

Метозок



Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)

[Госреестр](#) [Википедия](#)

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой желтовато-коричневого цвета, круглые, двояковыпуклые; на изломе - белого с сероватым или кремоватым оттенком цвета.

	1 таб.
метопролола сулцинат	23.83 мг,
что соответствует содержанию метопролола тартрата	25 мг

Вспомогательные вещества: гипромеллоза - 155.96 мг, лудипресс ЛЦЕ (лактозы моногидрат - 94.7-98.3%, повидон - 3-4%) - 117.21 мг, кремния диоксид коллоидный - 1.5 мг, магния стеарат - 1.5 мг.

Состав оболочки: готовая смесь "Опадрай II" оранжевого цвета (поливиниловый спирт - 6 мг, тальк - 2.22 мг, макрогол - 3.03 мг, титана диоксид - 3.36 мг, краситель железа оксид красный - 9 мкг, краситель железа оксид желтый - 378 мкг, краситель железа оксид черный - 3 мкг) - 15 мг.

30 шт. - флаконы пластиковые (1) - пачки картонные.

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

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой от светло-зеленого до зеленого цвета, круглые, двояковыпуклые; на изломе - белого с сероватым или кремоватым оттенком цвета.

	1 таб.
метопролола сулцинат	47.66 мг,
что соответствует содержанию метопролола тартрата	50 мг

Вспомогательные вещества: гипромеллоза - 161.29 мг, лудипресс ЛЦЕ (лактозы моногидрат - 94.7-98.3%, повидон - 3-4%) - 87.42 мг, кремния диоксид коллоидный - 1.5 мг, магния стеарат - 1.5 мг.

Состав оболочки: готовая смесь "Опадрай II" зеленого цвета (поливиниловый спирт - 6 мг, тальк - 2.22 мг, макрогол - 3.03 мг, титана диоксид - 2.925 мг, краситель хинолиновый желтый (алюминиевый лак) - 268 мкг, краситель железа оксид черный - 15 мкг, краситель индигокармин (алюминиевый лак) - 542 мкг) - 15 мг.

30 шт. - флаконы пластиковые (1) - пачки картонные.

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

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой желтовато-коричневого цвета, круглые, двояковыпуклые; на изломе - белого с сероватым или кремоватым оттенком цвета.

	1 таб.
метопролола сулцинат	95.32 мг,
что соответствует содержанию метопролола тартрата	100 мг

Вспомогательные вещества: гипромеллоза - 184.84 мг, лудипресс ЛЦЕ (лактозы моногидрат - 94.7-98.3%, повидон - 3-4%) - 412.84 мг, кремния диоксид коллоидный - 3.5 мг, магния стеарат - 3.5 мг.

Состав оболочки: готовая смесь "Опадрай II" оранжевого цвета (поливиниловый спирт - 14 мг, тальк - 5.18 мг, макрогол - 7.07 мг, титана диоксид - 7.84 мг, краситель железа оксид красный - 21 мкг, краситель железа оксид желтый - 882 мкг, краситель железа оксид черный - 7 мкг) - 35 мг.

30 шт. - флаконы пластиковые (1) - пачки картонные.
30 шт. - банки полипропиленовые (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Кардиоселективный бета₁-адреноблокатор. Не оказывает мембраностабилизирующего действия и не обладает внутренней симпатомиметической активностью. Обладает антигипертензивным, антиангинальным и антиаритмическим действием.

Блокируя в невысоких дозах β₁-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). ОПСС в начале применения бета-адреноблокаторов (в первые 24 ч после перорального приема) увеличивается (в результате реципрокного возрастания активности α-адренорецепторов и устранения стимуляции β₂-адренорецепторов), через 1-3 дня возвращается к исходному, а при длительном назначении снижается.

Антигипертензивное действие обусловлено уменьшением минутного объема кровотока и синтеза ренина, угнетением активности ренин-ангиотензин-альдостероновой системы (имеет большее значение у больных с исходной гиперсекрецией ренина) и ЦНС, 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. Антигипертензивный эффект длится более 24 ч.

Антиангинальный эффект определяется снижением потребности миокарда в кислороде в результате уменьшения ЧСС (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. За счет повышения конечного диастолического давления в левом желудочке и увеличения растяжения мышечных волокон желудочков может повышать потребность в кислороде, особенно у больных с хронической сердечной недостаточностью.

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-проведения (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 тиреотоксикозе урежает ЧСС или даже может привести к восстановлению синусового ритма.

Предупреждает развитие мигрени.

В отличие от неселективных бета-адреноблокаторов при назначении в средних терапевтических дозах оказывает менее выраженное влияние на органы, содержащие β₂-адренорецепторы (поджелудочная железа, скелетные мышцы, гладкая мускулатура периферических артерий, бронхов и матки) и на углеводный обмен; выраженность атерогенного действия не отличается от действия пропранолола. При многолетнем приеме снижает концентрацию холестерина в крови. При применении в больших дозах (более 100 мг/сут) оказывает блокирующий эффект на оба подтипа β-адренорецепторов.

Фармакокинетика

Всасывание

Абсорбция при приеме внутрь полная (95%). Растворимость в жирах умеренная. Подвергается интенсивному пресистемному метаболизму, биодоступность - 50% при первом приеме и возрастает до 70% при повторном применении. Время достижения C_{max} в плазме крови 6-12 ч после приема препарата. В ходе курсового лечения биодоступность возрастает. Прием пищи повышает биодоступность на 20-40%.

Распределение

Связывание с белками плазмы - 10%. Быстро распределяется в тканях, проникает через ГЭБ, плацентарный барьер. Проникает в грудное молоко.

Метаболизм

Метаболизируется в печени, 2 метаболита обладают бета-адреноблокирующей активностью. В метаболизме препарата принимает участие изофермент CYP2D6.

Выведение

$T_{1/2}$ - от 3.5 до 7 ч при приеме внутрь. Не удаляется при гемодиализе.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Значительное накопление метаболитов наблюдается у пациентов с КК 5 мл/мин, при этом бета-адреноблокирующая активность препарата не увеличивается.

Биодоступность увеличивается при циррозе печени, при этом сокращается его общий клиренс.

Показания к применению:

- артериальная гипертензия;
- хроническая сердечная недостаточность II-IV функционального класса по классификации NYHA в стадии компенсации (в составе комплексной терапии);
- ИБС: профилактика приступов стабильной стенокардии, снижение смертности и частоты повторного инфаркта миокарда после острой фазы инфаркта миокарда;
- нарушения ритма сердца, включая наджелудочковую тахикардию, снижение частоты сокращения желудочков при фибрилляции предсердий и желудочковых экстрасистолах;
- функциональные нарушения сердечной деятельности, сопровождающиеся тахикардией;
- профилактика приступов мигрени.

Относится к болезням:

- [Артериальная гипертензия](#)
- [Гипертензия](#)
- [Желудочковая экстрасистолия](#)
- [Мигрень](#)
- [Миокардит](#)
- [Сердечная недостаточность](#)
- [Стенокардия](#)
- [Тахикардия](#)
- [Фибрилляция предсердий](#)
- [Фиброз](#)
- [Экстрасистолия](#)

Противопоказания:

- кардиогенный шок;
- AV-блокада II-III степени;
- синоатриальная блокада;
- синдром слабости синусового узла;
- выраженная брадикардия (ЧСС менее 50 уд./мин);
- острая сердечная недостаточность или хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;
- артериальная гипотензия (систолическое АД менее 100 мм рт.ст.);
- острый инфаркт миокарда (ЧСС менее 45 уд/мин, интервал PQ более 0.24 с, систолическое АД менее 100 мм рт.ст.);
- тяжелая бронхиальная астма;
- тяжелые нарушения периферического кровообращения;
- одновременный прием ингибиторов MAO или одновременное в/в введение верапамила;
- феохромоцитомы (без одновременного приема альфа-адреноблокаторов);
- возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

- период лактации;
- дефицит лактазы, непереносимость лактозы, синдром мальабсорбции глюкозы/галактозы;
- повышенная чувствительность к метопрололу и другим бета-адреноблокаторам.

С *осторожностью* следует назначать препарат при сахарном диабете, АВ-блокаде I степени, стенокардии Принцметала, метаболическом ацидозе, бронхиальной астме, хронической обструктивной болезни легких, почечной и/или тяжелой печеночной недостаточности, миастении, феохромоцитоме (при одновременном приеме альфа-адреноблокаторов), тиреотоксикозе, депрессии (в т.ч. в анамнезе), псориазе, нарушениях периферического кровообращения (перемежающаяся хромота, синдром Рейно), беременности, а также пациентам пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

Препарат Метозок предназначен для приема внутрь 1 раз/сут, таблетки рекомендуется принимать утром, не разжевывая, запивая водой. Метозок можно принимать независимо от приема пищи. С целью предотвращения брадикардии дозу подбирают индивидуально и увеличивают постепенно.

При *артериальной гипертензии и стенокардии* начальная доза - 50 мг 1 раз/сут, при недостаточном терапевтическом эффекте суточная доза может быть увеличена до 100-200 мг/сут. При артериальной гипертензии при неэффективности препарата в дозе 100-200 мг/сут можно добавить другое гипотензивное средство.

При *хронической сердечной недостаточности II функционального класса по классификации NYHA* (без обострений последние 6 недель и без изменения в комплексной терапии в течение последних 2 недель) рекомендуемая начальная доза - 25 мг 1 раз/сут. Через 2 недели суточную дозу можно повысить до 50 мг, затем через 2 недели - до 100 мг, еще через 2 недели - до 200 мг.

При *хронической сердечной недостаточности III-IV функционального класса по классификации NYHA* рекомендуемая начальная доза - первые 2 недели 12.5 мг 1 раз/сут. Возможно применение метопролола в другой лекарственной форме, например, таблетки по 25 мг с риской. В период увеличения дозы пациент должен находиться под наблюдением, т.к. у некоторых пациентов симптомы сердечной недостаточности могут ухудшиться.

Через 1-2 недели доза может быть увеличена до 25 мг 1 раз/сут. Затем через 2 недели доза может быть увеличена до 50 мг 1 раз/сут. Пациентам, которые хорошо переносят препарат, можно удваивать дозу каждые 2 недели до достижения максимальной дозы 200 мг 1 раз/сут.

При *вторичной профилактике инфаркта миокарда и нарушений сердечного ритма* начальная доза составляет 100 мг 1 раз/сут.

При *функциональных нарушениях сердечной деятельности, сопровождающихся тахикардией*, назначают по 50 мг/сут, при необходимости дозу можно увеличить до 200 мг/сут.

Для *профилактики приступов мигрени* назначают по 100-200 мг 1 раз/сут.

Пожилым пациентам, пациентам с почечной недостаточностью или пациентам, находящимся на гемодиализе, коррекции дозы не требуется.

Нарушения функции печени влияют на выведение метопролола, поэтому может потребоваться коррекция дозы в зависимости от клинического состояния.

Побочное действие:

Частота побочных эффектов: очень часто (>1/10), часто (> 1/100 и < 1/10), нечасто (> 1/1000 и < 1/100), редко (> 1/10 000 и < 1/1000), очень редко (< 1/10 000, включая отдельные сообщения).

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, АВ-блокада I степени; редко - нарушения проводимости миокарда, аритмия; очень редко - гангрена (у пациентов с нарушениями периферического кровообращения).

Со стороны ЦНС: очень часто - повышенная утомляемость, снижение скорости психических и двигательных реакций; часто - головокружение, головная боль; нечасто - парестезии, судороги, депрессия, снижение концентрации внимания, сонливость, бессонница, кошмарные сновидения; редко - астения, тремор, повышенная нервная возбудимость, тревога; очень редко - амнезия/нарушение памяти, подавленность, галлюцинации, миастения.

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

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

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

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

Со стороны лабораторных показателей: очень редко - тромбоцитопения (необычные кровотечения и кровоизлияния), агранулоцитоз, лейкопения, повышение активности печеночных ферментов, гипербилирубинемия.

Со стороны эндокринной системы: часто - гипогликемия (у больных сахарным диабетом 1 типа), редко - гипергликемия (у больных сахарным диабетом 2 типа), гипотиреозное состояние.

Прочие: нечасто - увеличение массы тела; редко - импотенция/сексуальная дисфункция; очень редко - артралгия, тромбоцитопения.

Передозировка:

Симптомы: выраженная брадикардия, АВ-блокада (вплоть до развития полной поперечной блокады и остановки сердца), выраженное снижение АД, нарушение периферического кровообращения, усиление симптомов сердечной недостаточности, кардиогенный шок, угнетение дыхания, апноэ, цианоз, повышенная утомляемость, головокружение, потеря сознания, кома, тремор, судороги, повышение потоотделения, парестезии, бронхоспазм, тошнота, рвота, возможно развитие эзофагоспазма, гипогликемия или гипергликемия, гиперкалиемия, переходящая миастения. Первые признаки передозировки проявляются через 20 мин-2 ч после приема препарата.

Лечение: если препарат принят недавно - промывание желудка и прием адсорбирующих средств; при нарушении AV-проводимости и/или брадикардии - в/в введение 1-2 мг атропина, эпинефрина (адреналина) или постановка временного кардиостимулятора; при снижении АД - пациент должен находиться в положении Тренделенбурга. Если нет признаков отека легких - в/в плазмозамещающие растворы, при неэффективности - введение эпинефрина, допамина, добутамина; при острой сердечной недостаточности - сердечные гликозиды, диуретики; при судорогах - в/в диазепам; при бронхоспазме - ингаляционно или парентерально бета₂-адреномиметики.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности препарат Метозок должен применяться только по строгим показаниям, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода/ребенка (в связи с возможным развитием у новорожденного брадикардии, снижения АД, гипогликемии и паралича дыхания). При этом проводят тщательное наблюдение особенно за развитием плода. Лечение прекращают за 48-72 ч до наступления родов. Если это невозможно, то новорожденный должен находиться под особенно тщательным наблюдением в течение 48-72 ч после родов.

Применение препарата Метозок противопоказано в период лактации. В случае необходимости применения препарата в период лактации грудное вскармливание необходимо прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Средства, снижающие запасы катехоламинов, (например, резерпин, ингибиторы MAO) при одновременном применении с метопрололом могут усилить гипотензивное действие или вызвать выраженную брадикардию. Перерыв в лечении между приемом ингибиторов MAO и метопролола должен составлять не менее 14 дней.

Метопролол является субстратом изофермента CYP2D6. Лекарственные средства, которые ингибируют или индуцируют активность изофермента CYP2D6, могут влиять на плазменную концентрацию метопролола.

Ингибиторы изофермента CYP2D6 (некоторые антидепрессанты и нейролептики, хинидин, тербинафин, целекоксиб, пропafenон, дифенгидрамин, гидроксихлорин, циметидин) повышают концентрацию метопролола в плазме крови.

Индукторы изофермента CYP2D6 (производные барбитуровой кислоты, рифампицин) снижают концентрацию метопролола в плазме крови.

Одновременный прием метопролола с сердечными гликозидами, клонидином, блокаторами медленных кальциевых каналов (верапамил, дилтиазем), амиодароном, антиаритмическими средствами I класса, средствами для общей анестезии, метилдопой, гуанфацином может привести к снижению АД и выраженной брадикардии.

Средства для ингаляционного наркоза (производные углеводов) при одновременном применении с метопрололом повышают риск угнетения функции миокарда и развития артериальной гипотензии.

Одновременное в/в введение верапамила может спровоцировать остановку сердца.

НПВП и бета-адреномиметики ослабляют антигипертензивный эффект бета-адреноблокаторов.

Алкалоиды спорыньи при одновременном применении с метопрололом повышают риск нарушений периферического кровообращения.

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

Метопролол снижает клиренс ксантинов (кроме диафиллина), особенно у больных с исходно повышенным клиренсом теофиллина под влиянием курения.

Метопролол снижает клиренс лидокаина, повышает концентрацию лидокаина в плазме.

Метопролол усиливает и пролонгирует действие недеполяризующих миорелаксантов; удлиняет антикоагулянтный эффект кумаринов.

При одновременном приеме эпинефрина (адреналина) с бета-адреноблокаторами возможно повышение АД и брадикардия.

Фенилпропаноламин (норэфедрин) при одновременном применении с метопрололом может повышать диастолическое АД.

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 средства для в/в введения при совместном применении с метопрололом повышают риск развития анафилактических реакций.

При совместном применении метопролола с этанолом увеличивается риск выраженного снижения АД.

Особые указания и меры предосторожности:

Контроль больных, принимающих бета-адреноблокаторы, включает регулярное наблюдение за ЧСС и АД. Следует обучить больного методике подсчета ЧСС и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при ЧСС менее 50 уд./мин.

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

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

Прием препарата Метозок 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 курящих пациентов эффективность бета-адреноблокаторов ниже.

Метозок может маскировать некоторые клинические проявления тиреотоксикоза (например, тахикардию). Резкая отмена препарата у больных с тиреотоксикозом противопоказана, поскольку способна усилить симптоматику.

При сахарном диабете прием препарата Метозок может маскировать тахикардию, вызванную гипогликемией.

При необходимости назначения пациентам с бронхиальной астмой в качестве сопутствующей терапии используют бета₂-адреномиметики; при феохромоцитоме - альфа-адреноблокаторы.

При необходимости проведения хирургического вмешательства необходимо предупредить врача-анестезиолога о приеме препарата Метозок (необходим выбор средства для общей анестезии с минимальным отрицательным инотропным действием), отмена препарата не рекомендуется.

Реципрокную активацию блуждающего нерва можно устранить в/в введением атропина (1-2 мг).

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

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

Метозок

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

При резкой отмене клонидина может резко повышаться АД, при одновременном приеме бета-адреноблокаторов. В случае отмены клонидина, прекращение приема бета-адреноблокаторов следует начинать за несколько дней до отмены клонидина.

Препараты, снижающие запасы катехоламинов (например, резерпин), могут усилить действие бета-адреноблокаторов, поэтому пациенты, принимающие такие сочетания препаратов, должны находиться под постоянным медицинским наблюдением на предмет выявления чрезмерного снижения АД или брадикардии.

При резком прекращении лечения может возникнуть синдром отмены (усиление приступов стенокардии, повышение АД). Особое внимание при отмене препарата необходимо уделять больным стенокардией, хронической сердечной недостаточностью, после перенесенного инфаркта миокарда. Отмену препарата Метозок проводят постепенно, сокращая дозу в течение 10 дней.

Пациенты, 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 занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Пациентам с почечной недостаточностью коррекции дозы не требуется.

При нарушениях функции печени

Нарушения функции печени влияют на выведение метопролола, поэтому может потребоваться коррекция дозы в зависимости от клинического состояния.

Применение в пожилом возрасте

Пожилым пациентам коррекции дозы не требуется.

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

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Metozok>