

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата для медицинского применения
Беталок®
наименование лекарственного препарата

Регистрационный номер: ЛСР-001402/07
Торговое название: Беталок®
Международное непатентованное название: метопролол
Лекарственная форма: раствор для внутривенного введения

Состав

1 мл раствора содержит
Активное вещество: 1 мг метопролола тартрата для инъекций
Вспомогательные вещества: натрия хлорид для инъекций 9 мг, вода для инъекций до 1 мл.

Описание

Прозрачная, бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: бета 1-адреноблокатор селективный.

Код АТХ - C07 A B02

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика

У пациентов с инфарктом миокарда внутривенное введение метопролола уменьшает боль в груди и снижает риск развития мерцания и трепетания предсердий. Внутривенное введение метопролола при первых симптомах (в течение 24 часов после появления первых симптомов) снижает риск развития инфаркта миокарда. Раннее начало лечения метопрололом приводит к улучшению дальнейшего прогноза лечения инфаркта миокарда. Достигается уменьшение частоты сердечных сокращений (ЧСС) при пароксизмальной тахикардии и мерцании (трепетании) предсердий.

Метопролол – β_1 -адреноблокатор, блокирующий β_1 -рецепторы в дозах значительно меньших, чем дозы, требующиеся для блокирования β_2 -рецепторов. Метопролол обладает незначительным мембраностабилизирующим действием и не проявляет активности частичного агониста. Метопролол снижает или ингибирует агонистическое действие, которое оказывают на сердечную деятельность катехоламины, образующиеся при нервных и физических стрессах. Это означает, что метопролол обладает способностью препятствовать увеличению частоты сердечных сокращений, минутного объема и усилению сократимости миокарда, а также подъёму артериального давления (АД), вызываемых резким выбросом катехоламинов.

Пациентам с симптомами обструктивных заболеваний легких при необходимости можно назначать метопролол в сочетании с β_2 -адреномиметиками. При совместном использовании с β_2 -адреномиметиками Беталок®, 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 обмен. Влияние препарата Беталок® на реакцию сердечно-сосудистой системы в условиях гипогликемии значительно менее выражено по сравнению с неселективными β -адреноблокаторами.

Улучшение качества жизни при лечении препаратом Беталок® наблюдали у пациентов после инфаркта миокарда.

Фармакокинетика

Метопролол подвергается окислительному метаболизму в печени с образованием трех основных метаболитов, ни один из которых не обладает клинически значимым β -блокирующим эффектом.

Около 5% от принятой дозы выводится с мочой в неизменном виде.

Средний период полувыведения метопролола из плазмы крови составляет около 3-5 часов.

Показания к применению

- Наджелудочковая тахикардия.
- Профилактика и лечение ишемии миокарда, тахикардии и боли при инфаркте миокарда или подозрении на него.

Противопоказания

Атриовентрикулярная блокада II и III степени, сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, постоянная или интермиттирующая терапия инотропными средствами, действующими как бета-адреномиметики, клинически значимая синусовая брадикардия, синдром слабости синусового узла (за исключением пациентов с постоянным водителем ритма), кардиогенный шок, тяжелые нарушения периферического кровообращения, в том числе и при угрозе гангрены, артериальная гипотензия.

Беталок® 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.

Известная повышенная чувствительность к метопрололу и его компонентам или к другим β -адреноблокаторам.

При лечении суправентрикулярной тахикардии у пациентов с систолическим артериальным давлением менее 110 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).

С осторожностью: атриовентрикулярная блокада I степени, стенокардия Принцметала, хроническая обструктивная болезнь легких (эмфизема легких, хронический обструктивный бронхит, бронхиальная астма), сахарный диабет, тяжелая почечная недостаточность.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Как и большинство препаратов, Беталок® не следует назначать во время беременности и в период грудного кормления, за исключением тех случаев, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. β -адреноблокаторы уменьшают плацентарный кровоток, что может приводить к задержке внутриутробного развития, внутриутробной гибели плода, самопроизвольному выкидышу и преждевременным родам. В случае применения препарата Беталок® во время беременности рекомендуется проводить соответствующее наблюдение за состоянием пациентки и плода. Как и другие гипотензивные средства, β -адреноблокаторы могут вызывать побочные эффекты, например, брадикардию у плода, новорожденных или детей, находящихся на грудном вскармливании, в связи с чем следует быть особенно осторожными при назначении β -адреноблокаторов в последний триместр беременности и непосредственно перед родами.

Период грудного вскармливания

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

Способ применения и дозы

Наджелудочковая тахикардия

Начинают введение с 5 мг (5 мл) препарата Беталок® со скоростью 1-2 мг/мин. Можно повторить введение с 5 минутным интервалом до достижения терапевтического эффекта. Обычно суммарная доза составляет 10-15 мг (10-15 мл). Рекомендуемая максимальная доза при внутривенном введении составляет 20 мг (20 мл).

Профилактика и лечение ишемии миокарда, тахикардии и боли при инфаркте миокарда или подозрении на него

Внутривенно 5 мг (5 мл) препарата. Можно повторить введение с 2 минутным интервалом, максимальная доза – 15 мг (15 мл). Через 15 минут после последней инъекции назначают метопролол для приёма внутрь в дозе 50 мг (Беталок®) каждые 6 часов в течение 48 часов.

Нарушение функции почек

Нет необходимости корректировать дозы у пациентов с нарушением функции почек.

Нарушение функции печени

Обычно из-за низкой степени связи с белками плазмы, коррекция дозы не требуется. Однако, при тяжелом нарушении функции печени (у пациентов с портокавальным анастомозом) может потребоваться снижение дозы.

Пожилой возраст

Нет необходимости корректировать дозы у пациентов пожилого возраста.

Дети

Опыт применения препарата Беталок® у детей ограничен.

Побочное действие

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

В результате клинических исследований или при применении препарата Беталок® (метопролола тартрат) в клинической практике были описаны следующие нежелательные побочные эффекты. Во многих случаях, причинно-следственная связь с лечением препаратом Беталок® не была установлена. Для оценки частоты случаев применяли следующие критерии:

очень часто (>10%), часто (1-9,9%), нечасто (0,1-0,9%), редко (0,01-0,09%) и очень редко (<0,01%).

Со стороны сердечно-сосудистой системы

Часто: брадикардия, постуральные нарушения (очень редко сопровождающиеся обмороком), чувство похолодания конечностей, ощущение сердцебиения.

Нечасто: временное усиление симптомов сердечной недостаточности, кардиогенный шок у пациентов с острым инфарктом миокарда, атриовентрикулярная блокада I степени, отеки, боли в области сердца.

Редко: другие нарушения проводимости, аритмии.

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

Со стороны центральной нервной системы

Очень часто: повышенная утомляемость.

Часто: головокружение, головная боль.

Нечасто: парестезии, судороги, обострение течения депрессии, снижение концентрации внимания, сонливость или бессонница, ночные кошмары.

Редко: повышенная возбудимость, тревожность.

Очень редко: амнезия/нарушения памяти, состояние подавленности, галлюцинации.

Со стороны пищеварительной системы

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

Нечасто: рвота.

Редко: сухость слизистой оболочки полости рта, нарушения функции печени.

Очень редко: гепатит.

Со стороны кожи и подкожных тканей

Нечасто: сыпь (в виде крапивницы), повышенное потоотделение.

Редко: алопеция.

Очень редко: фотосенсибилизация, обострение течения псориаза.

Со стороны дыхательной системы

Часто: одышка при нагрузке.

Нечасто: бронхоспазм у пациентов с бронхиальной астмой.

Редко: ринит.

Со стороны органов чувств

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

Очень редко: звон в ушах, нарушения вкусовых ощущений.

Со стороны обмена веществ

Нечасто: увеличение массы тела.

Со стороны скелетно-мышечной системы

Очень редко: артралгия.

Со стороны крови

Очень редко: тромбоцитопения.

Прочие

Редко: импотенция/сексуальная дисфункция.

Передозировка

Симптомы

При передозировке могут отмечаться выраженное снижение артериального давления, острая сердечная недостаточность, брадикардия, брадиаритмия, нарушение внутрисердечной проводимости и бронхоспазм.

Лечение

Лечение должно проводиться в медицинском учреждении, располагающем оборудованием и условиями для поддержания жизнедеятельности и мониторинга состояния пациента.

При брадикардии и нарушении проводимости применяют атропин и адреномиметики, при необходимости – устанавливают искусственный водитель ритма.

При выраженном снижении артериального давления, острой сердечной недостаточности и шоке следует проводить терапию, направленную на увеличение объема циркулирующей плазмы крови; применять глюкагон в виде инъекции (затем, при необходимости, вводить глюкагон в виде внутривенной инфузии); внутривенно вводить адреномиметики (такие как добутамин) совместно с α_1 -адреномиметиками в случае появления симптомов вазодилатации. Также возможно внутривенное введение препаратов, содержащих ионы кальция.

Для купирования бронхоспазма следует применять бронходилататоры.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействия

Следует избегать совместного назначения препарата Беталок® со следующими препаратами:

Производные барбитуровой кислоты: барбитураты (исследование проводилось с фенобарбиталом) незначительно усиливают метаболизм метопролола, вследствие индукции ферментов.

Пропафенон: при назначении пропафенона 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.

Данное взаимодействие было подтверждено в ходе исследования на 8 добровольцах. 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 вызывать брадикардию и приводить к снижению АД. Верапамил и β -адреноблокаторы имеют взаимодополняющий ингибирующий эффект на атриовентрикулярную проводимость и функцию синусового узла.

Комбинация препарата Беталок® со следующими препаратами может потребовать коррекции дозы:

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 атриовентрикулярной проводимости. Взаимодействие описано на примере дизопирамида.

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.

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

Нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП): НПВП ослабляют антигипертензивный эффект β -адреноблокаторов. Данное взаимодействие наиболее документировано для индометацина. Не отмечено описанного взаимодействия для сулиндака. В исследованиях с диклофенаком описанной реакции не отмечалось.

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

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 гидроксированием (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 приёме β-адреноблокаторов. При совместном применении, в случае отмены клонидина, прекращение приёма β-адреноблокаторов следует начинать за несколько дней до отмены клонидина.

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

Концентрация метопролола в плазме крови может повышаться при сочетанном применении с циметидином, гидралазином, селективными ингибиторами обратного захвата серотонина, такими как пароксетин, флуоксетин и сертралин. Пациенты, одновременно принимающие метопролол и другие β-адреноблокаторы (глазные капли) или ингибиторы моноаминоксидазы (МАО), должны находиться под тщательным наблюдением. На фоне приема β-адреноблокаторов ингаляционные анестетики усиливают кардиодепрессивное действие. На фоне приёма β-адреноблокаторов пациентам, получающим пероральные гипогликемические средства, может потребоваться коррекция дозы последних. Сердечные гликозиды при совместном применении с β-адреноблокаторами могут увеличивать время атриовентрикулярной проводимости и вызывать брадикардию.

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 β₂-адреномиметиками. В случае необходимости следует увеличить дозу β₂-адреномиметика. При применении β₁-адреноблокаторов риск их влияния на углеводный обмен или возможность маскировки симптомов гипогликемии значительно меньше, чем при применении неселективных β-адреноблокаторов.

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

Пациентам со стенокардией Принцметала не рекомендуется назначать неселективные β-адреноблокаторы.

Очень редко у пациентов с нарушением атриовентрикулярной проводимости может наступать ухудшение (возможный исход – атриовентрикулярная блокада). Если на фоне лечения развилась брадикардия, дозу препарата Беталок® необходимо уменьшить. Метопролол может усилить нарушение периферического артериального кровообращения в основном вследствие снижения артериального давления. Следует проявлять осторожность при назначении препарата пациентам с тяжелой почечной недостаточностью, при метаболическом ацидозе, совместном назначении с сердечными гликозидами. У пациентов, принимающих β-адреноблокаторы, анафилактический шок протекает в более тяжелой форме. Пациентам с феохромоцитомой одновременно с препаратом Беталок® следует назначать альфа-адреноблокаторы. В случае хирургического вмешательства следует проинформировать хирурга/анестезиолога, что пациент принимает β-адреноблокатор. Не рекомендуется отменять терапию β-адреноблокатором перед проведением операции. У пациентов с факторами риска развития сердечно-сосудистых заболеваний, следует избегать назначения высоких доз метопролола, без предварительной титрации дозы при хирургических вмешательствах (за исключением операций на сердце), из-за риска развития брадикардии, артериальной гипотензии и инсульта, в том числе с летальным исходом.

В случае, если систолическое артериальное давление ниже 100 мм рт. ст., Беталок® должен вводиться внутривенно только при соблюдении специальных мер предосторожности из-за риска развития более выраженного снижения артериального

давления (например, у пациентов с аритмиями).

При лечении пациентов с инфарктом миокарда или подозрении на него необходимо оценивать основные параметры гемодинамики после каждого введения препарата в дозе 5 мг (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Не следует назначать повторную дозу – вторую или третью при частоте сердечных сокращений менее 40 уд/мин, интервале PQ более 0,26 сек. и систолическом артериальном давлении менее 90 мм рт. ст., а также при усилении одышки или появлении холодного пота.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и другими механизмами

Оценка влияния препарата Беталок® при внутривенном введении на способность управлять транспортными средствами и другими механизмами не изучалась.

Форма выпуска

Раствор для внутривенного введения 1 мг/мл. По 5 мл в ампулы из бесцветного боросиликатного стекла с насечкой. 5 ампул в пластиковом фиксаторе в картонной пачке с инструкцией по применению.

На ампуле выше насечки нанесена цветная точка, поставленная краской; над точкой нанесены два цветных кольца.

Условия хранения

В защищенном от света месте, при температуре ниже 25°C. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет. Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Наименование и юридический адрес держателя (владельца) регистрационного удостоверения

АстраЗенека АБ, SE-151 85 Содерталье, Швеция
AstraZeneca AB, Sweden, SE-151 85 Sodertalje, Sweden

Производитель, фасовщик (первичная упаковка), упаковщик (вторичная (потребительская) упаковка), выпускающий контроль качества

Сенекси, 52 Ру Марсель э Жак Гоше, 94120 Фонтеней су Буа, Франция
Senexi, 52 Rue Marcel et Jacques Gaucher, 94120 Fontenay sous Bois, France

Наименование, адрес организации, уполномоченной держателем или владельцем регистрационного удостоверения лекарственного препарата для медицинского применения на принятие претензий от потребителя:

Представительство компании АстраЗенека ЮК Лимитед, Великобритания, в г. Москве и
ООО АстраЗенека Фармасьютикалз
125284 Москва, ул. Беговая д. 3, стр. 1
тел. +7495 7995699
факс +7495 7995698

Беталок – товарный знак, собственность группы компаний АстраЗенека.

© AstraZeneca 2018