

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
МЕТОПРОЛОЛ
(METOPROLOL)

Склад:

діюча речовина: metoprolol;

1 таблетка містить метопрололу тар трату, у перерахуванні на 100 % речовину - 25 мг або 50 мг, або 100 мг;

допоміжні речовини: лактози моногідрат, целюлоза мікрокристалічна, кросповідон, повідон, тальк, кальцію стеарат.

Лікарська форма. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Блокатори α -адренорецепторів. Селективні блокатори β -адренорецепторів. Код АТС С07А В02.

Клінічні характеристики.**Показання.**

- Артеріальна гіпертензія;
- стенокардія (в т.ч. постінфарктна);
- аритмії (в т.ч. суправентрикулярна тахіаритмія);
- підтримуюче лікування після перенесеного інфаркту міокарда;
- у складі комплексної терапії при тиреотоксикозі;
- профілактика нападів мігрені.

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до метопрололу, інших β -блокаторів або інших інгредієнтів препарату;
- бронхіальна астма або бронхоспазм в анамнезі;
- атріовентрикулярна блокада II-III ступеня;
- гостра або хронічна (IV функціональний клас по NYHA) серцева недостатність;
- клінічно значуща синусова брадикардія;
- синдром слабкості синусового вузла;
- тяжке порушення периферичного кровообігу;
- кардіогенний шок;
- артеріальна гіпотензія;
- феохромоцитома;
- метаболічний ацидоз;
- тяжка недостатність функції печінки;
- дитячий вік.

Метопролол не слід призначати пацієнтам з підозрою на гострий інфаркт міокарда при частоті серцевих скорочень менше 45 уд/хв., інтервалом P-Q>0,24 с або систолічним артеріальним тиском <100 мм рт.ст.

Спосіб застосування та дози. Дозу Метопрололу встановлюють індивідуально, проте добова доза не повинна перевищувати 400 мг. Таблетки приймають внутрішньо з невеликою кількістю рідини, не розжовуючи, після їжі. Курс лікування Метопрололом залежить від особливостей перебігу захворювання і може становити 3 роки.

Артеріальна гіпертензія: початкова добова доза Метопрололу складає 100 мг одноразово або розподілена на 2 прийоми. Залежно від реакції організму добову дозу можна поступово щотижня

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

збільшувати до 200 мг. Для посилення антигіпертензивного ефекту можливе застосування Метопрололу з іншими гіпотензивними засобами.

Стенокардія: по 50-100 мг 2-3 рази на добу.

Аритмії: по 50 мг 2-3 рази на добу. При необхідності добова доза може бути збільшена до 300 мг, розподілена на 2-3 прийоми.

Гіпертиреоз (тиреотоксикоз): по 50 мг 4 рази на добу. При досягненні очікуваного ефекту доза повинна поступово зменшуватись.

Інфаркт міокарда.

Раннє лікування больового синдрому після інфаркту міокарда: по 50 мг кожні 6 годин протягом 48 годин. Лікування бажано починати протягом перших 12 годин після появи болю в грудях.

Підтримуюча терапія: рекомендована добова доза – 200 мг, розподілена на 2 прийоми. Курс лікування – не менше 3 місяців.

Профілактика мігрені: добова доза – 100-200 мг, розподілена на 2 прийоми вранці і ввечері.

Вікові фізіологічні зміни лише трохи впливають на фармакокінетику Метопрололу, і необхідність корекції режиму дозування у людей літнього віку відсутня. Проте рекомендується бути обережними, призначаючи Метопролол пацієнтам геріатричної групи.

Потрібна корекція режиму дозування у пацієнтів з порушенням функції печінки.

Корекції дози у пацієнтів з нирковою недостатністю не потрібна.

Побічні реакції. При застосуванні Метопрололу іноді можливі:

– з боку серцево-судинної системи: брадикардія, артеріальна гіпотензія, ортостатична гіпотензія (інколи з втратою свідомості); рідко – поява/посилення ознак серцевої недостатності (особливо при підвищенні дози препарату), аритмія, прискорене серцебиття, набряки, синдром Рейно; дуже рідко – порушення AV-провідності, біль в ділянці серця, гангрена (у пацієнтів з тяжким порушенням периферичного кровообігу);

– з боку органів дихання: задишка при навантаженні; рідко – бронхоспазм; дуже рідко – риніт;

– з боку центральної та периферичної нервової системи: запаморочення, головний біль; рідко – порушення концентрації уваги, депресія, нічні кошмари, безсоння або сонливість, парестезії; дуже рідко – галюцинації, зміна особистості, підвищена збудливість, сплутаність свідомості;

– з боку органів чуття: рідко – зниження зору, зменшення секреції слізної рідини, сухість та подразнення слизової оболонки очей, кон'юнктивіт, шум у вухах, зниження слуху;

– з боку травного тракту: нудота, блювання, біль у животі; рідко – діарея, запор; дуже рідко – сухість у роті; в окремих випадках – ретроперитонеальний фіброз (однак не встановлено чіткого причинно-наслідкового зв'язку між даною реакцією та прийомом Метопрололу);

– з боку системи кровотворення: рідко – тромбоцитопенія, лейкопенія;

– алергічні реакції: рідко – шкірний висип (в т.ч. уртикарний, псоріазоподібний, дистрофія підшкірної жирової клітковини), свербіж, кропив'янка; дуже рідко – фотосенсибілізація, посилення потовиділення, оборотна алопеція, загострення псоріазу;

– лабораторні показники: підвищення активності «печінкових» ферментів, гіпербілірубінемія, збільшення рівня тригліцеридів в крові, зменшення рівня ліпопротеїнів високої щільності (HDL);

– інші: слабкість, стомлюваність (частіше на початку лікування), гепатит, неспецифічний біль в м'язах, суглобах, судоми; дуже рідко – артрит, збільшення маси тіла, порушення лібідо, імпотенція; в окремих випадках – хвороба Пейроні (проте не встановлено чіткого причинно-наслідкового зв'язку між даною реакцією і прийомом Метопрололу).

Передозування. *Симптоми*: тяжка гіпотензія, брадикардія, атріовентрикулярна блокада, серцева недостатність, кардіогенний шок, зупинка серця, бронхоспазм, порушення свідомості або кома, судоми, нудота, блювання, ціаноз, гіпоглікемія, гіперкаліємія.

Лікування. При передозуванні слід промити шлунок або спровокувати блювання, прийняти активоване вугілля. Слід звернутися до лікаря. При розвитку тяжкої гіпотензії, брадикардії або загрози серцевої недостатності необхідно призначити адреноміметик, ввести внутрішньовенно 1-2 мг

атропіну сульфату. Якщо і після цього немає необхідного поліпшення, можливе призначення пресорних засобів. У випадку тяжких форм гіпотензії, брадикардії або загрози серцевої недостатності слід вводити β_1 -агоніст (наприклад, преналтерол). У разі відсутності селективного β_1 -агоніста можна вводити симпатоміметичні агенти внутрішньовенно (наприклад, норадреналін, дофамін, добутамін). Можна ввести глюкагон. Може виникнути необхідність застосування водія серцевого ритму. Для купірування бронхоспазму слід вводити внутрішньовенно β_2 -агоніст.

Застосування в період вагітності або годування груддю. Застосування препарату під час вагітності можливо тільки за наявності життєвих показань і за умови, що очікувана користь для жінки перевищує потенційний ризик для плоду (у зв'язку з можливим розвитком у плода/новонародженого брадикардії, гіпотензії, гіпоглікемії). Цей факт необхідно взяти до уваги, призначаючи препарат під час останнього триместру. Застосування препарату слід припинити як мінімум за 2-3 дні до пологів.

Метопролол виділяється в грудне молоко. Проте при його застосуванні жінками, що годують груддю, в терапевтичних дозах негативний вплив на немовля маловірогідний.

При призначенні Метопрололу вагітним і жінкам, що годують груддю, необхідно підібрати мінімальну ефективну дозу.

Діти. Застосування Метопрололу у дитячому віці протипоказане.

Особливості застосування. З особливою обережністю Метопролол застосовують хворим на цукровий діабет. У пацієнтів, які приймають інсулін і таблетовані гіпоглікемічні препарати, Метопролол може маскувати симптоми гіпоглікемії. Метопролол може впливати на рівень глюкози, печінкових ферментів.

При проведенні курсу лікування феохромоцитоми можливе призначення Метопрололу тільки в комплексі з α -адреноблокатором.

Перед проведенням хірургічних втручань необхідно проінформувати анестезіолога про прийом Метопрололу (потрібний вибір ЛЗ для загальної анестезії з мінімальною негативною інотропною дією), відміна препарату не рекомендується. Реципрокную активізацію n.vagus можна усунути внутрішньовенним введенням атропіну.

Рекомендується припинити терапію при появі шкірних висипів і розвитку депресії. Пацієнти під час відміни препарату повинні знаходитися під ретельним спостереженням лікаря. Відміну препарату проводять поступово, скорочуючи дозу протягом 10 днів до 25 мг. При різкому припиненні лікування може виникнути синдром «відміни» (посилення нападів стенокардії, підвищення АТ). Особливу увагу при відміні препарату необхідно приділити хворим на стенокардію.

Пацієнти, які користуються контактними лінзами, повинні враховувати можливість зменшення продукції слізної рідини на фоні лікування Метопрололом.

При необхідності призначення Метопрололу пацієнтам з бронхіальною астмою в якості супутньої терапії використовують β_2 -адреностимулятори.

З обережністю Метопролол застосовують у хворих з алергічними захворюваннями, міастенією, депресією, вазоспастичною стенокардією, хронічними захворюваннями бронхолегеневої системи, псоріазом, при тривалому голодуванні, хворобі Рейно.

Пацієнти літнього віку можуть виявляти підвищену чутливість навіть за умови звичайного дозування.

Метопролол може маскувати деякі клінічні прояви тиреотоксикозу (наприклад, тахікардію). Різка відміна препарату у хворих з тиреотоксикозом протипоказана, оскільки здатна посилити симптоматику.

Метопролол може посилити симптоми порушення периферичного артеріального кровообігу і посилити брадикардію. При частоті серцевих скорочень менше 50-55 уд/хв необхідно зменшити дозу препарату або провести поступову відміну препарату.

Можливе посилення вираженості алергічних реакцій (на фоні обтяженого алергологічного анамнезу) і відсутність ефекту від введення звичайних доз адреналіну.

З особливою обережністю слід призначати Метопролол пацієнтам зі стенокардією Принцметала.

Не рекомендується одночасне застосування Метопрололу з інгібіторами моноамінооксидази (МАО). Перерва в лікуванні між прийомом інгібіторів МАО і Метопрололу повинна становити не менше 14 днів.

Контроль за пацієнтами, які приймають β-адреноблокатори, в т.ч. і Метопролол, включає спостереження за ЧСС і АТ (на початку прийому - щодня, потім 1 раз на 3-4 місяці), концентрацією глюкози в крові у хворих на діабет (1 раз на 4-5 місяців). Слід навчити хворого методиці підрахунку ЧСС і проінструктувати про необхідність лікарської консультації при ЧСС менше 50 уд/хв. У немолодих пацієнтів рекомендується здійснювати контроль функції нирок (1 раз на 4-5 місяців).

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами. В період лікування необхідно бути обережним при керуванні автотранспортом або роботі з іншими потенційно небезпечними механізмами, що потребує підвищеної концентрації уваги і швидкості психомоторних реакцій.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. При одночасному прийомі Метопрололу з інсуліном або пероральними цукрознижувальними засобами може посилюватися або подовжуватися їх дія. При цьому симптоми гіпоглікемії (особливо тахікардія і тремор) можуть маскуватися або зникати. У таких випадках необхідно проводити регулярний контроль рівня глюкози в крові.

При одночасному застосуванні Метопрололу і барбітуратів, фенотіазинів, нітрогліцерину, діуретиків, вазодилаторів та інших гіпотензивних засобів (наприклад, празозину), пероральних протизаплідних засобів – може посилюватися гіпотензивний ефект.

При одночасному прийомі Метопрололу з препаратами, що інгібують фермент CYP2D6, можливе пригнічення метаболізму Метопрололу, підвищення його концентрації в плазмі крові і збільшення ризику розвитку токсичних ефектів. До таких препаратів відносяться: антидепресанти (флуоксетин, пароксетин, бупропіон), антипсихотичні (тіорідазин), антиретровірусні (ритонавір), антигістамінні (дифенгідрамін), антималярійні (гідроксихлорохін, гуїнідин), антифунгальні (тербінафін), ранітидин, циметидин.

Серцеві глікозиди, метилдопа, резерпін і гуанфацин, блокатори повільних кальцієвих каналів (верапаміл, дилтіазем), аміодарон, пропafenон та інші антиаритмічні ЛЗ підвищують ризик розвитку або посилення брадикардії, АВ-блокади, зупинки серця і серцевої недостатності. При застосуванні Метопрололу протипоказане внутрішньовенне введення препаратів класу верапамілу (загроза зупинки серця); при застосуванні Метопрололу і пероральних форм препаратів класу верапамілу необхідно бути особливо обережним.

При сумісному лікуванні клонідином і Метопрололом лікування останнім повинно бути припинене за декілька днів до відміни клонідину для запобігання гіпертонічному кризу.

Потрібен ретельний контроль за пацієнтами при одночасному прийомі Метопрололу з гангліоблокаторами, іншими β-блокаторами (наприклад, очні краплі) або інгібіторами МАО.

При одночасному застосуванні з норепінефрином, епінефрином, іншими адрено- і симпатоміметиками (в т.ч. у формі очних крапель або у складі протикашльових засобів) можливе деяке підвищення АТ.

При одночасному застосуванні з індометацином і рифампіцином зменшується концентрація Метопрололу в плазмі крові.

При одночасному застосуванні Метопрололу з лідокаїном можливе порушення виведення останнього. Йодовмісні рентгеноконтрастні ЛЗ для внутрішньовенного введення підвищують ризик розвитку анафілактичних реакцій.

При одночасному застосуванні з ерготаміном можливе посилення порушень периферичного кровообігу.

При одночасному застосуванні Метопрололу і периферичних міорелаксантів (наприклад, суксаметоній, тубокурарин) можливе посилення нервово-м'язової блокади.

Наркотичні засоби підсилюють гіпотензивний ефект Метопрололу. При цьому потенціюється негативна інотропна дія вказаних засобів. Тому перед операцією під загальною анестезією анестезіолог

повинен бути інформований про те, що хворий приймає Метопролол. При одночасному застосуванні з опіоїдними анальгетиками взаємно посилюється кардіодепресивний ефект.

Метопролол може викликати невелике зменшення кліренсу теофіліну у курців.

При одночасному застосуванні Метопролол підвищує концентрацію етанолу в крові і подовжує його виведення.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Кардіоселективний β -блокатор, без власної симпатоміметичної та мембраностабілізуючої активності, діє переважно на β_1 -рецептори серця, меншою мірою – на β_2 -рецептори периферичних судин та бронхів. Має антигіпертензивний, антиангінальний та антиаритмічний ефект. Препарат характеризується негативною інотропною дією, знижує швидкість міокарда, серцевий викид, автоматизм синусового вузла, ЧСС, уповільнює атріовентрикулярну провідність. Пригнічує стимулюючий вплив катехоламінів на серце при фізичних та психоемоційних навантаженнях. У хворих на ішемічну хворобу серця виявляє протиішемічну та антиангінальну дію. При стенокардії напруження Метопролол зменшує кількість та важкість нападів, підвищує толерантність до фізичних навантажень; сприяє нормалізації серцевого ритму. При інфаркті міокарда сприяє обмеженню зони некрозу серцевого м'яза; знижує ризик розвитку фатальних аритмій та рецидивів інфаркту міокарда. Має антигіпертензивний ефект, який стабілізується до кінця 2 тижня регулярного застосування. На відміну від неселективних β -адреноблокаторів Метопролол при застосуванні в середніх терапевтичних дозах виявляє менш виражену дію на гладеньку мускулатуру бронхів і периферичних артерій, вивільнення інсуліну, вуглеводний та ліпідний обмін.

Фармакокінетика. Абсорбція Метопрололу при пероральному застосуванні майже повна та не залежить від прийому їжі, однак біодоступність становить приблизно 50 % в зв'язку з інтенсивним метаболізмом при першому проходженні через печінку. При тривалому прийомі біодоступність збільшується завдяки зниженню кровообігу в печінці та насиченню печінкових ферментів. Після прийому внутрішньо максимальна концентрація препарату в плазмі крові відзначається через 1-2 години. В плазмі крові Метопролол на 5-25 % зв'язується з білками. Період напіввиведення становить 3-7 годин. При першому проходженні через печінку метаболізується приблизно 65-80 % препарату. Екскретується нирками у вигляді метаболітів. Метопролол є ліпофільним β -адреноблокатором. Приблизно 90 % всмоктується в травному тракті, гарно проникає через гематоенцефалічний бар'єр.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки круглої форми з плоскою поверхнею, білого або білого з кремуватим відтінком кольору, з двома перпендикулярно-пересічними рисками та фаскою. На поверхні допускається мармуровість.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. В оригінальній упаковці, при температурі не вище 25 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 10 таблеток в блістері. 3 блістери в пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ВАТ «Київмедпрепарат».

Місцезнаходження. Україна, 01032, м. Київ, вул. Саксаганського, 139.