Эгилок



Код АТХ:

- C07AB02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Метопролол

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с крестообразной разделительной линией и двойным скосом (форма "двойной степ") на одной стороне и гравировкой "E435" - на другой стороне, без запаха.

	1 таб.
метопролола тартрат	25 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 41.5 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) - 7.5 мг, кремния диоксид коллоидный безводный - 2 мг, повидон K90 - 2 мг, магния стеарат 2 мг.

20 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.
60 шт. - банки темного стекла (1) - пачки картонные.

Таблетки белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне и гравировкой "E434" - на другой стороне, без запаха.

	1 таб.
метопролола тартрат	50 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 83 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) - 15 мг, кремния диоксид коллоидный безводный - 4 мг, повидон K90 - 4 мг, магния стеарат - 8 мг.

15 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
60 шт. - банки темного стекла (1) - пачки картонные.

Таблетки белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с фаской, с риской на одной стороне и

гравировкой "E432" - на другой стороне, без запаха.

	1 таб.
метопролола тартрат	100 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 166 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) - 30 мг, кремния диоксид коллоидный безводный - 8 мг, повидон К90 - 8 мг, магния стеарат - 8 мг.

30 шт. - банки темного стекла (1) - пачки картонные.
60 шт. - банки темного стекла (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Кардиоселективный блокатор β-адренорецепторов.

Метопролол подавляет влияние повышенной активности симпатической системы на сердце, а также вызывает быстрое снижение ЧСС, сократимости, сердечного выброса и АД.

При артериальной гипертензии метопролол снижает АД у пациентов в положении стоя и лежа. Длительный антигипертензивный эффект препарата связан с постепенным снижением ОПСС. При артериальной гипертензии длительное применение препарата приводит к статистически значимому снижению массы левого желудочка и улучшению его диастолической функции. У мужчин с мягкой или умеренной степенью артериальной гипертензией метопролол снижает смертность от сердечно-сосудистых причин (прежде всего, внезапную смерть, смертельный и несмертельный инфаркт и инсульт).

Как и другие бета-адреноблокаторы, метопролол снижает потребность миокарда в кислороде за счет снижения системного АД, ЧСС и сократимости миокарда. Снижение ЧСС и соответствующее удлинение диастолы при приеме метопролола обеспечивают улучшение кровоснабжения и усвоение кислорода миокардом с нарушенным кровотоком. Поэтому при стенокардии препарат снижает число, продолжительность и тяжесть приступов, а также бессимптомных проявлений ишемии, и улучшает физическую работоспособность пациента. При инфаркте миокарда метопролол снижает показатель смертности, уменьшая риск внезапной смерти. Этот эффект прежде всего связан с предупреждением эпизодов желудочковой фибрилляции. Снижение показателя смертности можно также наблюдать при применении метопролола как в ранней, так и в поздней фазе инфаркта миокарда, а также у пациентов группы высокого риска и больных сахарным диабетом. Применение препарата после инфаркта миокарда снижает вероятность несмертельного повторного инфаркта. При хронической сердечной недостаточности на фоне идиопатической гипертрофической обструктивной кардиомиопатии метопролола тартрат, принимаемый в низких дозах (2×5 мг/сут) с постепенным повышением дозы, значительно улучшает работу сердца, качество жизни и физическую выносливость пациента.

При суправентрикулярной тахикардии, фибрилляции предсердий и желудочковой экстрасистолии метопролол снижает частоту желудочковых сокращений и число желудочковых экстрасистол.

В терапевтических дозах периферические вазоконстрикторные и бронхоконстрикторные эффекты метопролола менее выражены, чем такие же эффекты неселективных бета-адреноблокаторов.

По сравнению с неселективными бета-адреноблокаторами метопролол меньше влияет на продукцию инсулина и углеводный обмен, не увеличивает продолжительность приступов гипогликемии.

Метопролол вызывает незначительное повышение концентрации триглицеридов и незначительное снижение концентрации свободных жирных кислот в сыворотке крови. Наблюдается значительное снижение общей концентрации холестерина сыворотки крови после применения метопролола в течение нескольких лет.

Фармакокинетика

Всасывание

Метопролол быстро и полностью абсорбируется из ЖКТ. Для препарата характерна линейная фармакокинетика в терапевтическом диапазоне доз. C_{max} в плазме крови достигается через 1.5-2 ч после приема внутрь. Биодоступность составляет примерно 50% при однократном приеме и примерно 70% при регулярном применении. Прием препарата одновременно с пищей может повысить биодоступность на 30-40%.

Распределение

Метопролол незначительно (примерно 5-10%) связывается с белками плазмы крови. V_d составляет 5.6 л/кг.

Метаболизм

После всасывания метопролол в значительной степени подвергается эффекту "первого прохождения" через печень. Метаболизируется в печени изоферментами цитохрома Р450. Метаболиты не обладают фармакологической активностью.

Выведение

$T_{1/2}$ составляет в среднем 3.5 ч (от 1 до 9 ч). Общий клиренс составляет примерно 1 л/мин. Примерно 95% введенной дозы выделяется почками, 5% - в виде неизмененного метопролола. В некоторых случаях это значение может достигать 30%.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Существенных изменений фармакокинетики метопролола у пациентов пожилого возраста не выявлено.

Нарушение функции почек не влияет на системную биодоступность или выведение метопролола. Однако в этих случаях наблюдается снижение экскреции метаболитов. При почечной недостаточности тяжелой степени (СКФ <5 мл/мин) наблюдается значительное накопление метаболитов. Однако такое накопление метаболитов не усиливает степень бета-адренергической блокады.

Нарушение функции печени незначительно влияет на фармакокинетику метопролола. Однако при тяжелом циррозе печени и после наложения портокавального анастомоза биодоступность может возрасти, а общий клиренс из организма - снизиться. После портокавального шунтирования общий клиренс препарата из организма составляет примерно 0.3 л/мин, а AUC увеличивается примерно в 6 раз по сравнению с таковой у здоровых добровольцев.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия (в монотерапии или в комбинации с другими антигипертензивными препаратами);

— функциональные нарушения сердечной деятельности, сопровождающиеся тахикардией;

— ИБС (вторичная профилактика инфаркта миокарда, профилактика приступов стенокардии);

— нарушения ритма сердца (наджелудочковые аритмии, желудочковая экстрасистолия);

— гипертиреоз (в составе комплексной терапии);

— профилактика приступов мигрени.

Относится к болезням:

- Аритмия
- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Желудочковая экстрасистолия
- Мигрень
- Миокардит
- Стенокардия
- Тахикардия
- Экстрасистолия

Противопоказания:

— кардиогенный шок;

— AV-блокада II и III степени;

— синоатриальная блокада;

— СССУ;

— синусовая брадикардия (ЧСС<50 уд./мин);

— сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;

— нарушения периферического кровообращения тяжелой степени;

— возраст до 18 лет (ввиду отсутствия достаточных клинических данных);

— одновременное в/в введение верапамила;

— тяжелая форма бронхиальной астмы;

— феохромоцитома без одновременного применения альфа-адреноблокаторов;

— повышенная чувствительность к метопрололу или любому другому компоненту препарата;

— повышенная чувствительность к другим бета-адреноблокаторам.

В связи с недостаточностью клинических данных Эгиолок противопоказан при остром инфаркте миокарда, сопровождающимся ЧСС <45 уд/мин, с интервалом PQ >240 мс, и систолическим АД <100 мм рт.ст.

С осторожностью следует назначать препарат при сахарном диабете; метаболическом ацидозе; бронхиальной астме; ХОБЛ; почечной/печеночной недостаточности; миастении; феохромоцитоме (при одновременном применении с альфа-адреноблокаторами); тиреотоксикозе; AV-блокаде I степени, депрессии (в т.ч. в анамнезе); псориазе; облитерирующих заболеваниях периферических сосудов (перемежающаяся хромота, синдром Рейно); беременности; в период лактации; пациентам пожилого возраста; пациентам с отягощенным аллергологическим анамнезом (возможно снижение ответа при применении адреналина).

Способ применения и дозы:

Препарат следует принимать внутрь во время или вне зависимости от приема пищи. При необходимости таблетку можно разломить пополам.

Дозу следует подбирать постепенно и индивидуально во избежание развития чрезмерной брадикардии. Максимальная суточная доза составляет 200 мг.

При *мягкой или умеренной степени артериальной гипертензии* начальная доза составляет 25-50 мг 2 раза/сут (утром и вечером). При необходимости дозу можно постепенно увеличить до 100-200 мг/сут или добавить другое антигипертензивное средство.

При *стенокардии* начальная доза составляет 25-50 мг 2-3 раза/сут. В зависимости от эффекта дозу можно постепенно увеличить до 200 мг/сут или добавить другой антиангинальный препарат.

Рекомендуемая доза препарата для *поддерживающей терапии после инфаркта миокарда* - 100-200 мг/сут, разделенная на 2 приема (утром и вечером).

При *нарушениях ритма сердца* начальная доза составляет 25-50 мг 2-3 раза/сут. При необходимости суточную дозу можно постепенно увеличить до 200 мг/сут или добавить другое противоаритмическое средство.

При *гипертиреозе* обычная суточная доза составляет 150-200 мг в 3-4 приема.

При *функциональных расстройствах сердца, сопровождающихся ощущением сердцебиения* обычная доза составляет 50 мг 2 раза/сут (утром и вечером); при необходимости дозу можно увеличить до 200 мг в 2 приема.

Для *профилактики приступов мигрени* рекомендуемая доза составляет 100 мг/сут в 2 приема (утром и вечером); при необходимости дозу можно увеличить до 200 мг/сут в 2 приема.

У **пациентов с нарушениями функции почек** не требуется изменения режима дозирования.

При циррозе печени обычно не требуется изменения дозы в связи с низким связыванием метопролола с белками плазмы крови. При **печеночной недостаточности тяжелой степени** (например, после проведения портокавального шунтирования) может возникнуть необходимость в снижении дозы препарата Эгилок.

У **пациентов пожилого возраста** коррекции дозы не требуется.

Побочное действие:

Эгилок обычно хорошо переносится пациентами. Побочные эффекты, как правило, выражены слабо и обратимые. Перечисленные ниже побочные эффекты зарегистрированы в клинических испытаниях и при терапевтическом применении метопролола. В некоторых случаях связь нежелательного явления с применением препарата достоверно не установлена. Перечисленные ниже параметры частоты побочных эффектов определены следующим образом: очень часто (>10%), часто (1-9.9%), нечасто (0.1-0.9%), редко (0.01-0.09%), очень редко, включая отдельные сообщения (<0.01%).

Со стороны нервной системы: очень часто - повышенная утомляемость; часто - головокружение, головная боль; редко - повышенная возбудимость, тревожность; нечасто - парестезии, судороги, депрессия, снижение концентрации внимания, сонливость, бессонница, кошмарные сновидения; очень редко - амнезия/нарушение памяти, подавленность, галлюцинации.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - брадикардия, ортостатическая гипотензия (в некоторых случаях возможны синкопальные состояния), похолодание нижних конечностей, ощущение сердцебиения; нечасто - временное усиление симптомов сердечной недостаточности, кардиогенный шок у пациентов с инфарктом миокарда, AV-блокада I степени; редко - нарушения проводимости, аритмия; очень редко - гангрена (у пациентов с нарушениями периферического кровообращения).

Со стороны дыхательной системы: часто - одышка при физическом усилии; нечасто - бронхоспазм у пациентов с бронхиальной астмой; редко - ринит.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, боль в животе, запор или диарея; нечасто - рвота; редко - сухость слизистой оболочки полости рта, нарушение функции печени.

Со стороны кожных покровов: нечасто - крапивница, повышенное потоотделение; редко - алопеция; очень редко - фотосенсибилизация, обострение течения псориаза.

Со стороны органов чувств: редко - нарушение зрения, сухость и/или раздражение глаз, конъюнктивит; очень редко - звон в ушах, нарушение вкусовых ощущений.

Со стороны половой системы: редко - импотенция/сексуальная дисфункция.

Прочие: нечасто - увеличение массы тела; очень редко - артралгия, тромбоцитопения.

Применение препарата Эгилок следует прекратить, если какой-либо из перечисленных выше эффектов достигает клинически значимой интенсивности, а его причину достоверно установить невозможно.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД, синусовая брадикардия, AV-блокада, сердечная недостаточность, кардиогенный шок, асистолия, тошнота, рвота, бронхоспазм, цианоз, гипогликемия, потеря сознания, кома. Перечисленные выше симптомы могут усилиться при одновременном применении с этанолом, антигипертензивными препаратами, хинидином и барбитуратами.

Первые симптомы передозировки появляются через 20 мин-2 ч после приема препарата.

Лечение: необходимо тщательное наблюдение за пациентом (контроль АД, ЧСС, частоты дыхания, функции почек, концентрации глюкозы в крови, электролитов сыворотки крови) в условиях отделения интенсивной терапии. Если препарат был принят недавно, промывание желудка с применением активированного угля может снизить дальнейшее всасывание препарата (если промывание невозможно, можно вызвать рвоту, если пациент в сознании). В случае чрезмерного снижения АД, брадикардии и угрозе сердечной недостаточности - в/в, с интервалом в 2-5 мин, введение бета-адреномиметиков (до достижения желаемого эффекта) или в/в введение 0.5-2 мг атропина. При отсутствии положительного эффекта - допамин, добутамин или норэпинефрин (норадреналин). При гипогликемии - введение 1-10 мг глюкагона, установка временного водителя ритма. При бронхоспазме - введение бета$_2$-адреномиметиков. При судорогах - медленное в/в введение диазепама. Гемодиализ неэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата не рекомендуется при беременности. Применение препарата возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. При необходимости назначения препарата при беременности необходимо тщательное наблюдение за состоянием плода и новорожденного в течение 48-72 ч после родов, поскольку возможно развитие брадикардии, артериальной гипотензии, гипогликемии и угнетение дыхания.

Несмотря на то, что при применении препарата в терапевтических дозах лишь небольшое количество метопролола выделяется с грудным молоком, следует наблюдать за состоянием новорожденного (возможна брадикардия). Применение препарата в период лактации не рекомендуется. При необходимости применения препарат Эгилок в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Антигипертензивные эффекты препарата Эгилок при одновременном применении с другими антигипертензивными средствами обычно усиливаются. Во избежание артериальной гипотензии необходимо тщательное наблюдение за пациентами, получающими комбинации таких средств. Однако суммированием эффектов антигипертензивных препаратов можно при необходимости пользоваться для достижения эффективного контроля АД.

Одновременное применение метопролола и блокаторов медленных кальциевых каналов типа дилтиазема и верапамила может привести к усилению отрицательных инотропного и хронотропного эффектов. Следует избегать

в/в введения блокаторов кальциевых каналов типа верапамила пациентам, получающим бета-адреноблокаторы.

Комбинации, требующие соблюдения осторожности

Пероральные антиаритмические препараты (типа хинидина и амиодарона): риск развития брадикардии, AV-блокады.

Сердечные гликозиды: риск развития брадикардии, нарушений проведения; метопролол не влияет на положительный инотропный эффект сердечных гликозидов.

Другие антигипертензивные препараты (особенно группы гуанетидина, резерпина, альфа-метилдопа, клонидина и гуанфацина): риск развития артериальной гипотензии и/или брадикардии.

Прекращение одновременного применения метопролола и клонидина следует обязательно начинать, отменяя метопролол, а затем (через несколько дней) клонидин; если сначала отменить клонидин, может развиться гипертонический криз.

Некоторые препараты, действующие на ЦНС (например, снотворные, транквилизаторы, три- и тетрациклические антидепрессанты, нейролептики и этанол): риск развития артериальной гипотензии.

Средства для наркоза: риск угнетения сердечной деятельности.

Альфа- и бета-симпатомиметики: риск развития артериальной гипертензии, значительной брадикардии, возможность остановки сердца.

Эрготамин: усиление вазоконстрикторного эффекта.

Бета$_2$-симпатомиметики: функциональный антагонизм.

НПВС (например, индометацин): возможно ослабление антигипертензивного эффекта.

Эстрогены: возможно снижение антигипертензивного эффекта метопролола.

Гипогликемические средства для приема внутрь и инсулин: метопролол может усилить их гипогликемические эффекты и маскировать симптомы гипогликемии.

Курареподобные миорелаксанты: усиление нервно-мышечной блокады.

Ингибиторы ферментов (например, циметидин, этанол, гидралазин; избирательные ингибиторы обратного захвата серотонина, например, пароксетин, флуоксетин и сертралин): возможно усиление эффектов метопролола вследствие повышения его концентрации в плазме крови.

Индукторы ферментов (рифампицин и барбитураты): эффекты метопролола могут снижаться вследствие повышения печеночного метаболизма.

Одновременное применение средств, блокирующих симпатические ганглии, или других бета-адреноблокаторов (например, глазных капель) или ингибиторов МАО требует тщательного медицинского наблюдения.

Особые указания и меры предосторожности:

При назначении препарата Эгилок следует регулярно контролировать ЧСС и АД. Следует обучить пациента методике подсчета ЧСС и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при ЧСС <50 уд/мин.

У пациентов с сахарным диабетом следует регулярно контролировать уровень глюкозы в крови и при необходимости проводить коррекцию дозы инсулина или пероральных гипогликемических препаратов.

При применении препарата в дозе, превышающей 200 мг/сут, уменьшается кардиоселективность.

Назначение Эгилока больным с хронической сердечной недостаточностью возможно только после достижения стадии компенсации.

У пациентов, принимающих Эгилок, возможно усиление выраженности реакций гиперчувствительности (на фоне отягощенного аллергологического анамнеза) и отсутствие эффекта от введения обычных доз эпинефрина (адреналина).

Анафилактический шок может протекать тяжелее у пациентов, принимающих Эгилок.

На фоне применения Эгилока возможно усугубление симптомов нарушения периферического кровообращения.

Эгилок следует отменять постепенно, последовательно снижая его дозу в течение 14 дней. При резком прекращении лечения возможно усиление приступов стенокардии и риска развития коронарных нарушений. В период отмены препарата пациентам с заболеванием коронарных артерий необходимо находиться под тщательным медицинским

наблюдением.

При стенокардии напряжения подобранная доза препарата Эгилок должна обеспечивать ЧСС в покое в пределах 55-60 уд./мин, при нагрузке - не более 110 уд./мин.

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

Эгилок может маскировать некоторые клинические проявления гипертиреоза (например, тахикардию). Резкая отмена препарата у пациентов с тиреотоксикозом противопоказана, поскольку способна усилить симптоматику.

При сахарном диабете прием Эгилока 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 назначении метопролола пациентам с бронхиальной астмой необходимо одновременное применение бета$_2$-адреномиметиков.

У пациентов с феохромоцитомой Эгилок следует применять в сочетании с альфа-адреноблокаторами.

Перед проведением любого хирургического вмешательства необходимо проинформировать хирурга/анестезиолога о проводимой терапии Эгилоком (выбор препарата для общей анестезии с минимальным отрицательным инотропным действием); отмены препарата не требуется.

Препараты, снижающие запасы катехоламинов (например, резерпин) могут усилить действие бета-адреноблокаторов, поэтому пациенты, принимающие такие сочетания препаратов, должны находиться под постоянным медицинским наблюдением на предмет выявления чрезмерного снижения АД или брадикардии.

При назначении препарата пациентам пожилого возраста следует регулярно контролировать функцию печени. Коррекция режима дозирования требуется только в случае появления у пациентов пожилого возраста нарастающей брадикардии (<50 уд/мин), выраженного снижения АД (систолическое АД <100 мм рт.ст.), AV-блокады, бронхоспазма, желудочковых аритмий, тяжелых нарушений функции печени. Иногда необходимо прекратить лечение.

Пациентам с почечной недостаточностью тяжелой степени рекомендуется осуществлять контроль функции почек.

Следует проводить особый контроль состояния пациентов с депрессивными расстройствами. В случае развитии депрессии, вызванной применением бета-адреноблокаторов, следует прекратить терапию.

При возникновении прогрессирующей брадикардии следует снизить дозу или отменить препарат.

Использование в педиатрии

Из-за отсутствия достаточного количества клинических данных препарат не рекомендуется применять **у детей и подростков в возрасте до 18 лет**.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и при занятиях потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания (риск развития головокружения и повышенной утомляемости).

При нарушениях функции почек

У **пациентов с нарушениями функции почек** не требуется изменения режима дозирования.

С осторожностью следует назначать препарат при почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

При циррозе печени обычно не требуется изменения дозы в связи с низким связыванием метопролола с белками плазмы крови. При **печеночной недостаточности тяжелой степени** (например, после проведения портокавального шунтирования) может возникнуть необходимость в снижении дозы препарата Эгилок.

С осторожностью следует назначать препарат при печеноченой недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* следует назначать препарат пациентам пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Из-за отсутствия достаточного количества клинических данных препарат не рекомендуется применять **у детей и подростков в возрасте до 18 лет**.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре от 15° до 25°C.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Egilok