

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

682/27.07.05

Меср.

1. ТЪРГОВСКО НАИМЕНОВАНИЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Betaloc I.V.
Беталок I.V.

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка ампула от 5 ml съдържа 5 mg metoprolol tartrate

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Инжекционен разтвор.

4. КЛИНИЧНИ ОСОБЕНОСТИ**4.1 Показания**

Контрол на тахикардии, особено надкамерни. Ранното приложение на Betaloc I.V. при пациенти с остър миокарден инфаркт намалява размера на инфарктното огнище и честотата на поява на камерно мъждене. Облекчаването на болковите оплаквания може да намали необходимостта от наркотични аналгетици. При пациенти с остър миокарден инфаркт приложението на Betaloc I.V. намалява смъртността.

4.2 Начин на приложение

Контрол на тахикардии: Първоначално се прилагат 5 mg интравенозно със скорост 1-2 ml за минута. Апликацията може да се повтаря през 5-минутни интервали до постигане на ефект. Обикновено за постигане на ефект е достатъчна кумулативна доза от 10-15 mg. Поради риск от изразено спадане на артериалното налягане интравенозното приложение на Betaloc I.V. при пациенти със систолно артериално налягане под 100 mmHg трябва да се прави внимателно.

По време на анестезия: 2-4 mg бавно интравенозно във фазата на увод в анестезията обикновено са достатъчни за профилактика на аритмиите по време на анестезия. Същата доза може да се прилага и при поява на последните. Може да се инжектира следваща доза от 2 mg до достигане на кумулативна доза от 10 mg.

Миокарден инфаркт:**Ранно приложение**

За постигане на оптимален ефект от интравенозното приложение на Betaloc I.V. подходящите пациентите трябва да бъдат третирани до 12-ия час от появата на болката. Лечението трябва да започне с 5 mg интравенозно на всеки 2 минути до достигане на обща доза от 15 mg или според сърдечната честота и артериалното налягане. Втората и третата доза не бива да се прилагат при достигане на систолно



подбере анестетик със слаб негативен кардиоинотропен ефект, за да се намали риска от миокардна депресия.

Бета-блокери могат да увеличат чувствителността на миокарда срещу алергени и сериозността на анафилактичните реакции.

4.5 Лекарствени и други взаимодействия

Ефектите на Betaloc I.V. за интравенозно приложение и на другите лекарствени продукти с антихипертензивни свойства обикновено са синергични и едновременното приложение на препарата с дихидропиридинови калциеви антагонисти, трициклични антидепресанти, барбитурати и фенотиазини трябва да става внимателно. Нерядко обаче за подобряване на контрола на артериалното налягане при хипертоници се прилага комбинирано лечение.

Betaloc I.V. за интравенозно приложение може да намали миокардния контрактилитет и да забави провеждането на импулса в миокарда. Лекарственият продукт трябва да се прилага внимателно при пациенти, приемащи други лекарства с подобен ефект, като антиаритмични средства или общи анестетици. Подобно на всички β -блокери, Betaloc I.V. за интравенозно приложение не бива да се комбинира с верапамил, дилтиазем или дигиталисови гликозиди. При комбинирано лечение с калциеви антагонисти трябва да се следи за поява на нежелани странични ефекти, тъй като това може да доведе до поява на брадикардия, хипотония и асистолия. Бета-блокери трябва да се прилагат внимателно при лечение със симпатикомиметични ганглиоблокери, други бета-блокери (например капки за очи) и MAO-инхибитори.

При спиране на лечение с клонидин, Betaloc I.V. за интравенозно приложение трябва да се спре няколко дни преди спиране на клонидина.

Тъй като β -блокери повлияват периферните артериални съдове, Betaloc I.V. за интравенозно приложение трябва да се прилага внимателно при лечение с други лекарствени продукти с подобен ефект.

Betaloc I.V. за интравенозно приложение антагонизира ефекта на β_1 симпатикомиметиците, но (в терапевтични дози) слабо повлиява бронходилататорния ефект на β_2 агонистите. Ензимните индуктори (например рифампицин) намаляват плазмените нива на Betaloc I.V. за интравенозно приложение, а ензимните инхибитори (като симетидин, алкохол и хидралазин) увеличават неговите плазмени нива. Metoprolol може да намали елиминирането на лидокаина (лигнокаин).

При лечение с β -блокери може да се наложи промяна в пероралната антидиабетна терапия или в инсулинолечението при диабетици.



Едновременното лечение с индометацин и други инхибитори на простагландиновата синтеза може да намали антихипертензивния ефект на β -блокериите.

4.6 Бременност и лактация

Betaloc I.V. не трябва да се прилага при бременност и кърмене, освен ако според преценката на лекаря ползата от терапията не надхвърля рисковете за ембриона/плода. β -блокериите намаляват перфузията на плацентата, което може да доведе до интраутеринна смърт на плода, раждане на незрял плод или преждевременно раждане. Подобно на всички β -блокери, metoprolol би могъл да доведе до поява на брадикардия и хипогликемия на плода, новороденото или на кърмачето. Съществува риск и то поява на някои сърдечни и белодробни усложнения на новороденото. Metoprolol се прилага за лечение на хипертония по време на бременност при постоянно наблюдение на майката и след 20 гестационна седмица. Въпреки че Betaloc I.V. преминава плацентарната бариера и се доказва в кръв от пъпна връв, досега не са описани случайна поява на аномалии на плода.

Лактация

По време на лечение с лекарствения продукт не е препоръчително продължаване на кърменето. Ако майката получава терапевтични дози metoprolol, малките количества metoprolol, екскретирани с кърмата не би трябвало да оказват значим ефект върху плода.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

При шофиране и работа с машини трябва да се има предвид, че понякога лекарственият продукт може да причини виене на свят и сънливост.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Metoprolol обикновено се понася добре и нежеланите ефекти от лечението са леки и обратими. В клиничните проучвания и в рутинната практика са описани следните по-чести странични ефекти от лечението.

Подобно на всички други β -блокери, интравенозното приложение на Betaloc I.V. може да доведе до значително спадане на артериалното налягане. Другите странични ефекти от лечението се срещат рядко и са леко изразени. Най-често се описват ленивост, гастро-интестинални оплаквания (гадене, повръщане, болки в корема) и промени в съня. Обикновено тези нежелани реакции са преходни или отзвучават след намаляване на дозата.

Макар и рядко се описват и ефекти върху централната нервна система, като виене на свят, главоболие, рядко парестезии, мускулни крампи, депресия, намалена бодрост. Има изолирани случаи на развитие на личностови разстройства, като амнезия, промени в паметта, объркване, халюцинации, нервност и тревожност.



Понякога се описват и някои сърдечно-съдови странични ефекти, като брадикардия, ортостатична хипотония, а рядко развитие на сърдечна недостатъчност, прогресиране на съществуващ AV-блок, палпитации, аритмии, феномен на Raynaud, периферни отоци и прекордиална болка. Съществуват и изолирани случаи на промени в проводимостта на сърцето, развитие на гангрена при болни с предсъществуващи заболявания на периферните артерии и влошаване на налично клаудикацио интермитенс.

Нерядко се описват посочените по-горе гастро-интестинални проблеми, рядко диария и запек, изолирани случаи на сухота в устата и промени в чернодробните функционални тестове.

Много рядко се описват поява на кожни обриви (уртикария, псориазиформени и дистрофични кожни лезии), позитивиране на антинуклеарните антитела (несвързано със системен лупус). В литературата има изолирани случаи на фоточувствителност, влошаване на псориазис, увеличено изпотяване и алопеция. От страна на дихателната система се описват следните нежелани реакции: задух при физически усилия и рядко бронхоспазъм, изолирани случаи на ринит.

Рядко се описват импотенция/ сексуална дисфункция, както и при изолирани случаи на покачване на телесното тегло, тромбоцитопения, промени в зрението, конюнктивит, шум в ушите, сухота или дразнене в очите, промени във вкуса и артралгии.

Честотата на кожните обриви и/или появата на сухота в очите е ниска и в повечето случаи оплакванията отзвучават след спиране на лечението. При поява на подобна реакция, която не може да бъде обяснена по друг начин, трябва да се обмисли прекратяване на терапията.

4.9 Предозиране

Предозирането на Betaloc I.V. за интравенозно приложение може да доведе до поява на тежка хипотония, синусова брадикардия, AV блок, сърдечна недостатъчност и кардиогенен шок, сърдечен арест, бронхоспазъм, промени в съзнанието, кома, гадене, повръщане, цианоза, хипогликемия и по-рядко – до хиперкалиемия. По време на лечението трябва да се наблюдават сърдечната, дихателната и бъбречната функция, кръвната захар и електролитите. Сърдечносъдовите усложнения трябва да се лекуват симптоматично – т.е. със симпатикомиметични агенти (като норадреналин, метараминол), атропин или инотропни средства (като допамин и добутамин). При поява на AV блок може да се наложи поставяне на временен пейс-мейкър. Глюкагонът в доза 1-10 mg интравенозно антагонизира ефектите на ексцесивната β -блокада. При поява на бронхоспазъм може да се наложи интравенозно приложение на интравенозни β_2 агонисти, като например тербуталин. Betaloc I.V. за интравенозно приложение се диализира.



5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ХАРАКТЕРИСТИКИ

5.1 Фармакодинамика

Metoprolol е компетитивен β -адрено-рецепторен антагонист, чието действие е свързано с инхибиране главно на β -адренорецепторите (кардиоселективност). Лекарственият продукт няма вътрешна симпатикомиметична активност (частичен агонистичен ефект) и неговата β -антагонистична активност е съпоставима с тази на пропранолол. Metoprolol има негативен хронотропен ефект. Бързото интравенозно приложение на лекарствения продукт е свързано с рязко намаляване на сърдечната честота и артериалното налягане.

5.2 Фармакокинетика

Metoprolol се елиминира главно посредством метаболизъм в черния дроб при среден период на полу-елиминиране от 3.5 часа (между 1 и 9 часа). Скоростта на метаболизиране на лекарствения продукт показва големи интериндивидуални вариации, като бавно метаболизиращите лекарствения продукт (около 10%) показват по-високи плазмени концентрации и по-бавно елиминиране от бързо метаболизиращите лекарствения продукт индивиди. Междуиндивидуалните плазмени нива са стабилни и репродуцируеми.

5.3 Предклинични данни за безопасност

В тази листовка не са включени предклиничните данни за безопасност на лекарствения продукт, тъй като metoprolol tartrate е въведен отдавна в клиничната практика и неговата безопасност е добре известна. Моля, прочетете секция 4.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ОСОБЕНОСТИ

6.1 Помощни вещества

Sodium chloride и water for injections.

6.2 Несъвместимости

Не са известни.

6.3 Срок на годност

5 години.

6.4 Специални предпазни мерки при съхранение

Да се пази от светлина.

Да се съхранява под 25°C.

6.5 Контейнер

Стъклени ампули от 5 мл.



6.6 Специални инструкции за работа с лекарствения продукт
Няма.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

AstraZeneca UK Ltd., 600 Capability Green, Luton, LU1 3LU, UK.

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

20050224

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТРЕБА/ ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

21.04.2005

10. ДАТА НА (ЧАСТИЧНА) АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА

