

І Н С Т Р У К Ц І Я
для медичного застосування препарату

МЕТОПРОЛОЛУ ТАРТРАТ
(METOPROLOL TARTRATE)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: Metoprolol; біс[(2RS)-1-[4-(2-метоксиетил)феноксид]-3-[(1-метилетил)аміно]пропан-2-ол] (2R,3R)-2,3-дигідроксибутандіоату;

основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого кольору, з плоскою поверхнею, рискою і фаскою. На поверхні таблеток допускаються сирі крапління;

склад: 1 таблетка містить метопрололу тартрату 50 мг (0,05 г) або 100 мг (0,1 г);

допоміжні речовини: крохмаль картопляний, лактози моногідрат (200), магнію стеарат, аеросил.

Форма випуску. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Селективні блокатори β -адренорецепторів.

Код АТС С07А В02.

Фармакологічні властивості. *Фармакодинаміка.* Метопрололу тартрат є кардіоселективним β -адреноблокатором без внутрішньої симпатоміметичної активності і мембраностабілізуючої дії. Впливає переважно на β -1-адренорецептори серця, має антиангінальний, гіпотензивний та антиаритмічний ефекти. У хворих, які перенесли інфаркт міокарда, знижує ризик повторного інфаркту міокарда, а у хворих на артеріальну гіпертензію - зменшує ризик серцево-судинних ускладнень (інсульту). Доведена його антиішемічна дія у випадку безбольової ішемії міокарда та зменшення гіпертрофії лівого шлуночка у хворих з артеріальною гіпертензією.

Антиангінальний ефект зумовлений зменшенням частоти серцевих скорочень, скоротності міокарда, системного артеріального тиску, що призводить до зменшення потреби міокарда в кисні. Завдяки подовженню діастолі (внаслідок негативного хронотропного ефекту), покращується перфузія міокарда.

Фармакокінетика. Після прийому внутрішньо абсорбція Метопрололу тартрату зі шлунково-кишкового тракту майже повна (90 %) і не залежить від прийому їжі, проте біодоступність становить близько 50 % у зв'язку з інтенсивним метаболізмом при першому проходженні через печінку (65 % - 80 %). При тривалому застосуванні біодоступність збільшується завдяки зниженню кровообігу в печінці і насиченню печінкових ферментів. Максимальна концентрація препарату в плазмі крові реєструється через 1–2 год, але вплив на артеріальний тиск і частоту серцевих скорочень спостерігається (після однократного прийому 100 мг) протягом 12 год.

Період напіввиведення – 3 -7 год. При нирковій недостатності він збільшується до 27 год і більше. Екскретується нирками у вигляді метаболітів. При печінковій недостатності препарат може кумулювати в організмі. Він добре проникає через гематоенцефалічний, плацентарний бар'єри та виділяється в грудне молоко. Паління, вживання алкоголю, прийом деяких лікарських препаратів змінює метаболізм Метопрололу тартрату (наприклад, барбітурати, дифенін, рифампіцин - підвищують, хлорпромазин - зменшує). Біотрансформація в печінці знижується при цирозі, тому таким пацієнтам дозу знижують, а концентрацію в плазмі крові - контролюють.

Показання для застосування. Артеріальна гіпертензія; стенокардія (в тому числі постінфарктна), гіперкінетичний синдром; аритмії (суправентрикулярна тахікардія); лікування гострого інфаркту міокарда та вторинна профілактика після перенесеного інфаркту (у складі комплексної терапії). Профілактика нападів мігрені.

Спосіб застосування та дози. Дозу Метопрололу тартрату встановлюють індивідуально. При артеріальній гіпертензії початкова доза становить 50-100 мг на добу, в два прийоми (вранці та ввечері). Поступово дозу підвищують з інтервалом у тиждень, до досягнення терапевтичного ефекту. Максимальна добова доза становить 400 мг. Таблетки приймають внутрішньо з невеликою кількістю

рідини, не розжовуючи, після їди.

При стенокардії, функціональних кардіалгіях призначають по 1-2 таблетки (50-100 мг) Метопрололу тартрату 1-2 рази на день. Для підтримуючої терапії призначають по 1-2 таблетки (50-100 мг Метопрололу тартрату) 2 рази на день.

При тахіаритміях, для профілактичного лікування мігрені приймають по 100-200 мг Метопрололу тартрату на день, у вигляді 1-2 разових доз (по 1/2 таблетки 2 рази на день). За необхідності відміни лікування дозу знижують поступово (протягом 10 і більше днів), під наглядом лікаря. Тривалість курсу лікування встановлюється індивідуально.

Побічна дія. З боку центральної нервової системи: втома, запаморочення, депресія, сплутаність свідомості, головний біль, пітливість, порушення сну (жахливі сновидіння), а також зміна настрою, короткочасне погіршення пам'яті, відчуття оніміння шкіри і "повзання мурашок", відчуття холоду в кінцівках, рідко - м'язова слабкість або крампи, в окремих випадках - статеві розлади. Всі ці явища при зниженні доз і поступовому їх збільшенні минають самостійно,

З боку шлунково-кишкового тракту: диспептичні явища, біль в животі, порушення випорожнення, зміни функціональних проб печінки, гепатит.

З боку системи дихання: у деяких хворих може відмічатися задишка при фізичному навантаженні, бронхоспазм, напади бронхіальної астми (у хворих на бронхіальну астму).

З боку серцево-судинної системи: ортостатична гіпотензія, що супроводжується іноді втратою свідомості, уповільненням пульсу, функціональними розладами серцевої діяльності (розладами атріовентрикулярної провідності), наростанням симптомів серцевої недостатності, болями у ділянці серця і посиленням серцебиття, брадикардією, почастишенням нападів стенокардії, можливе також посилення наявних розладів периферичного кровообігу (аж до гангрені).

З боку органів чуття: зрідка можуть спостерігатись сухість у роті, кон'юнктивіти, зменшення секреції слізної залози (слід враховувати цю обставину хворим, які носять контактні лінзи), збільшення маси тіла, розлади зору, слуху (шум у вухах).

Алергічні реакції: свербіж, шкірний висип (у більшості випадків псоріазоформні або дистрофічні ураження шкіри), випадання волосся, фотосенсибілізація шкіри, алергічний нежить.

З боку ендокринної системи: у хворих на цукровий діабет може розвинути гіпоглікемія.

З боку системи кровотворення: тромбоцитопенія, лейкопенія.

Протипоказання. Атріовентрикулярна та синоаурикулярна блокади II та III ступеня, кардіогенний шок; декомпенсована серцева недостатність; брадикардія менше 50 ударів за хвилину; виражена артеріальна гіпотензія, метаболічний ацидоз; тяжкі порушення периферичного кровообігу; бронхіальна астма; підвищена чутливість до Метопрололу тартрату та до його компонентів.

Передозування. При передозуванні препарату спостерігається: артеріальна гіпотензія; брадикардія аж до зупинки серця; гостра серцева недостатність; кардіогенний шок; порушення дихання та бронхоспазм; нудота і блювання; головний біль; втрата свідомості та генералізовані судоми. У цьому випадку проводять заходи загальної детоксикації (промивання шлунка, прийом активованого вугілля і проносних засобів), симптоматичне лікування.

Особливості застосування. Особливо ретельний лікарський контроль необхідний при лікуванні пацієнтів, хворих на цукровий діабет, з нестабільним рівнем цукру в крові, застосуванні суворої дієти з голодуванням; хворим з феохромоцитомою потрібна попередня терапія блокаторами α -адренорецепторів; пацієнтів, які проходять курс лікування по десенсибілізації (небезпека розвитку анафілактичної реакції); пацієнтів з порушеною функцією печінки.

Зрідка можлива маніфестація латентного діабету або погіршення стану хворих на цукровий діабет. Анафілактичний шок у пацієнтів, які приймають блокатори β -адренорецепторів, має тяжкий перебіг. Лікування підвищеного артеріального тиску Метопрололу тартратом потребує регулярного лікарського контролю. Під час лікування препаратом слід утримуватися від керування автотранспортом та роботи з іншими потенційно небезпечними технічними засобами. Ще більшою мірою це стосується початку курсу лікування і зміни препарату, а також його застосування в поєднанні з алкоголем. Хворим із

вираженим порушенням функцій печінки дозу препарату знижують. В окремих випадках Метопрололу тартрат може спровокувати виникнення чи загострення псоріазу або призвести до псоріазоформних екзантем, тому призначати Метопрололу тартрат хворим із псоріазом (лускатим лишаєм) в особистому або в сімейному анамнезі рекомендують тільки після ретельної оцінки очікуваної користі і можливого ризику.

Діти. Достатнього клінічного досвіду застосування Метопрололу тартрату дітям немає, тому препарат не рекомендується застосовувати для цієї вікової категорії.

Застосування в період вагітності та годування груддю. Під час вагітності (особливо в першому триместрі) застосовувати Метопрололу тартрат слід лише тоді, коли очікуваний терапевтичний ефект перевищуватиме потенційний ризик для плода. Через можливий розвиток у новонародженої дитини брадикардії, артеріальної гіпотензії, гіпоглікемії та депресії дихання курс лікування необхідно перервати за 48-72 години до пологів. У випадках, коли це неможливо, треба забезпечити суворий нагляд за новонародженими протягом 48-72 годин після пологів. Метопрололу тартрат проникає в материнське молоко, тому в період лактації він протипоказаний.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. При одночасному прийомі Метопрололу тартрату з інсуліном або пероральними цукрознижувальними засобами може посилюватись або пролонгуватись їхня дія. При цьому симптоми гіпоглікемії (особливо тахікардія і тремор) можуть маскуватись або зникати. В таких випадках необхідно проводити регулярний контроль рівня глюкози в крові.

При одночасному застосуванні Метопрололу тартрату і

- трициклічних антидепресантів, барбітуратів, фенотіазинів, нітрогліцерину, діуретиків, вазодилаторів та інших гіпотензивних засобів (наприклад, празозину), пероральних протизапальних засобів, ранітидину, циметидину - може посилюватись гіпотензивний ефект;
- антагоністів кальцію (типу ніфедипіну) – крім посилення гіпотензивного ефекту може розвинути ся серцева недостатність;
- антагоністів кальцію (типу верапамілу та дилтіазему) або інших антиаритмічних засобів (наприклад, дизопірамідну) - можуть розвинути ся артеріальна гіпотензія, брадикардія, інші порушення ритму серця та серцева недостатність;
- серцевих глікозидів, резерпіну, α -метилдопи, гуанфацину та клонідину - можуть розвиватись виражена брадикардія, порушення провідності; клонідин може бути відмінений тільки через декілька днів після припинення лікування Метопрололом тартратом;
- норадреналіну, адреналіну або інших симпатоміметичних засобів, а також інгібіторів моноаміноксидази - може підвищуватись артеріальний тиск і зменшуватись ефект Метопрололу тартрату;
- індометацину та рифампіцину - може зменшуватись гіпотензивна дія Метопрололу тартрату; лідокаїну - утруднюється виведення останнього;
- периферичних міорелаксантів (наприклад, суксаметонію, тубокурарину) – можливе посилення нервово-м'язової блокади. Наркотичні засоби посилюють гіпотензивний ефект Метопрололу тартрату. При цьому потенціюється негативна інотропна дія вказаних засобів. Тому перед операцією під загальною анестезією анестезіолог повинен бути поінформований про те, що хворий приймає Метопрололу тартрат.

Умови та термін зберігання. Зберігати в захищеному від світла і недоступному для дітей місці при температурі не вище 25 °С.

Термін придатності – 3 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 10 таблеток у блістер; по 2 або 5 блістерів, вкладених в пачку.

Виробник. ВАТ «Фармак».

Адреса. 04080, Україна, м. Київ, вул. Фрунзе, 63.