

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування препарату

**БЕТАЛОК
(BETALOC®)**

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: metoprolol; (\pm)-1-[4-(2-метоксіетил) феноксі]-3-[(1-метилетил) аміно]-2-пропанол;

основні фізико-хімічні властивості: прозора безбарвна рідина;

склад: 1 мл містить метопрололу тартрату 1 мг;

допоміжні речовини: натрію хлорид, вода для ін'єкцій.

Форма випуску. Розчин для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група. Селективні блокатори бета-адренорецепторів. Код АТС C07A B02.

Фармакологічні властивості. *Фармакодинаміка.* Метопролол – кардіоселективний β_1 -адреноблокатор. Метопролол має незначний мембраностабілізуючий ефект та не виявляє активності часткового агоністу. Метопролол зменшує або пригнічує стимулюючу дію катехоламінів на серце при фізичному та психоемоційному навантаженні, призводить до зменшення частоти серцевих скорочень, скоротливості міокарда та серцевого викиду, а також знижує підвищений артеріальний тиск. За умов високих концентрацій ендogenous адреналіну метопролол впливає на артеріальний тиск у значно меншому ступені, ніж неселективні β -блокатори.

За необхідності Беталок може призначатися у комбінації з β_2 -агоністами пацієнтам, які страждають на обструктивні захворювання легенів. У терапевтичних дозах Беталок у комбінації з β_2 -агоністами менше впливає на розширення бронхів, порівняно з впливом неселективних β -блокаторів.

Метопролол у меншій мірі впливає на вивільнення інсуліну та метаболізм вуглеводів, ніж неселективні β -блокатори. Метопролол менше впливає на серцево-судинні реакції при гіпоглікемії, ніж при прийомі неселективних β -блокаторів.

Метопролол може викликати незначне підвищення рівнів тригліцеридів та зменшення рівнів вільних жирних кислот у крові, незначне зменшення рівнів ліпопротеїнів низької щільності (ЛПНЩ).

Внутрішньовенна терапія метопрололом при інфаркті міокарда дозволяє зменшити вираженість больового синдрому, частоту виникнення фібриляції та тріпотіння передсердь. Ранній початок терапії (протягом 24 годин після перших симптомів) дозволяє попередити поширення некрозу та обмежити зону інфаркту.

Фармакокінетика. Після внутрішньовенної інфузії метопролол швидко розподіляється (протягом 5–10 хвилин). При дозах 5–20 мг фармакокінетика лінійна. Метопролол метаболізується в печінці, при цьому утворюється три метаболіти без жодного клінично значущого β -блокуючого ефекту. Період напіввиведення становить близько 3,5 годин (1-9 годин). Лише 5% метопрололу виводиться нирками у незміненому вигляді, інша частина – у вигляді метаболітів.

У хворих похилого віку фармакокінетика метопрололу не змінюється. Системна біодоступність та швидкість виведення метопрололу не змінюється у пацієнтів з патологією нирок, однак зменшується швидкість виведення метаболітів, але це не має клінічного значення.

Зважаючи на те, що зв'язування з білками низьке, порушення функції печінки не впливає на фармакокінетику метопрололу. Однак у пацієнтів з важкою формою цирозу або з шунтуванням портальної вени знижується рівень виведення метопрололу.

Показання для застосування.

Суправентрикулярна тахіаритмія; ішемія міокарда, тахіаритмія та больовий синдром внаслідок інфаркту

Спосіб застосування та дози. Парентеральне введення Беталоку слід проводити під наглядом спеціально підготовленого персоналу, при наявності кардіореспіраторного моніторингу та можливості виконання реанімаційних заходів.

Суправентрикулярна тахіаритмія.

Початкова доза препарату Беталок становить 5 мг (5 мл розчину), швидкість інфузії 1 – 2 мг/хв. Введення препарату в такий дозі може виконуватися кожні 5 хвилин до досягнення необхідного ефекту. Звичайно 10 – 15 мг (10 – 15 мл розчину) достатньо для досягнення необхідного ефекту. Максимальна доза для внутрішньовенного введення становить 20 мг (20 мл розчину).

Лікування ішемії міокарда, тахіаритмії та больового синдрому, внаслідок інфаркту міокарда.

При невідкладних станах початкова доза становить 5 мг (5 мл розчину) внутрішньовенно. Введення препарату можна повторювати кожні 2 хвилини, максимальна доза становить 15 мг (15 мл розчину). Через 15 хвилин після останнього внутрішньовенного введення слід призначити внутрішньо 50 мг метопролола тартрата кожні 6 годин протягом 2 днів. Для тривалого лікування слід призначити таблетки метопрололу (наприклад, Беталок ЗОК, таблетки з уповільненим вивільненням).

Застосування у хворих з нирковою недостатністю

Хворим з захворюваннями нирок коригування дози не потрібне.

Застосування у хворих з печінковою недостатністю

Зазвичай хворим з цирозом печінки призначають таку ж саму дозу, що й хворим з нормальною функцією печінки. Лише у випадку дуже важкого порушення функції печінки розглядається необхідність зменшення дози.

Застосування у хворих похилого віку

Зменшення дози не потрібне.

Застосування у дітей

Досвід застосування препарату Беталок, розчин для ін'єкцій, обмежений.

Побічна дія. Зазвичай Беталок добре переноситься. Небажані явища, які спостерігалися, були легкими та оборотними. При застосуванні препарату Беталок повідомлялось про такі побічні ефекти:

З боку серцево-судинної системи: часто: брадикардія, постуральні порушення (дуже рідко – втрата свідомості), похолодання кінцівок, відчуття серцебиття, посилення симптомів серцевої недостатності, атріовентрикулярна блокада, набряки, біль у серці; *рідко:* серцеві порушення, аритмія, набряки; *дуже рідко:* гангрена у пацієнтів з існуючими тяжкими порушеннями периферичного кровообігу.

З боку центральної нервової системи: втомлюваність, запаморочення, головний біль; *іноді:* парестезія, судоми.

З боку шлунково-кишкового тракту: нудота, біль в ділянці живота, діарея, запор; *рідко:* блювання, сухість у роті.

Кров: дуже рідко тромбоцитопенія.

Печінка: рідко відхилення у печінкових показниках; *дуже рідко:* гепатит.

З боку кістково-м'язової системи: дуже рідко: артралгія.

З боку обміну речовин: збільшення ваги тіла.

Психічний статус: іноді депресія, ослаблення концентрації уваги, сонливість або безсоння, нічні кошмари; *рідко:* нервозність, тривожність, *дуже рідко:* амнезія/порушення пам'яті, сплутаність свідомості, галюцинації.

З боку органів дихання: задишка при фізичному навантаженні; іноді бронхоспазм; *рідко:* риніт.

З боку органів чуттів: рідко: порушення зору, сухість і/або подразнення очей, кон'юнктивіт; *дуже*

рідко: шум у вухах, порушення смаку.

Шкіра: *рідко*: висип, підвищення пітливості, випадіння волосся; *дуже рідко*: фотосенсибілізація, заострення псоріазу.

Інші: імпотенція/сексуальна дисфункція.

Протипоказання.

Атріовентрикулярна блокада II або III ступеня, гостра або хронічна у стадії декомпенсації (набряк легенів, синдром гіперперфузії або гіпотензії) серцева недостатність, інотропна терапія, що триває або проводиться час від часу, спрямована на стимулювання β -рецепторів; синусова брадикардія, синдром слабкості синусового вузла, кардіогенний шок, важкі порушення периферичного артеріального кровообігу. Метопролол не слід призначати пацієнтам з підозрюваним гострим інфарктом міокарда, якщо частота серцевих скорочень менше 45 ударів/хв., інтервалі PQ більше 0,24 с, а систолічний артеріальний тиск менше 100 мм рт. ст.

Метопролол протипоказаний при підвищеній чутливості до будь-якого із компонентів препарату або до інших β -блокаторів.

Передозування. *Симптоми*: тяжка гіпотензія, синусова брадикардія, атріовентрикулярна блокада, серцева недостатність, кардіогенний шок, зупинка серця, бронхоспазм, порушення свідомості, кома, нудота, блювання та ціаноз. Одночасне вживання алкоголю, препаратів для зниження артеріального тиску, хінідину або барбітуратів можуть ускладнити стан пацієнта.

Лікування: симптоматична терапія. При тяжкій гіпотензії, брадикардії та серцевій недостатності призначають β_1 -стимулятори (наприклад, преналтерол) внутрішньовенно з інтервалом 2–5 хвилин або у вигляді інфузії до досягнення бажаного ефекту. За відсутності β_1 -стимуляторів може бути використаний допамін; для блокади блукаючого нерву можна застосувати внутрішньовенно атропіну сульфат. Якщо очікуваний ефект не досягнуто, застосовують інші симпатоміметики, такі як добутамін або норадреналін. Може бути призначений глюкагон у дозі 1–10 мг. Може виникнути необхідність застосування водія серцевого ритму. При виникненні бронхоспазму варто вводити внутрішньовенно β_2 -стимулятори. Слід пам'ятати, що дози ліків (антидотів), які необхідні для лікування передозування β -блокаторами, повинні бути вищими за терапевтичні, оскільки β -рецептори зайняті β -блокатором.

Особливості застосування. Пацієнтам, які приймають β -блокатори не слід вводити внутрішньовенно антагоністи кальцію типу верапаміл. Як правило, при лікуванні пацієнтів, які страждають на астму, в якості супутньої терапії призначають β_2 -агоністи у таблетках та/або аерозолі). У тих випадках, коли такі пацієнти починають лікуватися Беталоком, може знадобитися збільшення дози β_2 -агоністів.

Під час лікування Беталоком ризик порушення вуглеводного обміну або маскування симптомів гіпоглікемії менший, ніж при лікуванні неселективними β -блокаторами.

Пацієнти з хронічною серцевою недостатністю повинні бути компенсовані та отримувати базисну терапію як до, так і під час лікування Беталоком.

Дуже рідко у пацієнтів з порушеннями атріовентрикулярної провідності середнього ступеню тяжкості може спостерігатися ускладнення (атріовентрикулярна блокада). Якщо на фоні лікування виникла брадикардія, дозу Беталок слід зменшити або поступово відмінити.

Беталок може погіршити симптоми порушень периферичного артеріального кровообігу в основному завдяки зменшенню артеріального тиску.

Пацієнтам з феохромоцитомою одночасно із препаратом Беталок слід обов'язково призначати α -адреноблокатор.

У випадку хірургічного втручання варто попередити анестезіолога, що пацієнт приймає Беталок. Пацієнтам, яким має бути проведено хірургічне втручання, припиняти лікування β -блокаторами не рекомендується.

Недопустима різка відміна препарату. Відміну препарату проводять поступово, протягом принаймні двох тижнів. Дозу слід зменшувати удвічі на кожному етапі, аж до досягнення добової дози 25 мг. У цей період, особливо пацієнти з ішемічною хворобою серця, повинні знаходитися під ретельним наглядом медичного персоналу. Під час відміни препарату збільшується ризик коронарних порушень, включаючи раптову смерть.

У пацієнтів, що приймають β -блокатори, перебіг анафілактичного шоку важчий.

Пацієнтам з артеріальним тиском <100 мм рт.ст. (наприклад, для лікування аритмії) внутрішньовенне введення Беталоку проводиться з особливою обережністю, оскільки існує ризик ще більшого зниження тиску.

При лікуванні пацієнтів з підозрюваним або підтвердженим інфарктом міокарда слід ретельно слідкувати за гемодинамічними показниками після кожного внутрішньовенного введення 5 мг Беталок. Друге або третє введення Беталок не слід робити, якщо частота серцевих скорочень <40 ударів/хв., систолічний артеріальний тиск <90 мм рт.ст. та інтервал Q-T становить >26 с або, якщо зростає задишка та холодний піт.

Вагітність та лактація. Як і інші препарати, Беталок не слід призначати під час вагітності або лактації, за виключенням тих випадків, коли застосування Беталок є життєво необхідним. Як усі

антигіпертензивні препарати, β -блокатори можуть викликати небажані явища, такі як брадикардія, у плоду, новонародженого та у дитини, що годують груддю. Кількість метопролола, що виділяється у грудне молоко, не має жодного β -блокуючого впливу на дитину.

Вплив на здатність керувати автомобілем та працювати з технікою. Пацієнт повинен знати свою реакцію на лікування Беталокком, оскільки можливі запаморочення та слабкість.

Взаємодія з лікарськими засобами. Пацієнти повинні знаходитися під ретельним наглядом, якщо вони одночасно з препаратом Беталок приймають гангліоблокатори, інші β -блокатори (наприклад, очні краплі) або інгібітори моноаміноксидази (i-MAO).

У випадку, коли необхідно відмінити супутнє лікування клонідином, β -блокатор слід відмінити за декілька днів до відміни останнього.

У пацієнтів, що одночасно з препаратом Беталок приймають антагоністи кальцію ветапамілового типу або дилтіазем та/або препарати для лікування аритмії, можливі негативні інотропні та хронотропні ефекти. Пацієнтам, що приймають β -блокатори, не слід призначати внутрішньовенно верапаміл (через загрозу зупинки серця). β -блокатори можуть підсилювати негативні інотропні та хронотропні ефекти препаратів для лікування аритмії (аналоги хінідину або аміодарон).

У пацієнтів, що одержують лікування β -блокаторами, інгаляційні анестетики підсилюють кардіодепресивний ефект. Індуктори або інгібітори метаболізму можуть впливати на концентрацію метопролола в плазмі. Концентрація метопролола в плазмі знижується при прийомі рифампицину або може підвищуватися при прийомі циметидину, алкоголю, гідралазину та інгібіторів зворотного захоплення серотоніну (пароксетин, флуоксетин та сертралін).

При супутньому лікуванні індометацином або іншими препаратами, що пригнічують простагландин-синтезу, антигіпертензивний ефект β -блокаторів може зменшуватися. Кардіоселективні β -блокатори в значно меншому ступені впливають на артеріальний тиск при введенні пацієнтам адреналіну, ніж неселективні β -блокатори.

При супутньому прийомі β -блокаторів може знадобитися корегування дози пероральних антидіабетичних засобів.

Умови та термін зберігання. Зберігати в недоступному для дітей місці при температурі не вище 30°C. Термін придатності – 5 років.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 5 мл в ампулі, по 5 ампул в пачці.

Виробник. “АстраЗенека АБ”.

Адреса. Содертал'є, Швеція.