

При гипертиреозе

150-200 мг/сут в 3-4 приема.

У **пожилых больных, при нарушениях функции почек (КК менее 40 мл/мин), а также при необходимости проведения гемодиализа,** дозу не изменяют.

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

Побочное действие:

Ниже перечисленные побочные эффекты классифицировали следующим образом: часто (≥1%, но <10%), нечасто (≥0.1%, но <1%), редко (≥0.01%, но <0.1%), очень редко (<0.01%).

Со стороны нервной системы: часто - слабость, головокружение и головная боль; нечасто - снижение концентрации внимания, сонливость/бессонница, ночные кошмары, депрессия, мышечные судороги, парестезии в конечностях (у больных с перемежающейся хромотой и синдромом Рейно); редко - нервозность, тревога, тремор, судороги, депрессия, снижение внимания; очень редко - вялость, повышенная утомляемость, беспокойство, спутанность сознания или кратковременная потеря памяти, галлюцинации, астения, миастения.

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

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - синусовая брадикардия, сердцебиение, снижение АД, ортостатическая гипотензия (головокружение, иногда потеря сознания), похолодание нижних конечностей; нечасто - сердечная недостаточность, AV-блокада, отечный синдром, боль в груди; редко - снижение сократимости миокарда, аритмии, проявление ангиоспазма (усиление нарушения периферического кровообращения), нарушение проводимости миокарда, кардиалгия; очень редко - усугубление ранее существовавших нарушений AV-проводимости.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, боль в животе, запор или диарея; нечасто - рвота; редко - сухость слизистой оболочки полости рта, в отдельных случаях - нарушение функции печени (темная моча, желтушность склер или кожи, холестаз), нарушение вкусовых ощущений.

Со стороны кожных покровов: нечасто - сыпь, дистрофические изменения кожи; редко - обратимая алопеция; очень редко - фотосенсибилизация, обострение псориаза, зуд, эритема, крапивница, гипергидроз.

Со стороны дыхательной системы: часто - одышка; нечасто - бронхоспазм; редко - вазомоторный ринит, диспноэ.

Со стороны эндокринной системы: редко - гипергликемия (у больных сахарным диабетом 2 типа), гипогликемия (сахарный диабет 1 типа), гипотиреоз.

Аллергические реакции: очень редко - крапивница, кожный зуд, сыпь.

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

Влияние на плод: очень редко - внутриутробная задержка роста, гипогликемия, брадикардия.

Прочие: нечасто - боль в спине или суставах, увеличение или уменьшение массы тела, снижение либидо и/или потенции, при резком прекращении лечения - синдром отмены (усиление приступов стенокардии, повышение АД), ринит, артрит, болезнь Пейрони.

Передозировка:

Симптомы: выраженная синусовая брадикардия, головокружение, AV-блокада (вплоть до развития полной поперечной блокады и остановки сердца), выраженное снижение АД, обморок, аритмия/желудочковая экстрасистолия, острая сердечная недостаточность; кардиогенный шок, остановка сердца, бронхоспазм, потеря сознания, кома, тошнота, рвота, цианоз, гипогликемия, судороги. Первые признаки передозировки проявляются через 20 мин -2ч после приема препарата.

Лечение: промывание желудка и назначение адсорбирующих лекарственных 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 2-5 мин бета-адреностимуляторов - до достижения желаемого эффекта или в/в введение 0.5-2 мг атропина сульфата. При отсутствии положительного эффекта — допамин, добутамин или норэпинефрин. В качестве последующих мер возможна постановка трансвенозногоинтракардиального электростимулятора. При бронхоспазме следует ввести в/в бета-адреномиметики. При судорогах - медленное в/в введение диазепама. Гемодиализ неэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Во время беременности назначают с учетом тщательного взвешивания соотношения польза/риск, особенно, в ранние сроки беременности (в связи с возможным развитием у новорожденного брадикардии, гипотензии, гипогликемии и паралича дыхания). Лечение необходимо прерывать за 48-72 ч до родов. В тех случаях, когда это невозможно, необходимо обеспечивать строгое наблюдение за новорожденным в течение 48-72 ч после родоразрешения.

Если прием препарата Метопролол Органика необходим в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении:

- антиаритмических препаратов (хининоподобные средства и амиодарон) возможно усиление инотропного и дромотропного эффектов;

- блокаторов кальциевых каналов (верапамил, дилтиазем, нифедипин) или другими антиаритмиками происходит снижение мшгутного и ударного объема сердца, ЧСС, причем при в/в введении верапамила существует угроза остановки
сердца;

- барбитуратов ускоряется метаболизм Метопролола Органика, что приводит к уменьшению его эффективности;

- индукторов или ингибиторов микросомальных ферментов возможно изменение концентрации Метопролола Органика в плазме - понижение при приеме рифампицина, - повышение при приеме циметидина, этанола, гидралазина, ингибиторов обратного захвата серотонина (пароксетина, флуоксетина, сертралина), пероральных противозачаточных средств;

- индометацина и других НПВП, ингибиторов ЦОГ возможно снижение антигипертензивногодействия;

- блокаторов кальциевых каналов, сердечных гликозидов, резерпина, нитратов повышается риск развития артериальной гипотензии, брадикардии, AV-блокады, отрицательного инотропного действия;

- инсулина и пероральных противодиабетических средств повышение риска развития гипогликемии;

- наркотических средств, ингаляционных анестетиков и некоторых других препаратов, влияющих на ЦНС, в частности снотворных препаратов (бромазепам, лоразепам), транквилизаторов (хлордиазепоксид, триметоцин, тофизопам), три- и тетрациклических антидепрессантов взаимное потенцирование кардиодепрессивного эффекта;

- аллергенов, используемых для иммунотерапии, или экстрактов аллергенов для кожных проб повышается риск развития тяжелых системных реакций и анафилаксии;

- йодсодержащих рентгеноконтрастных лекарственных средств для в/в введения повышают риск развития анафилактических реакций;

- норэпинефрина, эпинефрина и других симпатомиметиков повышается риск развития артериальной гипертензии;

- фенилпропаноламина в высоких дозах - парадоксальное повышение АД (вплоть до гипертонического криза);

- клонидина - риск выраженного повышения АД при резкой отмене клонидина на фоне одновременного приема Метопролола Органика, поэтому в случае отмены клонидина, постепенное прекращение приема Метопролола Органика необходимо начинать за несколько дней до его отмены;

- симпатомиметических средств, ганглиоблокаторов, других блокаторов β-адренорецепторов (например, глазные капли), ингибиторов МАО типа В необходим тщательный мониторинг состояния пациента;

- диазепама возможно снижение клиренса и увеличение AUC диазепама, что может привести к усилению его эффектов и уменьшению скорости психомоторных реакций;

- лидокаина возможно нарушение выведения лидокаина;

- флуоксетина приводит к угнетению метаболизма Метопролола Органика и его кумуляции, что может усиливать

кардиодепрессивное действие и вызывать брадикардию, вероятность лекарственного взаимодействия сохраняется даже через несколько дней после отмены;

- флуоксетина. Описан случай развития летаргии;

- ципрофлоксацина - уменьшение клиренса Метопролола Органика из организма;

- эрготамина возможно усиление нарушений периферического кровообращения;

- эстрогенов уменьшается антигипертензивное действие Метопролола Органика;

- мибефрадила у пациентов с низкой активностью изофермента CYP2D6 возможно повышение концентрации Метопролола Органика в плазме крови и увеличение риска развития токсических эффектов.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью: сахарньй диабет, метаболический ацидоз, бронхиальная астма, хроническая обструктивная болезнь легких, энфизема, хронический обструктивный бронхит, нарушения функции печени, почек (клиренс креатинина менее 40 мл/мин), миастения, феохромоцитома (при одновременном применении альфа-адреноблокаторов), тиреотоксикоз, депрессия (в т.ч. анамнезе), псориаз, нарушения периферического кровообращения (перемежающаяся хромота, синдром Рейно), беременность, детский возраст (эффективность безопасность не определены), пожилой возраст, отягощенный аллергологический анамнез, AV-блокада I степени.

Контроль за больными, принимающими бета-адреноблокаторы, включает наблюдение за ЧСС и . АД (в начале приема - ежедневно, затем - 1 раз в 3-4 мес), концентрацией глюкозы в крови у больных сахарным диабетом (1 раз в 4-5 мес). Следует обучить больного методике подсчета ЧСС и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при ЧСС менее 50/мин.

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

У пожилых пациентов рекомендуется осуществлять контроль функции почек (1 раз в 4-5 мес).

Может усилить симптомы нарушения периферического артериального кровообращения.

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

У курильщиков эффективность бета-адреноблокаторов ниже.

Метопролол Органика может маскировать некоторые клинические проявления тиреотоксикоза (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 значения.

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

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

В случае появления нарастающей брадикардии (менее 50/мин), артериальной гипотензии (систолическое АД ниже 100 мм рт.ст.), AV-блокады, бронхоспазма, желудочковых аритмий, тяжелых нарушений функций печени и почек необходимо уменьшить дозу или прекратить лечение.

Рекомендуется прекращать терапию при появлении кожных высыпаний и развитии депрессии, вызванной приемом бета-адреноблокаторов.

Отмену препарата проводят постепенно, сокращая дозу в течение 10 дней. При резком прекращении лечения может возникнуть синдром "отмены" (усиление приступов стенокардии, повышение, АД). Особое внимание при отмене препарата необходимо уделить больным стенокардией.

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

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

При нарушениях функции почек (КК менее 40 мл/мин), а также при необходимости проведения гемодиализа, дозу не изменяют.

При нарушениях функции печени

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

Применение в пожилом возрасте

У **пожилых больных, при нарушениях функции почек (КК менее 40 мл/мин), а также при необходимости проведения гемодиализа,** дозу не изменяют.

Применение в детском возрасте

Противопоказаан:

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

Условия хранения:

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

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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