

Инструкция по применению препарата

# Метокард®

**РЕГИСТРАЦИОННЫЙ НОМЕР:** П N013293/01

**ТОРГОВОЕ НАЗВАНИЕ ПРЕПАРАТА:** МЕТОКАРД®

**МЕЖДУНАРОДНОЕ НЕПАТЕНТОВАННОЕ НАЗВАНИЕ:** Метопролол

**ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА:** таблетки.

## СОСТАВ:

1 таблетка содержит

*Активный ингредиент:*

Метопролола тартрат 50 мг или 100 мг;

*Вспомогательные вещества:* лактоза, повидон, тальк, магния стеарат, целлюлоза микрокристаллическая, крахмал рисовый.

## ОПИСАНИЕ

Таблетки белого цвета, круглые, двояковыпуклые, имеют делительную риску.

**ФАРМАКОТЕРАПЕВТИЧЕСКАЯ ГРУППА:**  $\beta_1$ -адреноблокатор селективный.

**КОД АТХ:** C07AB02

---

## ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

### *Фармакодинамика*

Метокард относится к кардиоселективным блокаторам  $\beta$  – адренорецепторов, не обладающих внутренней симпатомиметической активностью и мембраностабилизирующими свойствами. Обладает гипотензивным, антиангинальным и антиаритмическим действием.

Блокируя в невысоких дозах  $\beta_1$  – адренорецепторы сердца, уменьшает стимулированное катехоламинами образование цАМФ из АТФ, снижает внутриклеточный ток  $Ca^{2+}$ , оказывает отрицательное хроно-, дромо-, батмо- и инотропное действие (урежает частоту сердечных сокращений, угнетает проводимость и возбудимость, снижает сократимость миокарда).

Общее периферическое сопротивление в начале применения  $\beta$  – адреноблокаторов (в первые 24 часа после перорального приема) – увеличивается (в результате реципрокного возрастания активности  $\alpha$  – адренорецепторов и устранения стимуляции  $\beta_2$  –адренорецепторов), которое через 1-3 дня возвращается к исходному, а при длительном назначении – снижается.

Острое антигипотензивное действие обусловлено уменьшением сердечного выброса, стабильный антигипертензивный эффект развивается в течение 2-3 недель и обусловлен снижением синтеза ренина, и накоплением ренина плазмы, угнетением активности ренин-ангиотензивной системы (имеет большое значение у больных с исходной гиперсекрецией ренина) и центральной нервной системы, восстановлением чувствительности барорецепторов дуги аорты (не происходит усиления их активности в ответ на снижение артериального давления) и, в итоге, уменьшением периферических симпатических влияний. Снижает повышенное артериальное давление в покое, при физическом напряжении и стрессе.

Антиангиальный эффект определяется снижением потребности миокарда в кислороде в результате уменьшения частоты сердечных сокращений (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.

Артериальное давление снижается через 15 минут, максимально – через 2 часа и снижение продолжается в течение 6 часов, диастолическое артериальное давление изменяется медленнее: стабильное снижение наблюдается после нескольких недель регулярного приема.

Антиаритмический эффект обусловлен устранением аритмогенных факторов (тахикардии, повышенной активности симпатической нервной системы, увеличенного содержания цАМФ, артериальной гипертензии), уменьшением скорости спонтанного возбуждения синусного и эктопического водителей ритма и замедлением атриовентрикулярной проводимости (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 гипертиреозе, урежает частоту сердечных сокращений, 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  $\beta_2$  – адренорецепторы (поджелудочная железа, скелетные мышцы, гладкая мускулатура периферических артерий, бронхов и матки) и на углеводный обмен. При применении в больших дозах (более 100 мг/сут) оказывает блокирующий эффект на оба подтипа  $\beta$  – адренорецепторов.

### **Фармакокинетика**

Метопролол быстро и почти полностью (95%) всасывается в желудочно-кишечном тракте. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 1-2 часа после приема внутрь. Период полувыведения в среднем составляет 3,5 ч (в пределах от 1 ч до 9 ч).

Биодоступность составляет 50 % при первом приеме и возрастает до 70 % при повторном применении. Прием пищи повышает биодоступность на 20 – 40 %. Биодоступность метопролола увеличивается при циррозе печени.

Связь с белками плазмы в среднем 10 %.

Препарат проникает через гемато-энцефалический и плацентарный барьеры. Выделяется в грудное молоко в незначительных количествах.

Метаболизируется в печени. Метаболиты не обладают фармакологической активностью. Около 5 % препарата выводится в неизменном виде почками.

Лечение больных со сниженной функцией почек не требует коррекции дозы препарата. Нарушение функции печени замедляет метаболизм препарата, и в случаях недостаточности функции печени, доза препарата должна быть снижена.

Не удаляется при гемодиализе.

### **ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ**

- артериальная гипертензия (в качестве монотерапии или в комбинации с другими антигипертензивными препаратами), в том числе гиперкинетический тип, тахикардия;
- ишемическая болезнь сердца: инфаркт миокарда (вторичная профилактика-комплексная терапия), профилактика приступов стенокардии;
- нарушения ритма сердца (наджелудочковая тахикардия, желудочковая экстрасистолия);
- гипертиреоз (комплексная терапия);
- профилактика приступов мигрени.

### **ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ**

- повышенная чувствительность к метопрололу или другим компонентам препарата, другим бета-блокаторам;
- кардиогенный шок;
- атриовентрикулярная (AV) блокада II – III степени;
- синоатриальная (SA) блокада;
- синдром слабости синусового узла;
- выраженная брадикардия;
- сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;
- стенокардия Принцметала;
- артериальная гипотензия (в случае использования при вторичной профилактике инфаркта миокарда – систолическое АД менее 100 мм рт.ст., ЧСС менее 45 уд./мин);
- период лактации (см. «Беременность и период лактации»);
- одновременный прием ингибиторов MAO или одновременное внутривенное введение верапамила (см. «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»);
- возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

**С осторожностью** (см. также «Особые указания) – сахарный диабет, метаболический ацидоз, бронхиальная астма, хроническая обструктивная болезнь легких (эмфизема легких, хронический обструктивный бронхит), облитерирующие заболевания периферических сосудов («перемежающаяся» хромота, синдром Рейно), хроническая печеночная и/или почечная недостаточность, миастения, феохромоцитома, AV блокада I степени, тиреотоксикоз, депрессия (в т.ч. в анамнезе), псориаз,

беременность, пожилой возраст.

**Беременность и период лактации.** Во время беременности назначают с учетом соотношения польза/риск (в связи с развитием у плода брадикардии, артериальной гипотензии, гипогликемии). При этом проводят тщательное наблюдение, особенно за развитием плода. Необходимо строгое наблюдение за новорожденными в течение 48-72 ч после родоразрешения.

Влияние метопролола на новорожденного, при кормлении грудью не изучено, поэтому женщинам, принимающим МЕТОКАРД, следует прекратить кормление грудью.

## **СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ**

Таблетки принимают внутрь одновременно с принятием пищи или сразу после еды, таблетки можно делить пополам, но не разжевывать и запивать жидкостью.

### *Артериальная гипертензия*

Начальная суточная доза составляет 50 – 100 мг в 1-2 приема (утром и вечером). При недостаточном терапевтическом эффекте суточная доза может быть постепенно повышена до 100 – 200 мг и/или дополнительное назначение других антигипертензивных средств. Максимальная суточная доза 200 мг.

### *Стенокардия, аритмии, профилактика приступов мигрени*

100 – 200 мг в сутки в два приема (утром и вечером).

### *Вторичная профилактика инфаркта миокарда*

200 мг в сутки в два приема (утром и вечером).

### *Функциональные нарушения сердечной деятельности, сопровождающиеся тахикардией*

100 мг в сутки в два приема (утром и вечером).

У пожилых больных, при нарушениях функции почек, а также при необходимости проведения гемодиализа дозу не изменяют.

При нарушениях функции печени дозу препарата следует снизить в зависимости от клинического состояния.

## **ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ**

Побочные эффекты зависят от индивидуальной чувствительности больного. Обычно они незначительные и исчезают после отмены препарата.

*Со стороны 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), депрессия, беспокойство, снижение внимания, сонливость, бессонница, «кошмарные сновидения», спутанность сознания или кратковременное нарушение памяти, мышечная слабость.

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

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* синусовая брадикардия, сердцебиение, снижение артериального давления, ортостатическая гипотензия, головокружение, иногда потеря сознания). Редко – снижение сократимости миокарда, временное усугубление симптомов хронической сердечной недостаточности (отеки, отечность стоп и/или нижней части голени, одышка), аритмии, проявление ангиоспазма (усиление нарушения периферического кровообращения, похолодание нижних конечностей, синдром Рейно), нарушение проводимости миокарда.

*Со стороны пищеварительной системы:* тошнота, рвота, боль в животе, сухость во рту, диарея, запор, изменение вкуса, нарушение функции печени.

*Со стороны кожных покровов:* крапивница, кожный зуд, сыпь, обострение псориаза, псориазоподобные кожные реакции, гиперемия кожи, экзантема, фотодерматоз, усиление потоотделения, обратимая алопеция.

*Со стороны дыхательной системы:* заложенность носа, затруднение выдоха (бронхоспазм при назначении в высоких дозах – утрата селективности и/или у предрасположенных пациентов), одышка.

*Со стороны эндокринной системы:* гипергликемия у больных инсулиннезависимым сахарным диабетом,

гипотиреоз.

*Лабораторные показатели:* редко – тромбоцитопения (необычные кровотечения и кровоизлияния), агранулоцитоз, лейкопения, повышение активности «печеночных ферментов», крайне редко – гипербилирубинемия.

*Влияние на плод:* возможна внутриутробная задержка роста, гипогликемия, брадикардия.

*Прочие:* боль в спине или суставах, как и все бета-блокаторы в единичных случаях может вызывать незначительное увеличение массы тела, снижение либидо и/или потенции.

## **ПЕРЕДОЗИРОВКА**

*Симптомы:* выраженная тяжелая синусовая брадикардия, головокружение, тошнота, рвота, цианоз, выраженное снижение артериального давления, аритмия, желудочковая экстрасистолия, бронхоспазм, обморок, при острой передозировке – кардиогенный шок, потеря сознания, кома, атриовентрикулярная блокада (вплоть до развития полной поперечной блокады и остановки сердца), кардиалгия.

Первые признаки передозировки проявляются через 20 мин – 2 час после приема препарата.

*Лечение:* промывание желудка и назначение адсорбирующих средств; симптоматическая терапия: при выраженном снижении артериального давления – больной должен находиться в положении Тренделенбурга; в случае чрезмерного снижения артериального давления, брадикардии и сердечной недостаточности – в/в, с интервалом в 2-5 мин, бета-адреностимуляторы – до достижения желаемого эффекта или в/в 0,5 – 2 мг атропина сульфата.

При отсутствии положительного эффекта – допамин, добутамин или норэпинефрин (норадреналин).

В качестве последующих мер, возможно, назначение 1 – 10 мг глюкагона, постановка трансвенозного интракардиального электростимулятора.

При бронхоспазме следует ввести в/в стимуляторы бета-2-адренорецепторов.

Метопролол плохо выводится с помощью гемодиализа.

## **ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ**

*Не рекомендуется одновременное применение с ингибиторами MAO* вследствие значительного усиления гипотензивного действия. Перерыв в лечении между приемом ингибиторов MAO и метопролола должен составлять не менее 14 дней.

*Одновременное в/в введение верапамила* может спровоцировать остановку сердца.

*Одновременное назначение нифедипина* приводит к значительному снижению артериального давления.

*Средства для ингаляционной общей анестезии* (производные углеводородов) повышают риск угнетения функции миокарда и развития артериальной гипотензии.

*Бета-адреностимуляторы, теофиллин, кокаин, эстрогены (задержка натрия), индометацин и другие нестероидные противовоспалительные препараты* (задержка натрия и блокирование синтеза простагландина почками) ослабляют гипотензивный эффект.

*Отмечается усиление угнетающего действия на центральную нервную систему* – с эталонном; суммация кардиодепрессивного эффекта – со средствами для общей анестезии; увеличение риска нарушений периферического кровообращения – с алкалоидами спорыньи.

*При совместном приеме с гипогликемическими средствами* для приема внутрь возможно снижение их эффекта; с инсулином – повышение риска развития гипогликемии, усиление ее выраженности и удлинение, маскировка некоторых симптомов гипогликемии (тахикардия, потливость, повышение артериального давления).

*При сочетании с гипотензивными средствами, диуретиками, нитроглицерином или блокаторами медленных кальциевых каналов* может развиться резкое снижение артериального давления (особая осторожность необходима при сочетании с празозином); увеличение выраженности урежения частоты сердечных сокращений и угнетение атриовентрикулярной проводимости – при применении метопролола с верапамилем, дилтиаземом, антиаритмическими средствами (амиодарон), резерпином, альфа-метилдопой, клонидином, гуанфацином, средствами для общей анестезии и сердечными гликозидами.

*Если метопролол и клонидин принимают одновременно*, то при отмене метопролола клонидин отменяют через несколько дней (в связи с риском возникновения синдрома «отмены»).

*Индукторы микросомальных ферментов печени (рифампицин, барбитураты) приводят к усилению метаболизма метопролола, к снижению концентрации метопролола в плазме крови и уменьшению эффекта. Ингибиторы (циметидин, пероральные контрацептивы, фенотиазины) – повышают концентрацию в плазме.*

*Аллергены, используемые для иммунотерапии или экстракты аллергенов для кожных проб при совместном применении с метопрололом, повышают риск возникновения системных аллергических реакций или анафилаксии; йодсодержащие рентгеноконтрастные вещества для в/в введения повышают риск развития анафилактических реакций.*

*Снижает клиренс ксантина (кроме дифиллина), особенно с исходно повышенным клиренсом теофиллина под влиянием курения. Снижает клиренс лидокаина, повышает концентрацию лидокаина в плазме крови.*

*Усиливает и пролонгирует действие антидеполяризующих миорелаксантов; удлиняет антикоагулянтный эффект кумаринов.*

*При совместном применении с этанолом увеличивается риск выраженного снижения АД.*

*Три- и тетрациклические антидепрессанты, антипсихотические ЛС (нейролептики), седативные и снотворные ЛС усиливают угнетение ЦНС.*

## **ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ**

Контроль за больными, принимающими бета-адреноблокаторы, включает регулярное наблюдение за частотой сердечных сокращений (ЧСС) и артериальным давлением, содержанием глюкозы крови у больных сахарным диабетом. При необходимости, для больных сахарным диабетом, дозу инсулина или гипогликемических средств, назначаемых внутрь, следует подобрать индивидуально. Следует обучить больного методике подсчета ЧСС и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при ЧСС менее 50 уд/мин. При приеме дозы выше 200 мг в сутки уменьшается кардиоселективность.

*При сердечной недостаточности лечение метопрололом начинают только после достижения стадии компенсации.*

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

*Может усилить симптомы нарушения периферического артериального кровообращения. Отмену препарата проводят постепенно, сокращая дозу в течение 10 дней.*

*При резком прекращении лечения может возникнуть синдром «отмены» (усиление приступов стенокардии, повышения артериального давления). Особое внимание при отмене препарата необходимо уделять больным стенокардией.*

*При стенокардии напряжения подобранная доза препарата должна обеспечивать частоту сердечных сокращений в покое в пределах 55-60 уд/мин, при нагрузке – не более 110 уд/мин.*

*Больные, пользующиеся контактными линзами, должны учитывать, что на фоне лечения бета-адреноблокаторами возможно уменьшение продукции слезной жидкости.*

*Метопролол может маскировать некоторые клинические проявления гипертиреоза (например, тахикардию). Резкая отмена у больных с тиреотоксикозом противопоказана, поскольку способна усилить симптоматику.*

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

*При необходимости назначения 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 средства для общей анестезии с минимальным*



отрицательным инотропным действием), отмена препарата не рекомендуется.

*Препараты, снижающие запасы катехоламинов* (например, резерпин), могут усилить действие бета-адреноблокаторов, поэтому больные, принимающие такие сочетания препаратов, должны находиться под постоянным наблюдением врача на предмет выявления чрезмерного снижения артериального давления и брадикардии.

*У пожилых пациентов* – рекомендуется регулярно осуществлять контроль функции печени. Коррекция режима дозирования требуется только в случае появления у больного пожилого возраста нарастающей брадикардии (менее 50 уд/мин), выраженного снижения АД (систолическое артериальное давление ниже 100 мм рт. ст.), атриовентрикулярной блокады, бронхоспазм, желудочковых аритмий, тяжелых нарушений функции печени, иногда необходимо прекратить лечение.

*Пациентам с тяжелой почечной недостаточностью* рекомендуется осуществлять контроль функции почек. Следует проводить особый контроль за состоянием больных с депрессивными расстройствами, принимающими метопролол; в случае развития депрессии, вызванной приемом бета-адреноблокаторов, рекомендуется прекратить терапию.

*Из-за отсутствия достаточного количества клинических данных препарат не рекомендуется применять у детей.*

#### **Влияние на способность управлять транспортными средствами и сложной техникой**

В начале лечения метопрололом больные могут испытывать головокружение, усталость. В этом случае они должны воздержаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций. В дальнейшем определение безопасности дозы осуществляется индивидуально.

---

#### **ФОРМА ВЫПУСКА**

Таблетки 50 мг и 100 мг.

По 10 таблеток в блистер из фольги AL/PVC.

3 блистера вместе с Инструкцией по применению помещают в картонную пачку.

#### **УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ**

В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

#### **СРОК ГОДНОСТИ**

3 года. Не использовать позже срока, указанного на упаковке.

#### **УСЛОВИЯ ОТПУСКА**

По рецепту.

#### **ПРОИЗВОДИТЕЛЬ**

Фармацевтический завод «Польфарма» АО

ул. Пельплиньска 19, 83-200 Старогард Гданьски, Польша

#### **ОРГАНИЗАЦИЯ, ПРИНИМАЮЩАЯ ПРЕТЕНЗИИ ПОТРЕБИТЕЛЕЙ**

ОАО «Химико-фармацевтический комбинат «АКРИХИН»

142450, Московская область, Ногинский район, г. Старая Купавна, ул. Кирова, 29

Тел. (495) 702 95 06;

факс (495) 702 95 03