

## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

**VASOCARDIN® 50**  
**VASOCARDIN® 100**

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към 11-13048, 11-13049 разрешение за употреба № 14.05.06	
695/25.04.06	<i>Менц</i>

### 1. Търговско име на лекарствения продукт

**VASOCARDIN® 50**

**VASOCARDIN® 100**

### 2. Количествен и качествен състав

**Лекарствено вещество:**

**VASOCARDIN® 50:** Metoprolol tartrate 50 mg в 1 таблетка

**VASOCARDIN® 100:** Metoprolol tartrate 100 mg в 1 таблетка

### 3. Лекарствена форма

Таблетки

*Външен вид:*

**VASOCARDIN® 50:** бели до светло кремави плоски таблетки с мозайка и делителна черта

**VASOCARDIN® 100:** бели до светло кремави плоски таблетки с мозайка и делителна черта

### 4. Клинични данни

#### 4.1. Показания

- лека до средна степен на есенциална хипертония
- ангина пекторис
- коронарна болест на сърцето след миокарден инфаркт
- някои надкамерни и камерни тахиаритмии
- тахикардия при пациенти с тиреотоксикоза
- профилактика на мигрена



#### 4.2. Дозировка и начин на приложение

##### Дозировка при възрастни:

- При лечение на *хипертония* обикновено се започва с дневна доза от 100 mg метопролол, разделена на две отделни дози. Тази доза може да се увеличава със 100 mg седмично по време на лечението до достигане на желания ефект. Не трябва да се надвишава максималната дневна доза от 450 mg метопролол. При повечето пациенти дневната доза от 100-200 mg, разделена на две отделни дози е достатъчна за достигане на терапевтичен ефект.

- Лечението на *аритмия* трябва да се започне с дневна доза от 2 x 50 mg. В повечето случаи дневната доза от 200 mg метопролол е достатъчна.

- При *профилактика на ангина пекторис* се предписва 50-100 mg метопролол 2 пъти дневно. Дозата може да се увеличи до 100 mg два пъти дневно.

- При *вторична профилактика на остър миокарден инфаркт* обичайната дозировка е 50-100 mg два пъти дневно.

- При тахикардия при пациенти с *хипертироидизъм* обичайната доза е 50-100 mg 2 пъти дневно. Дозата може да се увеличи до максималната дневна доза.

- При *профилактика на мигрена* се приемат 100-200 mg метопролол, разделени на две отделни дози.

- При *пациенти в напреднала възраст* дозата на метопролол трябва да се определи индивидуално с оглед на потенциална брадикардия или значително понижаване на кръвното налягане.

- При тежка чернодробна дисфункция, дозировката трябва да се намали в съответствие със степента на метаболитни промени.

##### Деца:

Този лекарствен продукт не трябва да се предписва на деца, поради недостатъчен клиничен опит.

##### Начин на приложение

Таблетките се вземат по едно и също време, най-добре по време на хранене, с малко количество течност.



### **4.3. Противопоказания**

Лекарственият продукт не трябва да се използва в следните случаи:

- свръхчувствителност към лекарственото вещество или към някое от помощните вещества,
- едновременно лечение с верапамил (по-специално i.v. приложение), поради опасност от внезапно спиране на сърцето,
- втора и трета степен на атрио-вентрикуларен блок,
- синдром на болния синусов възел,
- субоптимален контрол на сърдечната недостатъчност,
- изявена брадикардия преди започване на лечението,
- тежки нарушения на периферното кръвообръщение, свързани с болка или трофични промени,
- хипотония.

### **4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения при употреба**

• Употребата на метопролол при хронична обструктивна белодробна болест може да засили дихателната резистентност (особено при дози надвишаващи 200 mg). При пациенти с бронхоспазм не трябва да се прилагат бета-блокери. С оглед на относителната бета<sub>1</sub>-селективност, метопролол трябва да се прилага внимателно при пациенти с непоносимост или неповлияващи се от други антихипертензивни средства. Тъй като бета<sub>1</sub> – селективността не е абсолютна, трябва да се предписват бета<sub>2</sub>-адренергични агонисти, едновременно с възможно най-ниската доза метопролол (до 200 mg). В случай, че по време на лечението пациентът развие диспнея или бронхоспазм, лечението трябва да се прекрати и да се назначи агонист на бета<sub>2</sub>-рецепторите.

• В случай на инсулинозависим диабет, антидиабетното лечение трябва да се съобрази с лечението с метопролол и диабетикът трябва да бъде информиран за потенциалния риск от маскиране на хипогликемия, която се проявява само с увеличено потоотделяне.

• При дневни дози надвишаващи 200 mg се появява отсъствие на кардиоселективност.

• Лечението с метопролол се спира постепенно за период от 1-2 седмици, при което дневната доза се намалява постепенно. В противен случай може да настъпи влошаване на заболяването (рибаунд-феномен).



- Анестезиологът трябва да бъде информиран за лечението с метопролол преди оперативна интервенция, за да използва анестезия с най-ниския възможен отрицателен инотропен ефект.

- При феохромоцитом, метопролол може да се използва само след започнало вече лечение с алфа-адренергичен блокер.

- Особено внимание е необходимо, когато метопролол се прилага при пациенти със сърдечна недостатъчност. Инхибирането на бета-адренергичните рецептори е свързано с потенциален риск от по-нататъшно намаляване на миокардния контрактилитет и влошаване на съществуваща сърдечна недостатъчност.

- Съотношението риск/полза трябва да се преценява внимателно при пациенти с миастения гравис, псориазис и депресия.

- Vasocardin таблетки съдържат лактоза, ето защо пациенти с редки наследствени проблеми на галактозна непоносимост, Лапландска лактазна недостатъчност или глюкозо-галактозна малабсорбция, не трябва да приемат този лекарствен продукт.

#### 4.5. Лекарствени и други взаимодействия

- Едновременно приемане на метопролол с други антихипертензивни агенти може да доведе до значително понижаване на кръвното налягане (особено внимание е необходимо при комбинирана употреба с празозин).

- В комбинация с антиаритмици или анестетици влошава импулсната сърдечна проводимост.

- Едновременната употреба с верапамил е противопоказана, поради възможно внезапно спиране на сърцето.

- Рифампицин, барбитурати и други ензимни индуктори намаляват плазмените нива на метопролол.

- Едновременна употреба на алкохол води до увеличаване плазмените нива на алкохола и удължаване на неговото действие.

- Лечението с бета-адренергични блокери трябва да бъде прекъснато няколко дни преди насроченото спиране на лечението с клонидин.

- Циметидин потенцира действието на метопролол.

- Нестероидните противовъзпалителни средства намаляват антихипертензивното действие на метопролол.

- Едновременната употреба на MAO – инхибитори може да доведе до хипертонична криза при прекъсване на лечението.



#### 4.6. Бременност и кърмене

Метопролол преминава плацентарната бариера. Поради това, че метопролол преминава в кърмата, кърменето трябва да се прекрати. Този лекарствен продукт не трябва да се използва по време на бременност, освен в случаите, когато неговата употреба не е абсолютно неизбежна.

#### 4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

На основата на фармакодинамичния профил и установените нежелани лекарствени реакции, този лекарствен продукт спада към групата продукти с минимална вероятност за въздействие върху активното внимание.

#### 4.8. Нежелани лекарствени реакции

Употребата на метопролол може да се свърже с появата на следните нежелани лекарствени реакции:

- ЦНС: умора, замаяност, парестезия, в редки случаи може да се наблюдават гърчове, нарушения на съня и кошмари.
- Сърдечно-съдова система: най-често наблюдавани са брадикардия, болест на Raynaud's и ортостатична хипотония; в редки случаи палпитации, оток и влошена сърдечна недостатъчност. В изолирани случаи са наблюдавани аритмии и claudicatio intermitens.
- Гастроинтестинален тракт: в изключителни случаи гадене, повръщане, сухота в устата, диария, диспепсия.
- Дихателната система: по-често диспнея при натоварване, в изключителни случаи бронхоспазъм;
- Кожа: алергични кожни реакции се наблюдават в редки случаи. Най-често те включват уртикариална екзема и псориазоподобен обрив. В по-редки случаи са отбелязани косопад и увеличена диафореза.
- Други: импотентност (наблюдава се рядко), шум в ушите, нарушения на зрението, незначително покачване нивото на триглицеридите и холестерола, маскирана хипогликемия.

#### 4.9. Предозиране

Симптоми: гадене, повръщане, цианоза, нарушения на съзнанието, бронхоспазъм, хипотония, синусова брадикардия, атриовентрикуларен блок, сърдечна недостатъчност, кардиогенен шок, внезапно спиране на сърцето.



Лечение: Няма специфичен антидот, лечението на интоксикацията с метопролол е симптоматично.

## **5. Фармакологични свойства**

### **5.1. Фармакодинамични свойства**

Фармакотерапевтична група:

Антихипертензивно средство, бета-блокер

АТС код:

C07AB02

Механизъм на действие: Метопролол е селективен бета<sub>1</sub>-блокер на адренергичните рецептори, на когото липсва симпатикомиметична активност. Блокира специфично действието на катехоламините на ниво бета<sub>1</sub>-адренергични рецептори. Метопролол стабилизира мембраните чрез понижаване на електричната им активност. Забавя скоростта на фазата на нарастване на акционния потенциал, без да повлиява потенциала на покой и продължителността на деполаризация.

Кардиоселективността на метопролол е относителна, т.нар. неспецифична и зависи от съотношението на афинитета на активната субстанция към двата рецепторни типа. При дози надвишаващи 200 mg, метопролол блокира и бета<sub>2</sub> – адренергичните рецептори. Лекарственият продукт понижава кислородната потребност на миокарда при различни степени на натоварване, което стои в основата на положителния ефект при дълготрайното лечение на ангина пекторис (намалява честотата на ангинозните пристъпи). При пациентите с хипертония, метопролол понижава систоличното кръвно налягане главно след натоварване и предпазва от развитие на рефлекторна ортостатична тахикардия. Понижаване на диастоличното налягане се постига след няколкоседмично приложение. Метопролол понижава активността на ренин в плазмата.

### **5.2. Фармакокинетични свойства**

След перорално приложение метопролол се абсорбира бързо и почти пълно от гастроинтестиналния тракт. След приемане на единична доза метопролол, бионаличността е около 50% (достига до 70% след многократно приложение), тъй като метопролол претърпява интензивни метаболитни трансформации в черния дроб до биологично неактивни метаболити. Максимални плазмени концентрации се достигат 1-2 часа след перорално приложение. Плазменият полуживот на метопролол е 3-4 часа и не претърпява промени по време на лечението. Повече от 95% от приетата доза се екскретират във урината, като само 3%



са в непроменена форма. Метопролол преминава плацентарната бариера и се екскретира в кърмата.

### 5.3. Предклинични данни за безопасност

- 4-дневно изследване на токсичността на метопролол при плъхове, на които са приложени дози от 100 mg/kg тегло, не са показали патологично действие.
- Изследвания върху леталната токсичност при плъхове, на които са прилагани дози от 100 mg и 250 mg/kg тегло, не са показали ембриотоксично и тератогенно действие на метопролол. Освен това, постнаталното развитие на поколението не се е повлияло.

## 6. Фармацевтични данни

### 6.1. Списък на помощните вещества и техните количества

Наименование	Количество	
	Vasocardin 50	Vasocardin 100
Lactose	0.02800 g	0.0560 g
Maize starch	0.04850 g	0.0970 g
Microcrystalline Cellulose	0.10400 g	0.2080 g
Aerosil R 972	0.00250 g	0.0050 g
Colloidal Silica dioxide	0.00500 g	0.0100 g
Polyvidone 25	0.00250 g	0.0050 g
Sodium Starch Glycollate	0.00500 g	0.0100 g
Calcium stearate	0.00450 g	0.0090 g

### 6.2. Физико-химични несъвместимости

Неприложимо

### 6.3. Срок на годност

3 години.

### 6.4. Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 25°C. Да се пази от влага и светлина.



#### **6.5. Данни за опаковката**

Блистер (алуминиево фолио, PVC фолио) заедно с указание за употреба, в картонена кутия.

Съдържание на една опаковка:

20, 30 или 50 таблетки

#### **6.6. Препоръки при употреба**

Няма специални препоръки.

#### **7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба**

ZENTIVA, a.s.

Nitrianska 100

920 27 Hlohovec

Slovak Republic

#### **8. Регистрационен номер в регистъра по чр. 28 от ЗЛАХМ**

VASOCARDIN® 50: 20000845

VASOCARDIN® 100: 20000846

#### **9. Дата на първо разрешаване за употреба на лекарствения продукт (подновяване на разрешението)**

VASOCARDIN® 50: 28. 12. 2000 г.

VASOCARDIN® 100: 28. 12. 2000 г.

Дата на последната редакция на текста: 220405

