

BETALOC® ZOC

50, 100 и 200 мг ТАБЛЕТИ

Таблети с контролирано излъчване

Състав

Всяка таблетка съдържа Метопролол сукцинат 47.5 мг, 95 мг и 190 мг, отговарящи съответно на 50, 100 и 200 мг метопролол тартарат

Описание

Метопролол е предимно β_1 - рецепторен блокатор (кардиоселективен) без β -стимулаторно действие и мембрано-стабилизиращ ефект. Ето защо метопролол представлява β - блокатор, подходящ за лечение на хипертония, ангина пекторис, сърдечна аритмия, инфаркт на миокарда, функционални сърдечни смущения със сърцебиене и профилактика на мигрена. Метопролол осигурява значително спадане на кръвното налягане при пациенти с хипертония както в легнало, така и в изправено положение. Не се наблюдават позиционна хипотония или нарушения на електролитния баланс.

Метопролол подтиска сърдечните ефекти на повишената симпатична активност, което преди всичко означава намален автоматизъм на пейсмейкърните клетки и намаляване скоростта на суправентрикуларното провеждане. По този начин метопролол контролира сърдечния ритъм при суправентрикуларна тахикардия. При пациенти с артериални фебрилации или атриални пристъпи метопролол намалява вентрикуларния пулс. Доказано е също, че метопролол намалява честотата на вентрикуларните ектопични удари.

Доказано е, че метопролол намалява смъртността при пациенти със съмнение за инфаркт на миокарда или доказан такъв. Не е напълно изяснен механизъм на действие при тези ефекти на метопролол, но те може да се дължат на по-редките вентрикуларни фебрилации, спиране развитието на инфаркта и ограничаване на размера му. Тези противоисхемични ефекти на метопролол са свързани също с намаляване на болките в гърдите през острия стадий на инфаркта. Демонстрирано е също намаляване на процента на повторни инфаркти на миокарда при употреба на метопролол. При пациенти с функционални сърдечни смущения със сърцебиене като основен симптом, което може да се дължи на засилена симпатична активност, метопролол е ефективен за намаляване на сърцебиенето и подобряване общото състояние на пациента.

Метопролол има и профилактичен ефект за лечение на мигрена.

В терапевтични дози метопролол има по-слабо изразен свиващ ефект върху периферните кръвоносни съдове и бронхиоли от неселективните β -блокери. Ето защо метопролол може да се дава на пациенти с обструктивни белодробни заболявания. Понякога след приемане на метопролол може да се затрудни дишането. За разлика от случаите на лечение с неселективни β -блокери, всяко затруднение на дишането може да се овладее чрез прибавяне на β_2 -стимулатор към лечението с метопролол. Метопролол влияе по-малко от неселективните β -блокери

върху излъчването на инсулин и въглехидратния метаболизъм. Той не променя значително сърдечно-съдовата реакция на хипогликемия, нито удължава времето за възстановяване след хипогликемичен пристъп. Ето защо метопролол може да се дава на пациенти с диабетес мелитус. Таблетата BETALOC ZOC (с контролирано излъчване) е система от няколко стотин микрогранули метопролол сукцинат с покритие. Всяка гранула е покрита с полимерна мембрана, която контролира излъчването на лекарството. Таблетата се разпада бързо във водна среда и гранулите могат да се разпръснат по голяма площ в стомашно-чревния тракт. Излъчването на метопролол от гранулите не зависи от физиологични фактори като pH и продължава с почти постоянна скорост 20 часа. Тъй като метопролол се абсорбира добре по целия стомашно-чревен тракт, таблетите с контролирано излъчване осигуряват равномерни плазмени концентрации в продължение на 24 часа, като по този начин се избягват резки скокове и спадове в плазмените нива. BETALOC ZOC осигурява по-равномерен профил на ефекта в продължение на 24 часа и повишена степен на β_1 -селективност в сравнение с обикновените таблетни форми на β_1 -селективните блокери с краткотрайно и дълготрайно действие.

Показания

Хипертония, ангина пекторис, нарушения на сърдечния ритъм, включително и суправентрикуларна тахикардия, поддържаща терапия при инфаркт на миокарда, функционални сърдечни смущения със сърцебиене, профилактика на мигрена.

Противопоказания

Атриовентрикуларен блок от втора или трета степен, некомпенсиран сърдечен синкоп, изявена клинично значима синусна брадикардия, синдром на болен синус, кардиогенен шок, остри циркулаторни смущения в периферните артерии.

Поради липса на опит метопролол не се препоръчва при пациенти с инфаркт на миокарда с пулс < 45 удара/мин, P-Q интервал > 0.24 сек, систолично кръвно налягане < 100 мм Hg и/или остър синкоп.

Известна свръхчувствителност на метопролол и неговите деривати.

Предупреждения

Обикновено при лечение на пациенти с хипертония с астма трябва да се назначи съпътстващо лечение с β_2 - стимулатор (таблети или аерозол).

Може да се наложи да се регулира дозата на β_2 - стимулатора при започване на лечение с BETALOC ZOC. Опасността обаче BETALOC ZOC да повлияе на β_2 - рецепторите е по-малка, отколкото при конвенционални таблетни форми на β_1 - селективни β - блокери. При лечение с BETALOC ZOC опасността от повлияване на въглехидратния метаболизъм или маскиране на хипогликемия изглежда по-малка отколкото при лечение с конвенционални таблетни форми на β_1 - селективни β - блокери и много по-малка отколкото при неселективни β - блокери.

Пациенти, страдащи от синкоп трябва да се лекуват за декомпенсацията както преди, така и по време на лечението с BETALOC ZOC.

Много рядко може да се отежни съществуващо средно по сила смущение на А-V проводимостта (евентуално с достигане до А-V блок). BETALOC ZOC може да усилва симптомите на циркулаторни смущения на периферните артерии, главно поради снижаване на кръвното налягане. Когато се предписва BETALOC ZOC на пациент, страдащ от фео-хромоцитомата, едновременно трябва да се назначи α -блокатор. Бионаличността на метопролол може да се повиши при чернодробна цирроза.

Ако пациентът приема BETALOC ZOC, преди операция трябва да се уведоми анестезиолога.

Да се избягва внезапното прекратяване на лечението. Когато е възможно метопролол трябва да се намалява постепенно за 10 дни. По време на намаляване на дозите на β - блокера, особено при пациенти, страдащи от исхемична болест на сърцето, пациентът трябва да бъде под наблюдение. Анафилактичният шок е в по-силна форма при пациенти, приемащи β - блокери.

Използване при бременност и кърмене

Когато е наложително, метопролол може да се използва при бременни и кърмачки. Както всички антихипертензивни лекарства, β - блокерите могат да предизвикат странични ефекти, например брадикардия при зародиша, новороденото или кърмачето. Ако майката се лекува с метопролол в дози в нормалните терапевтични граници, количеството метопролол, приемано с кърмата изглежда незначително по отношение на β - блокерния ефект.

Нежелани ефекти

Централна нервна система: понякога умора, замаяване, главоболие. Рядко парестезия, мускулни крампи.

Сърдечно-съдова система: понякога брадикардия, смущения при движение (поякога със синкоп).

Рядко синкоп, сърцебиене, сърдечна аритмия, болест на Рейно, едем, болки в предсърдието.

В изолирани случаи нарушение на сърдечната проводимост, ганирена при пациенти с остри периферни циркулаторни смущения.

Психиатрични: рядко депресия, понижено внимание, сънливост или безсъние, кошмари.

В редки случаи личностни смущения.

Стомашно-чревен тракт: понякога гадене и повръщане, болки в стомаха. Рядко диария или запек.

В изолирани случаи изсъхване на устата, аномалии в чернодробните показатели.

Кожа: рядко обриви (под формата на уртикария псориазиформ и дистрофични кожни рани).

В изолирани случаи чувствителност на светлина, изпотяване и косяпад.

Дихателни органи: понякога задъхване при усилие.

Рядко бронхоспазъм, също и при пациенти без известни обструктивни белодробни заболявания.

В редки случаи ринит.

Възприятия: В изолирани случаи зрителни смущения, изсъхване или дразнене в очите, конюнктивит, бучене в ушите.

Метаболизъм: в изолирани случаи напъняване.

Кръв: в изолирани случаи тромбоцитопения.

Дозировка и приложение

BETALOC ZOC е предназначен за приемане веднъж дневно и за предпочитане се приема със закуската.

Хипертония

Обикновено се дават 100 мг като еднократна доза. При някои случаи дозата може да се увеличи, и да се добавят други хипотензивни лекарства.

Ангина пекторис

100-200 мг като еднократна доза. Дозата може да се увеличи при тежки случаи.

Сърдечна аритмия

100-200 мг като еднократна доза. Дозата може да се увеличи при необходимост.

Инфаркт на миокарда

Поддържаща терапия

Оралната поддържаща доза е обикновено 200 мг еднократно.

Функционални сърдечни смущения със сърцебиене

100 мг дневно като еднократна доза. Дозата може да се увеличи при необходимост.

Профилактика на мигрена

100-200 мг като еднократна доза.

Таблетите BETALOC ZOC и половинките им не трябва да се дъвчат или стриват. Трябва да се приемат с точности.

Несъвместимости

Не са известни.

Взаимодействия

Пациенти, приемащи едновременно симпатетични блокери, други β - блокери (например капки за очи) или MAO-инхибитори трябва да бъдат под наблюдение.

Ако се спира съпътстващо лечение с клонидин, β - блокерът трябва да се спре няколко дни преди клонидина.

Трябва да се внимава за възможни нежелани инотропни и хронотропни ефекти, когато метопролол се приема едновременно с калциев антагонист и/или медикаменти против аритмия, особено след венозно прилагане на калциеви антагонисти от верапамилев тип.

Бета-блокерите могат да засилят отрицателно-инотропните и отрицателно-дромотропните ефекти на медикаментите против аритмия (от кинидинов тип или амиодарон).

При пациенти на β - блокерна терапия, инхалационните анестетици засилят кардиоподтискащия ефект.

Ензим-индуциращите и ензим-инхибиращите субстанции могат да окажат влияние върху плазмените нива на метопролол. Плазмените концентрации

на метопролол се понижават от рифампицин и може да се повишат от циметидин.

Едновременното лечение с индометацин може да намали антихипер-тоничното действие на β - блокерите.

Може да се наложи промяна в дозировката на оралните противодиабетни лекарства при пациенти, приемащи β - блокерите.

Метопролол може да намали клирънса на други лекарства (например линокаин).

Предозиране

Признаци и симптоми

Направянето при предозиране на метопролол може да доведе до остра хипотония, синусна брадикардия, атриовентрикуларен блок, синкоп, кардиогенен шок, спиране на сърцето, бронхоспазъм, загуба на съзнание (и дори кома), гадене, повръщане и цианоза.

Едновременното приемане на алкохол, антихипертензици, кинидин или барбитурати може да засили признаците и симптомите.

Първите признаци на предозиране могат да се наблюдават от 20 мин до 2 часа след приемане.

Лечение

Предизвикване на повръщане и стомашна промивка. При наличие на остра хипотония, брадикардия и опасност от синкоп, поставяйте β_1 -стимулатор (например преналтерол) венозно през интервали от 2-5 мин до постигане на желания ефект. Когато не разполагате с β_1 - стимулатор, поставете венозно атропин сулфат за да блокирате нервус вагус.

Ако не постигнете задоволителен ефект, можете да поставите медикаменти като допамин, добутамин, метараминол или норадrenalин. Може да се постави също глюкагон в дози 1-10 мг. Може да е необходим пейсмейкър. За овладяване на бронхоспазъма може да се постави венозен β_2 - стимулатор.

Обърнете внимание, че необходимите дози на антидотите са много по-високи от препоръчаните терапевтични дози.

Съхранение

Съхранявайте при стайна температура.