

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Метопролол Фармасинтез, 50 мг, таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые оболочкой.

Метопролол Фармасинтез, 100 мг, таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые оболочкой.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: метопролол.

Метопролол Фармасинтез, 50 мг, таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые оболочкой

Каждая таблетка содержит 47,5 мг метопролола сукцината, эквивалентного 50 мг метопролола тартрата.

Метопролол Фармасинтез, 100 мг, таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые оболочкой

Каждая таблетка содержит 95,0 мг метопролола сукцината, эквивалентного 100 мг метопролола тартрата.

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые оболочкой.

Круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые оболочкой, от белого до почти белого цвета. На поперечном разрезе ядро от белого до почти белого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат Метопролол Фармасинтез показан к применению у взрослых в возрасте от 18 лет:

- артериальная гипертензия;
- стенокардия;
- стабильная симптоматическая хроническая сердечная недостаточность с нарушением систолической функции левого желудочка (в качестве вспомогательной терапии к основному лечению хронической сердечной недостаточности);
- снижение смертности и частоты повторного инфаркта после острой фазы инфаркта миокарда;
- нарушения сердечного ритма, включая наджелудочковую тахикардию, снижение частоты сокращения желудочков при фибрилляции предсердий и желудочковых экстрасистолах;
- функциональные нарушения сердечной деятельности, сопровождающиеся тахикардией;
- профилактика приступов мигрени.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Метопролол предназначен для ежедневного приема один раз в сутки.

При подборе дозы необходимо избегать развития брадикардии.

Артериальная гипертензия

50 – 100 мг один раз в сутки. При необходимости дозу можно увеличить до 200 мг в сутки или добавить другое антигипертензивное средство, предпочтительнее диуретик или блокатор «медленных» кальциевых каналов дигидропиридинового ряда.

Стенокардия

100 – 200 мг метопролола один раз в сутки. При необходимости к терапии может быть добавлен другой антиангинальный препарат.

Стабильная симптоматическая хроническая сердечная недостаточность с нарушением систолической функции левого желудочка

Пациенты должны находиться в стадии стабильной хронической сердечной недостаточности без эпизодов обострения в течение последних 6 недель и без изменений в основной терапии в течение последних 2 недель.

Терапия сердечной недостаточности β -адреноблокаторами иногда может привести к временному ухудшению симптоматической картины. В некоторых случаях возможно продолжение терапии или снижение дозы, в ряде случаев может возникнуть необходимость отмены препарата.

Стабильная хроническая сердечная недостаточность, II функциональный класс

Для обеспечения нижеприведенного режима дозирования возможно применение метопролола в другой лекарственной форме: таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые пленочной оболочкой, по 25 мг (другого производителя) или таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые пленочной оболочкой, по 50 мг с риской (другого производителя).

Рекомендуемая начальная доза метопролола первые 2 недели 25 мг один раз в сутки, и далее может удваиваться каждые 2 недели.

Поддерживающая доза для длительного лечения составляет 200 мг метопролола один раз в сутки.

Стабильная хроническая сердечная недостаточность, III–IV функциональный класс

Для обеспечения нижеприведенного режима дозирования возможно применение метопролола в другой лекарственной форме: таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые пленочной оболочкой, по 25 мг с риской (другого производителя).

Рекомендуемая начальная доза в первые 2 недели 12,5 мг (половина таблетки 25 мг) метопролола один раз в сутки. Доза подбирается индивидуально. В период увеличения дозы пациент должен находиться под наблюдением, так как у некоторых пациентов симптомы сердечной недостаточности могут ухудшиться.

Через 1–2 недели доза может быть увеличена до 25 мг метопролола один раз в сутки. Затем по прошествии 2 недель доза может быть увеличена до 50 мг один раз в сутки. Пациентам, которые хорошо переносят препарат, можно удваивать дозу каждые 2 недели до достижения максимальной дозы 200 мг метопролола один раз в сутки.

В случае артериальной гипотензии и/или брадикардии может потребоваться уменьшение сопутствующей терапии или снижение дозы препарата. Артериальная гипотензия в начале терапии не обязательно указывает, что данная доза препарата не будет переноситься при

дальнейшем длительном лечении. Однако доза не должна повышаться до тех пор, пока состояние не стабилизируется. Может потребоваться контроль функции почек.

Нарушения сердечного ритма

100 – 200 мг метопролола один раз в сутки.

Поддерживающее лечение после инфаркта миокарда

200 мг метопролола один раз в сутки.

Функциональные нарушения сердечной деятельности, сопровождающиеся тахикардией

100 мг метопролола один раз в сутки. При необходимости дозу можно увеличить до 200 мг в сутки.

Профилактика приступов мигрени

100 – 200 мг метопролола один раз в сутки.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Нет необходимости корректировать дозу у пациентов пожилого возраста.

Пациенты с почечной недостаточностью

Нет необходимости корректировать дозу у пациентов с нарушением функции почек.

Пациенты с печеночной недостаточностью

Обычно из-за низкой степени связи с белками плазмы коррекции дозы метопролола не требуется. Однако при тяжелом нарушении функции печени (у пациентов с тяжелой формой цирроза печени или портокавальным анастомозом) может потребоваться снижение дозы.

Дети

Безопасность и эффективность препарата Метопролол Фармасинтез у детей от 0 до 18 лет на данный момент не установлены. Данные отсутствуют.

Способ применения

Внутрь.

Препарат Метопролол Фармасинтез рекомендуется принимать утром. Таблетку следует проглатывать, запивая жидкостью. Прием пищи не влияет на биодоступность препарата.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к метопрололу, другим β -адреноблокаторам или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.;
- Атриовентрикулярная блокада II и III степени;
- Сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;
- Постоянная или интермиттирующая терапия инотропными препаратами, действующими на бета-адренорецепторы;
- Клинически значимая синусовая брадикардия;
- Синдром слабости синусового узла;
- Кардиогенный шок;
- Тяжелые нарушения периферического кровообращения, в том числе и при угрозе гангрены;
- Артериальная гипотензия (систолическое артериальное давление (АД) менее 100 мм рт. ст.);

- Метопролол противопоказан пациентам с подозрением на острый инфаркт миокарда при ЧСС менее 45 ударов в минуту, интервалом PQ более 0,24 секунд или систолическим артериальным давлением менее 100 мм рт. ст.;
- Пациентам, получающим β -адреноблокаторы, противопоказано внутривенное введение блокаторов «медленных» кальциевых каналов типа верапамила;
- Возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);
- Феохромоцитома (без одновременного применения альфа-адреноблокаторов);
- Период грудного вскармливания.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

Атриовентрикулярная блокада I степени, стенокардия Принцметала, бронхиальная астма, хроническая обструктивная болезнь легких, сахарный диабет, тяжелая почечная недостаточность, тяжелая печеночная недостаточность, метаболический ацидоз, одновременное применение с сердечными гликозидами, феохромоцитома (при одновременном применении альфа-адреноблокаторов), беременность, тиреотоксикоз, псориаз, пожилой возраст, депрессия (в т.ч. в анамнезе), облитерирующие заболевания периферических артерий (перемежающаяся хромота), синдром Рейно.

Особые указания

Пациентам, принимающим β -адреноблокаторы, не следует вводить внутривенно блокаторы «медленных» кальциевых каналов типа верапамила.

Пациентам с бронхиальной астмой или хронической обструктивной болезнью легких должна быть назначена сопутствующая терапия β_2 -адреномиметиком. Необходимо назначать минимально эффективную дозу метопролола, при этом может потребоваться увеличение дозы β_2 -адреномиметика.

Пациентам, страдающим стенокардией Принцметала, не рекомендуется назначать неселективные β -адреноблокаторы. Данной группе пациентов β -селективные адреноблокаторы следует назначать с осторожностью.

При использовании β_1 -адреноблокаторов риск их влияния на углеводный обмен или возможность маскирования симптомов гипогликемии значительно меньше, чем при использовании неселективных β -адреноблокаторов.

У пациентов с хронической сердечной недостаточностью в стадии декомпенсации необходимо добиться стадии компенсации как до, так и во время лечения препаратом.

Очень редко у пациентов с нарушением AV проводимости может наступать ухудшение (возможный исход — AV блокада). Если на фоне лечения развилась брадикардия, дозу препарата необходимо уменьшить или следует постепенно отменить препарат.

Метопролол может ухудшать симптомы нарушения периферического кровообращения в основном вследствие снижения артериального давления.

У пациентов, принимающих β -адреноблокаторы, анафилактический шок протекает в более тяжелой форме. Применение эпинефрина (адреналина) в терапевтических дозах не всегда приводит к достижению желаемого клинического эффекта на фоне приема метопролола. Пациентам, страдающим феохромоцитомой, параллельно с метопрололом следует назначать альфа-адреноблокатор.

Следует избегать резкой отмены препарата. При необходимости отмены препарата ее следует проводить постепенно. У большинства пациентов прием препарата можно отменить за 14 дней с двукратным снижением дозы препарата на каждом этапе, до достижения конечной дозы 12,5

мг (возможно применение метопролола в другой лекарственной форме: таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые пленочной оболочкой, по 25 мг с риской (другого производителя)), которую следует принимать как минимум 4 дня до полной отмены препарата. При появлении симптомов (например, усиление симптомов стенокардии, повышение артериального давления) рекомендуется более медленный режим отмены. Резкая отмена β -адреноблокатора может привести к утяжелению течения хронической сердечной недостаточности и повышению риска инфаркта миокарда и внезапной смерти.

В случае хирургического вмешательства следует проинформировать врача-анестезиолога, что пациент принимает метопролол. Пациентам, которым предстоит хирургическое вмешательство, не рекомендуется прекращение терапии β -адреноблокаторами. Следует избегать назначения высоких доз без предварительной титрации доз препарата у пациентов с факторами сердечно-сосудистого риска, подвергающихся некардиологическим операциям, в связи с повышенным риском брадикардии, артериальной гипотензии и инсульта, в том числе с летальным исходом.

Данные клинических исследований по эффективности и безопасности у пациентов с тяжелой стабильной симптоматической хронической сердечной недостаточностью (IV класс по классификации NYHA) ограничены. Лечение таких пациентов должно проводиться врачами, обладающими специальными знаниями и опытом.

Пациенты с симптоматической сердечной недостаточностью в сочетании с острым инфарктом миокарда и нестабильной стенокардией исключались из исследований, на основании которых определялись показания к назначению. Эффективность и безопасность препарата для данной группы пациентов не описана. Применение при нестабильной сердечной недостаточности в стадии декомпенсации противопоказано.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Метопролол является субстратом CYP2D6, в связи с чем, препараты, ингибирующие CYP2D6 (хинидин, тербинафин, пароксетин, флуоксетин, сертралин, целекоксиб, пропafenон и дифенгидрамин) могут влиять на плазменную концентрацию метопролола.

Следует избегать совместного применения препарата Метопролол Фармасинтез со следующими лекарственными средствами:

Производные барбитуровой кислоты: барбитураты усиливают метаболизм метопролола, вследствие индукции ферментов.

Пропafenон: при назначении пропafenона четырем пациентам, получавшим лечение метопрололом, отмечалось увеличение плазменной концентрации метопролола в 2–5 раз, при этом у двух пациентов отмечались побочные эффекты, характерные для метопролола. Вероятно, взаимодействие обусловлено ингибированием пропafenоном, подобно хинидину, метаболизма метопролола посредством системы цитохрома P4502D6. Принимая во внимание тот факт, что пропafenон обладает свойствами β -адреноблокатора, совместное назначение метопролола и пропafenона не представляется целесообразным.

Верапамил: комбинация β -адреноблокаторов (атенолола, пропранолола и пиндолола) и верапамила может вызвать брадикардию и приводить к снижению АД. Верапамил и β -адреноблокаторы имеют взаимодополняющий ингибирующий эффект на атриовентрикулярную проводимость и функцию синусового узла.

Комбинация препарата Метопролол Фармасинтез со следующими препаратами может потребовать коррекции дозы:

Амиодарон: совместное применение амиодарона и метопролола может приводить к

выраженной синусовой брадикардии. Принимая во внимание крайне длительный период полувыведения амиодарона (50 дней), следует учитывать возможное взаимодействие спустя продолжительное время после отмены амиодарона.

Антиаритмические средства I класса: антиаритмические средства I класса и β-адреноблокаторы могут приводить к суммированию отрицательного инотропного эффекта, который может приводить к серьезным гемодинамическим побочным эффектам у пациентов с нарушенной функцией левого желудочка. Также следует избегать подобной комбинации у пациентов с синдромом слабости синусового узла и нарушением AV проводимости. Взаимодействие описано на примере дизопирида.

Нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП): НПВП ослабляют антигипертензивный эффект β-адреноблокаторов. Данное взаимодействие документировано для индометацина. Вероятно, описанное взаимодействие не будет отмечаться при взаимодействии с сулиндаком. Отрицательное взаимодействие было отмечено в исследованиях с диклофенаком.

Дифенгидрамин: дифенгидрамин уменьшает клиренс метопролола до α-гидроксиметопролола в 2,5 раза. Одновременно наблюдается усиление действия метопролола.

Дилтиазем: дилтиазем и β-адреноблокаторы взаимно усиливает ингибирующий эффект на AV проводимость и функцию синусового узла. При комбинации метопролола с дилтиаземом отмечались случаи выраженной брадикардии.

Эпинефрин (адреналин): сообщалось о 10 случаях выраженной артериальной гипертензии и брадикардии у пациентов, принимавших неселективные β-адреноблокаторы (включая пиндолол и пропранолол) и получавших эпинефрин (адреналин). Взаимодействие отмечено и в группе здоровых добровольцев. Предполагается, что подобные реакции могут наблюдаться и при применении эпинефрина совместно с местными анестетиками при случайном попадании в сосудистое русло. Предполагается, что этот риск гораздо ниже при применении кардиоселективных β-адреноблокаторов.

Фенилпропаноламин: фенилпропаноламин (норэфедрин) в разовой дозе 50 мг может вызывать повышение диастолического АД до патологических значений у здоровых добровольцев. Пропранолол в основном препятствует повышению АД, вызываемому фенилпропаноламином. Однако, β-адреноблокаторы могут вызывать реакции парадоксальной артериальной гипертензии у пациентов, получающих высокие дозы фенилпропаноламина. Сообщалось о нескольких случаях развития гипертонического криза на фоне приема фенилпропаноламина.

Хинидин: хинидин ингибирует метаболизм метопролола у особой группы пациентов с быстрым гидроксилированием (в Швеции примерно 90 % населения), вызывая, главным образом, значительное увеличение плазменной концентрации метопролола и усиление β-блокады. Полагают, что подобное взаимодействие характерно и для других β-адреноблокаторов в метаболизме которых участвует цитохром P4502D6.

Клонидин: гипертензивные реакции при резкой отмене клонидина могут усиливаться при совместном приеме β-адреноблокаторов. При совместном применении, в случае отмены клонидина, прекращение приема β-адреноблокаторов следует начинать за несколько дней до отмены клонидина.

Рифампицин: рифампицин может усиливать метаболизм метопролола, уменьшая плазменную концентрацию метопролола.

Пациенты, одновременно принимающие метопролол и другие β-адреноблокаторы (глазные капли) или ингибиторы моноаминоксидазы (МАО), должны находиться под тщательным

наблюдением. На фоне приема β -адреноблокаторов пациентам, получающим гипогликемические средства для приема внутрь, может потребоваться коррекция дозы последних.

Плазменная концентрация метопролола может повышаться при приеме циметидина или гидралазина.

Сердечные гликозиды при совместном применении с β -адреноблокаторами могут увеличивать время атриовентрикулярной проводимости и вызывать брадикардию.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность и лактация

Как и большинство препаратов, препарат Метопролол Фармасинтез не следует назначать во время беременности и в период грудного вскармливания, за исключением тех случаев, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода и/или ребенка. Как и другие антигипертензивные средства, β -адреноблокаторы могут вызвать побочные эффекты, например, брадикардию у плода, новорожденных или детей, находящихся на грудном вскармливании.

Количество метопролола, выделяющееся в грудное молоко, и β -блокирующее действие у ребенка, находящегося на грудном вскармливании (при приеме матерью метопролола в терапевтических дозах), являются незначительными.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

При применении препарата может наблюдаться головокружение или общая слабость, в связи с чем следует воздержаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

Метопролол хорошо переносится пациентами, побочные эффекты в основном являются легкими и обратимыми.

Резюме нежелательных реакций

Для оценки частоты случаев применяли следующие критерии: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Очень редко: тромбоцитопения.

Нарушения метаболизма и питания

Нечасто: увеличение массы тела.

Нарушения со стороны нервной системы

Очень часто: повышенная утомляемость.

Часто: головокружение, головная боль.

Нечасто: парестезия, судороги, депрессия, снижение концентрации внимания, сонливость или бессонница, ночные кошмары.

Редко: повышенная нервная возбудимость, тревожность.

Очень редко: амнезия/нарушения памяти, подавленность, галлюцинации, нарушения вкусовых ощущений.

Нарушения со стороны органа зрения

Редко: нарушения зрения, сухость и/или раздражение глаз, конъюнктивит.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта

Очень редко: звон в ушах.

Нарушения со стороны сердца

Часто: брадикардия, ощущение сердцебиения.

Нечасто: временное усиление симптомов сердечной недостаточности, АВ блокада I степени; кардиогенный шок у пациентов с острым инфарктом миокарда, боль в области сердца.

Редко: другие нарушения проводимости, аритмии.

Нарушения со стороны сосудов

Часто: ортостатическая гипотензия (очень редко сопровождающаяся обмороком), похолодание конечностей.

Нечасто: отеки.

Очень редко: гангрена у пациентов с предшествующими тяжелыми нарушениями периферического кровообращения.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Часто: одышка при физической нагрузке.

Нечасто: бронхоспазм.

Редко: ринит.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Часто: тошнота, боли в области живота, диарея, запор.

Нечасто: рвота.

Редко: сухость слизистой оболочки полости рта.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Редко: нарушения функции печени.

Очень редко: гепатит.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Нечасто: кожная сыпь (по типу псориазоподобной крапивницы), повышенное потоотделение.

Редко: выпадение волос.

Очень редко: фотосенсибилизация, обострение псориаза.

Нарушения со стороны мышечной, костной и соединительной ткани

Очень редко: артралгия.

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез

Редко: импотенция/сексуальная дисфункция.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Телефон: +7 800 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

<https://www.roszdravnadzor.gov.ru/>

4.9. Передозировка

Токсичность

Метопролол в дозе 7,5 г у взрослого вызвал интоксикацию с летальным исходом. У пятилетнего ребенка, принявшего 100 мг метопролола, после промывания желудка не отмечалось признаков интоксикации. Прием 450 мг метопролола подростком в возрасте 12 лет привел к умеренной интоксикации. Прием 1,4 г и 2,5 г метопролола взрослыми вызвал умеренную и тяжелую интоксикацию, соответственно. Прием 7,5 г взрослым привел к крайне тяжелой интоксикации.

Симптомы

При передозировке метопрололом наиболее серьезными являются симптомы со стороны сердечно-сосудистой системы, однако иногда, особенно у детей и подростков, могут преобладать симптомы со стороны ЦНС и подавление легочной функции, брадикардия, АВ блокада I–III степени, асистолия, выраженное снижение АД, слабая периферическая перфузия, сердечная недостаточность, кардиогенный шок, угнетение функции легких, апноэ, а также повышенная усталость, нарушение сознания, потеря сознания, тремор, судороги, повышенное потоотделение, парестезии, бронхоспазм, тошнота, рвота, возможен эзофагеальный спазм, гипогликемия (особенно у детей) или гипергликемия, гиперкалиемия; воздействие на почки; транзиторный миастенический синдром; сопутствующий прием алкоголя, антигипертензивных средств, хинидина или барбитуратов может ухудшить состояние пациента. Первые признаки передозировки могут наблюдаться через 20 мин – 2 ч после приема препарата.

Лечение

Назначение активированного угля, в случае необходимости промывания желудка.

ВАЖНО! Атропин (0,25–0,5 мг в/в для взрослых, 10–20 мкг/кг для детей) должен быть назначен до промывания желудка (из-за риска стимуляции блуждающего нерва).

При необходимости поддержание проходимости дыхательных путей (интубация) и адекватная вентиляция легких, восполнение объема циркулирующей крови и инфузии глюкозы, контроль ЭКГ. Атропин 1,0–2,0 мг в/в, при необходимости повторяют введение (особенно в случае вагусных симптомов). В случае депрессии миокарда показано инфузионное введение добутамина или допамина. Можно также применять глюкагон 50–150 мкг/кг в/в с интервалом в 1 минуту. В некоторых случаях может быть эффективно добавление к терапии адреналина. При аритмии и обширном желудочковом (QRS) комплекс инфузионно вводят растворы натрия

(хлорид или бикарбонат). Возможна установка искусственного водителя ритма. При остановке сердца вследствие передозировки могут понадобиться реанимационные мероприятия в течение нескольких часов. Для купирования бронхоспазма может применяться тербуталин (инъекционно или с помощью ингаляций). Проводится симптоматическое лечение.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: бета-адреноблокаторы; селективные бета-адреноблокаторы.
Код АТХ: C07AB02.

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Метопролол – β_1 -адреноблокатор, блокирующий β_1 -рецепторы в дозах значительно меньших, чем дозы, требующие для блокирования β_2 -рецепторов.

Метопролол обладает незначительным мембраностабилизирующим эффектом и не проявляет активности частичного агониста.

Метопролол снижает или ингибирует агонистическое действие, которое оказывают на сердечную деятельность катехоламины, выделяющиеся при нервных и физических стрессах. Это означает, что метопролол обладает способностью препятствовать увеличению частоты сердечных сокращений (ЧСС), минутного объема и усилению сократимости сердца, а также повышению артериального давления (АД), вызываемых резким выбросом катехоламинов.

В отличие от обычных таблетированных лекарственных форм селективных β_1 -адреноблокаторов (включая метопролол тартрат), при применении метопролола наблюдается постоянная концентрация препарата в плазме крови и обеспечивается устойчивый клинический эффект (β_1 -блокада) в течение более чем 24 часов.

Вследствие отсутствия явных пиковых концентраций в плазме, клинически метопролол характеризуется лучшей β_1 -селективностью по сравнению с обычными таблетированными формами β_1 -адреноблокаторов. Кроме того, в значительной степени уменьшается потенциальный риск побочных эффектов, наблюдаемых при пиковых концентрациях препарата в плазме, например, брадикардия и слабость в ногах при ходьбе.

Пациентам с симптомами обструктивных заболеваний легких при необходимости можно назначать метопролол в сочетании с β_2 -адреномиметиками. При совместном использовании с β_2 -адреномиметиками Метопролол в терапевтических дозах в меньшей степени влияет на вызываемую β_2 -адреномиметиками бронходилатацию, чем неселективные β -адреноблокаторы. Метопролол в меньшей степени, чем неселективные β -адреноблокаторы, влияет на продукцию инсулина и углеводный метаболизм. Влияние препарата на реакцию сердечно-сосудистой системы в условиях гипогликемии значительно менее выражено по сравнению с неселективными β -адреноблокаторами.

Применение метопролола при артериальной гипертензии приводит к значительному снижению артериального давления в течение более чем 24 часов, как в положении лежа и стоя, так и при нагрузке. В начале терапии метопрололом отмечается увеличение сосудистого сопротивления. Однако при длительном приеме возможно снижение АД вследствие уменьшения сосудистого сопротивления при неизменном сердечном выбросе.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

При контакте с жидкостью таблетки быстро распадаются, при этом происходит диспергирование активного вещества в желудочно-кишечном тракте. Скорость высвобождения активного вещества зависит от кислотности среды.

Метопролол полностью абсорбируется после приема внутрь. Системная биодоступность после приема внутрь однократной дозы составляет приблизительно 30–40 %.

Распределение

Длительность терапевтического эффекта после приема метопролола в лекарственной форме таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые оболочкой, составляет более 24 часов, при этом достигается постоянная скорость высвобождения активного вещества в течение 20 часов.

Связь с белками плазмы крови низкая, примерно 5–10 %.

Биотрансформация

Метопролол подвергается окислительному метаболизму в печени. Три основных метаболита метопролола не обнаруживали клинически значимого β -блокирующего эффекта.

Элиминация

Период полувыведения составляет в среднем 3,5 часа. Около 5 % пероральной дозы препарата выводится с мочой в неизменном виде, остальная часть препарата выводится в виде метаболитов.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Метопролол Фармасинтез, 50 мг, таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые оболочкой

Ядро

Целлюлоза микрокристаллическая
Камедь ксантановая
Гипромеллоза тип 2208
Гидроксипропилцеллюлоза
Повидон К30
Целлюлоза микрокристаллическая 102
Кремния диоксид коллоидный
Натрия стеарилфумарат

Оболочка

Готовое покрытие (гипромеллоза 5 – 70,0 %, полиэтиленгликоль 6000 (макрогол 6000) – 9,0 %, полисорбат 80 (твин 80) – 1,0 %, титана диоксид – 20,0 %)

Метопролол Фармасинтез, 100 мг, таблетки с пролонгированным высвобождением, покрытые оболочкой

Ядро

Целлюлоза микрокристаллическая
Камедь ксантановая
Гипромеллоза тип 2208
Гидроксипропилцеллюлоза
Повидон К30

Целлюлоза микрокристаллическая 102
Кремния диоксид коллоидный
Натрия стеарилфумарат

Оболочка

Готовое покрытие (гипромеллоза 5 – 70,0 %, полиэтиленгликоль 6000 (макрогол 6000) – 9,0 %, полисорбат 80 (твин 80) – 1,0 %, титана диоксид – 20,0 %)

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 30 °С.

6.5. Характер и содержание упаковки

Первичная упаковка лекарственного препарата

По 7, 10 или 14 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 10, 14, 20, 21, 28, 30, 40, 50, 60, 70, 80, 90, 100 таблеток в банку полимерную из полиэтилена низкого давления с крышкой натягиваемой с контролем первого вскрытия из полимера низкого или высокого давления. Свободное пространство может быть заполнено ватой медицинской. На банки наклеивают этикетки из бумаги этикеточной или писчей, или из полимерных материалов, самоклеящиеся.

Вторичная упаковка лекарственного препарата

По 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10 контурных ячейковых упаковок по 10 таблеток или по 2, 4 контурных ячейковых упаковки по 7 таблеток, или по 1, 2 контурные ячейковые упаковки по 14 таблеток вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона для потребительской тары. На пачку может наклеиваться самоклеящаяся этикетка с маркировкой из бумаги этикеточной или писчей, или из полимерных материалов. Дополнительно на пачку могут наклеивать один или два прозрачных фиксирующих стикера из полимерных материалов. Пачки помещают в групповую упаковку.

По 1 банке вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона для потребительской тары. На пачку может наклеиваться самоклеящаяся этикетка с маркировкой из бумаги этикеточной или писчей, или из полимерных материалов. Дополнительно на пачку могут наклеивать один или два прозрачных фиксирующих стикера из полимерных материалов. Пачки помещают в групповую упаковку.

6.6. Особые меры предосторожности при утилизации использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация
ООО «Фармасинтез-Тюмень»
625059, Тюменская обл., г. Тюмень, тракт Велижанский 7 км, д. 2
Тел.: 8 (345) 239-38-56
Адрес электронной почты: info-pst@pharmasyntez.com

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация
ООО «Фармасинтез-Тюмень»
625059, Тюменская обл., г. Тюмень, тракт Велижанский 7 км, д. 2
Тел.: 8-800-100-15-50
Адрес электронной почты: info-pst@pharmasyntez.com

8. НОМЕР (НОМЕРА) РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. КАТЕГОРИЯ ОТПУСКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лекарственный препарат относится к категории отпуска по рецепту.

Общая характеристика лекарственного препарата Метопролол Фармасинтез доступна в едином реестре зарегистрированных лекарственных средств Евразийского экономического союза и на официальном сайте уполномоченного органа (экспертной организации) https://lk.regmed.ru/Register/EAEU_SmPC.