Вазокардин Ретард



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки пролонгированного действия круглые, плоские, от белого до белого с желтоватым оттенком цвета, с фаской и риской на одной из сторон; допускается наличие мраморности.

	1 таб.
метопролола тартрат	200 мг

Вспомогательные вещества: глицерола трибегенат, кальция гидрофосфата дигидрат, поливидон 25, кремния диоксид коллоидный безводный, масло хлопковое гидрогенизированное, натрия стеарила фумарат.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (10) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Относительно кардиоселективный бета$_1$-адреноблокатор. Не оказывает мембраностабилизирующего действия и не обладает внутренней симпатомиметической активностью. Обладает гипотензивным, антиангинальным и антиаритмическим действием.

Блокируя в невысоких дозах β_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).

ОПСС в начале применения бета-адреноблокаторов (в первые 24 ч после приема внутрь) увеличивается (в результате реципрокного возрастания активности α-адренорецепторов и устранения стимуляции β_1-адренорецептров), которое через 1-3 дня возвращается к исходному, а при длительном применении снижается.

Гипотензивное действие обусловлено уменьшением МОК и синтеза ренина, угнетением активности ренин-ангиотензиновой 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.

Гипотензивный эффект развивается быстро (систолическое 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.

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 АД 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.

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; выраженность атерогенного действия не отличается от действия пропранолола. При многолетнем приеме снижает концентрацию холестерина крови. При применении в больших дозах (более 100 мг/сут) оказывает блокирующий эффект на оба подтипа бета-адренорецепторов.

Фармакокинетика

Абсорбция при приеме внутрь составляет 95%. Подвергается интенсивному пресистемному метаболизму. Биодоступность - 50% при первом приеме и возрастает до 70% при повторном применении. Связь с белками плазмы крови - около 10%.

C_{max} в плазме крови достигается через 6-12 ч после приема внутрь. Прием пищи повышает биодоступность на 20-40%. Замедленное высвобождение активного вещества из таблеток пролонгированного действия обеспечивает равномерное постепенное поступление его в ток крови и распределение в тканях и более длительный эффект, позволяющий удлинить интервал между приемом отдельных доз. $T_{1/2}$ - 3-7 ч.

Метаболизируется в печени. Свыше 95% принятой внутрь дозы выделяется почками, 3-10% - в неизменном виде.

Быстро распределяется в тканях, проникает через гематоэнцефалический барьер, плацентарный барьер и выделяется с грудным молоком.

Биодоступность увеличивается при циррозе печени.

Показания к применению:

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

— ИБС: вторичная профилактика после перенесенного инфаркта миокарда, профилактика приступов стенокардии; гиперкинетический кардиальный синдром;

— нарушения ритма сердца: синусовая тахикардия, наджелудочковые и желудочковые аритмии;

— хроническая сердечная недостаточность (компенсированная) в комбинации с диуретиками, ингибиторами АПФ и сердечными гликозидами;

— профилактика приступов мигрени;

— гипертиреоз (комплексная терапия).

Относится к болезням:

- Аритмия
- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Кардит
- Мигрень
- Миокардит
- Сердечная недостаточность
- Синусит
- Синусовая тахикардия

- Стенокардия
- Тахикардия

Противопоказания:

— синоатриальная и AV-блокада II-III степени;

— СССУ;

— стенокардия Принцметала;

— острая сердечная недостаточность;

— выраженная брадикардия;

— кардиогенный шок;

— артериальная гипотензия (в случае применения при вторичной профилактике инфаркта миокарда, систолическое АД менее 100 мм рт.ст.)

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

— период лактации;

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

— повышенная чувствительность к препарату и другим бета-адреноблокаторам;

С *осторожностью* следует применять препарат при сахарном диабете, тиреотоксикозе, ХОБЛ (хронической обструктивной болезни легких) и бронхиальной астме, облитерирующих заболеваниях периферических сосудов (перемежающаяся хромота), синдроме Рейно, метаболическом ацидозе, недостаточности функции печени, хронической почечной недостаточности, миастении, феохромоцитоме, псориазе, беременности, пожилом возрасте, AV-блокаде I степени.

Способ применения и дозы:

Принимать препарат следует внутрь в одно и тоже время, желательно после приема пищи, с небольшим количеством жидкости, не разжевывая. Таблетки можно делить пополам. Доза препарата подбираются индивидуально.

Максимальная суточная доза - 400 мг.

При артериальной гипертензии

1 таб. пролонгированного действия 200 мг утром.

Если после применения этой дозы не достигается положительный терапевтический эффект, Вазокардин Ретард можно применить совместно с другими антигипертензивными средствами или с диуретиками.

Стенокардия

На начальном этапе терапии 1 таб. пролонгированного действия 200 мг/сут. В случае необходимости дозу можно увеличить до 400 мг (2 таб. по 200 мг). Улучшение переносимости нагрузки и снижение числа болевых приступов проявляется обычно после дозы 200 мг.

У больных **пожилого возраста** в принципе нет необходимости коррекции дозировки. Однако следует соблюдать осторожность в период лечения Вазокардином Ретард пожилых лиц, у которых резкое снижение АД и ЧСС отрицательно влияет на функцию жизненно важных органов.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: синусовая брадикардия, выраженное снижение АД, ортостатическая гипотензия (головокружение, иногда - потеря сознания); редко - снижение сократимости миокарда, развитие или усугубление хронической сердечной недостаточности, нарушения ритма сердца, проявление ангиоспазма (усиление нарушения периферического кровообращения, похолодание нижних конечностей, синдром Рейно), нарушение проводимости миокарда, кардиалгия; очень редко - усугубление ранее существовавших нарушений AV-проводимости.

Со стороны ЦНС и периферической 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), тремор, судороги, депрессия, беспокойство, снижение внимания,

сонливость, бессонница, кошмарные сновидения, спутанность сознания или кратковременная потеря памяти, галлюцинации, астения, миастения.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, сухость во рту, запор или диарея; в отдельных случаях — нарушение функции печени.

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

Со стороны кожных покровов: высыпания на коже (обострение псориаза), псориазоподобные кожные реакции, гиперемия кожи; редко - фотодерматоз, усиление потоотделения, обратимая алопеция.

Со стороны дыхательной системы: одышка, иногда - бронхоспазм (при назначении в высоких дозах); редко - заложенность носа.

Со стороны эндокринной системы: гипергликемия (у больных инсулиннезависимым сахарным диабетом), гипогликемия (у больных, получающих инсулин), гипотиреоидные состояния.

Аллергические реакции: крапивница, кожный зуд, сыпь.

Лабораторные показатели: в отдельных случаях - тромбоцитопения, повышение активности печеночных ферментов.

Прочие: увеличение массы тела, редко - снижение либидо и/или потенции, артралгия.

При резком прекращении лечения — синдром отмены (усиление приступов стенокардии, повышение АД).

Передозировка:

Симптомы: выраженная тяжелая синусовая брадикардия, головокружение, AV-блокада (вплоть до развития полной поперечной блокады и остановки сердца), снижение АД, обморочные состояния, нарушения ритма сердца, сердечная недостаточность, кардиогенный шок, остановка сердца, бронхоспазм, потеря сознания, кома, тошнота, рвота, цианоз.

Первые признаки передозировки проявляются через 20 мин-2 ч 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 развития сердечной недостаточности — в/в введение бета-адреностимуляторов с интервалом в 2-5 мин до достижения желаемого эффекта или в/в введения 0,5-2 мг атропина сульфата. При отсутствии положительного эффекта — допамин, добутамин или норэпинефрин. В качестве последующих мер, возможно, назначение 1-10 мг глюкагона, постановка трансвенозного интракардиального электростимулятора. При бронхоспазме следует ввести в/в стимуляторы бета$_2$-адренорецепторов. При судорогах - медленное в/в введение диазепама. Гемодиализ не эффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Во время беременности назначают только по строгим показаниям (в связи с возможным развитием у новорожденного брадикардии, артериальной гипотензии, гипогликемии и паралича дыхания). Лечение необходимо прерывать за 48-72 ч до родов. В тех случаях, когда это невозможно, необходимо обеспечить строгое наблюдение за новорожденным в течение 48-72 ч после родоразрешения.

Противопоказание - период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Аллергены, используемые для иммунотерапии, или экстракты аллергенов для кожных проб повышают риск возникновения тяжелых системных аллергических реакций или анафилаксии у больных, получающих метопролол.

Йодсодержащие рентгеноконтрастные лекарственные вещества для в/в введения повышают риск развития анафилактических реакций.

Фенитоин при в/в введении, лекарственные средства для общей анестезии (производные углеводородов) повышают выраженность кардиодепрессивного действия и вероятность снижения АД.

Метопролол изменяет эффективность инсулина и пероральных гипогликемических препаратов, маскирует симптомы развивающейся гипогликемии (тахикардию, повышение АД).

Снижает клиренс лидокаина и ксантинов (кроме дифиллина) и повышает их концентрацию в плазме, особенно у больных с исходно повышенным клиренсом теофиллина под влиянием курения.

Гипотензивный эффект метопролола ослабляют НПВС (задержка натрия и блокада синтеза простагландинов почками), ГКС и эстрогены (задержка натрия).

Сердечные гликозиды, метилдопа, резерпин и гуанфацин, блокаторы медленных кальциевых каналов (верапамил, дилтиазем), амиодарон и другие антиаритмические лекарственные средства повышают риск развития или усугубления брадикардии, AV-блокады, остановки сердца и сердечной недостаточности. Нифедипин может приводить к значительному снижению АД.

Диуретики, клонидин, симпатолитики, гидралазин и другие гипотензивные средства могут привести к чрезмерному снижению АД.

Метопролол удлиняет действие недеполяризующих миорелаксантов и антикоагулянтный эффект кумаринов.

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

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. Негидрированные алкалоиды спорыньи повышают риск развития нарушений периферического кровообращения.

Особые указания и меры предосторожности:

Контроль за больными, принимающими бета-адреноблокаторы, включает наблюдение за ЧСС и АД (в начале приема - ежедневно, затем 1 раз в 3-4 месяца), 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 уд./мин.

Недопустимо внезапное прекращение приема бета-адреноблокаторов (по возможности лечение метопрололом следует прекращать постепенно, сокращая дозу в течение 10 дней, при этом пациент должен находиться под постоянным наблюдением врача).

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

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

Метопролол может усиливать симптомы нарушения периферического артериального кровообращения.

При артериальной гипертензии эффект наступает через 2-5 дней от начала приема метопролола, стабильное действие отмечается через 1-2 месяца.

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

У курильщиков эффективность бета-адреноблокаторов ниже.

При комбинации терапии с клонидином прием последнего следует прекращать через несколько дней после отмены метопролола, во избежание гипертонического криза.

Метопролол может маскировать некоторые клинические проявления тиреотоксикоза (например, тахикардию).

При сахарном диабете препарат может маскировать тахикардию, вызванную гипогликемией. В отличие от неселективных бета-адреноблокаторов, метопролол практически не усиливает вызванную инсулином гипогликемию и не задерживает восстановление концентрации глюкозы в крови до нормального уровня.

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

При необходимости проведения хирургического вмешательства необходимо предупредить анестезиолога о проводимой терапии (выбор лекарственного средства для общей анестезии с минимальным отрицательным инотропным действием), отмена препарата не рекомендуется.

Рециркокную активацию n.vagus можно устранить в/в введением атропина (1-2 мг).

В случае появления у больных пожилого возраста нарастающей брадикардии (менее 50 уд./мин), артериальной гипотензии (систолическое АД ниже 100 мм рт.ст.), AV-блокады, бронхоспазма, желудочковой аритмии, тяжелых нарушений функции печени, почек, необходимо уменьшить дозу препарата или прекратить лечение.

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

Отмену терапии метопрололом 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 связи с тем, что наблюдаются индивидуальные различия в реакции на прием метопролола, вопрос о возможности занятий потенциально опасными видами деятельности, требующих повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций, следует решать после оценки индивидуальной реакции пациента на препарат.

При нарушениях функции почек

С *осторожностью* следует применять препарат при хронической почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

С *осторожностью* следует применять препарат при недостаточности функции печени.

Применение в пожилом возрасте

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

Применение в детском возрасте

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

Условия хранения:

Список Б. Хранить при температуре 15-25°С в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте.

Не применять по истечению срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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