

Эгилок Ретард



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Метопролол](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)
[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}
[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Таблетки пролонгированного действия, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, продолговатой формы, двояковыпуклые, с риской на обеих сторонах.

	1 таб.
метопролола тартрат	50 мг
"_"	100 мг

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат, целлюлоза микрокристаллическая; **в составе пеллет:** макрогол 6000, сахарная крупка (сахароза, патока крахмальная), тальк; **в составе оболочки пеллет:** гипролоза, магния стеарат, триэтилцитрат, этилцеллюлоза.

Состав пленочной оболочки: гипромеллоза, макрогол 6000, тальк, титана диоксид (E171).

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Кардиоселективный блокатор β -адренорецепторов, не обладает внутренней симпатомиметической и мембраностабилизирующей активностью. Оказывает антигипертензивное, антиангинальное и антиаритмическое действие.

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

При артериальной гипертензии метопролол снижает АД у пациентов в положении стоя и лежа. Длительный антигипертензивный эффект препарата связан с постепенным снижением ОПСС.

При однократном и кратковременном многократном приеме метопролол снижает активность ренина плазмы крови, что объясняется подавлением почечных β_1 -адренорецепторов, что приводит к снижению продукции ренина и соответственно снижению вазоконстрикции, опосредованной ангиотензином.

При артериальной гипертензии длительное применение метопролола приводит к статистически значимому снижению массы левого желудочка.

Как и другие бета-адреноблокаторы, метопролол снижает потребность миокарда в кислороде за счет снижения системного АД, ЧСС и сократимости сердца. Путем урежения ЧСС и соответствующего удлинения диастолы, метопролол улучшает кровоснабжение и оксигенацию областей миокарда с нарушенным кровотоком. Поэтому препарат снижает частоту приступов стенокардии и повышает физическую работоспособность.

При приеме после инфаркта миокарда метопролол снижает риск повторного инфаркта миокарда.

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. Он существенно не изменяет сердечно-сосудистые реакции на гипогликемию и не увеличивает продолжительность приступов гипогликемии.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь метопролол почти полностью (примерно 95%) всасывается из ЖКТ. Однако после всасывания метопролол в значительной степени подвергается метаболизму при "первом прохождении" через печень. Биодоступность составляет примерно 35%. При многократном приеме АUC увеличивается примерно на 20%.

Кривая зависимости концентрации в плазме крови от времени имеет особенности, характерные для препаратов замедленного высвобождения.

Фармакокинетика метопролола линейна до дозы 800 мг.

Распределение

Связывание с белками плазмы крови составляет 10%.

Метопролол хорошо распределяется в тканях и имеет большой V_d - 5.5 л/кг.

На протяжении 4-6 часов после приема фаза медленного всасывания переходит в примерно 6-часовое плато ($C_{max} = 37.4$ нг/мл после введения однократной дозы, C_{ss}^{max} составляет 54.7 нг/мл), после этого следует фаза медленного выведения.

Метаболизм

Метопролол метаболизируется в печени при участии изоферментов системы цитохрома P450. Метаболиты (O-дезметилметопролол и α -гидроксиметопролол) не обладают бета-адреноблокирующей активностью. Поскольку метаболизм препарата осуществляется полиморфными ферментами, его уровень в плазме крови имеет значительные (до 17-кратных) различия у разных пациентов.

Выведение

$T_{1/2}$ метопролола в форме таблетки ретард составляет 6-12 ч, что гораздо больше, чем $T_{1/2}$ метопролола в обычной лекарственной форме (примерно 3 ч). Более длительный период полувыведения можно объяснить замедленным всасыванием.

Метопролол выводится преимущественно почками (примерно 95%). Около 10% введенной дозы метопролола выводится в неизменном виде. Метаболиты выводятся с желчью.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Метопролол не удаляется из организма при гемодиализе. Лечение пациентов со сниженной функцией почек не требует коррекции дозы препарата.

Нарушение функции печени замедляет метаболизм метопролола, и в случаях недостаточности функции печени, доза препарата должна быть снижена.

Показания к применению:

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

— хроническая сердечная недостаточность в стадии компенсации (в сочетании со стандартной терапией диуретиками, ингибиторами АПФ, сердечными гликозидами);

— ИБС (вторичная профилактика инфаркта миокарда - в составе комплексной терапии; профилактика приступов

стенокардии);

— профилактика нарушений ритма сердца, особенно наджелудочковой тахикардии и желудочковой тахикардии, вызванной зависимым от адренергических механизмов удлинением интервала QT;

— гиперкинетический кардиальный синдром;

— гипертиреоз (в составе комплексной терапии);

— профилактика приступов мигрени.

Относится к болезням:

- [Артериальная гипертензия](#)
- [Гипертензия](#)
- [Желудочковая тахикардия](#)
- [Кардит](#)
- [Мигрень](#)
- [Миокардит](#)
- [Сердечная недостаточность](#)
- [Стенокардия](#)
- [Тахикардия](#)

Противопоказания:

— кардиогенный шок;

— AV-блокада II и III степени;

— синоатриальная блокада;

— СССУ;

— сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;

— ангиоспастическая стенокардия (стенокардия Принцметала);

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

— артериальная гипотензия;

— выраженные нарушения периферического артериального кровообращения;

— период лактации;

— одновременный прием ингибиторов MAO;

— одновременное в/в введение верапамила;

— возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

— повышенная чувствительность к метопрололу и другим ингредиентам препарата.

Из-за ограниченности клинических данных применение препарата противопоказано при инфаркте миокарда в следующих условиях: ЧСС менее 45 уд./мин, интервал PQ превышает 0.24 сек, систолическое АД менее 100 мм рт.ст., выраженная сердечная недостаточность и AV блокада II или III степени.

С *осторожностью* следует назначать препарат при сахарном диабете, метаболическом ацидозе, бронхиальной астме, хронической обструктивной болезни легких (эмфизема легких, хронический обструктивный бронхит), облитерирующих заболеваниях периферических сосудов (перемежающаяся хромота, синдром Рейно), хронической почечной и/или печеночной недостаточности, миастении, феохромоцитоме, AV-блокаде I степени, тиреотоксикозе, депрессии (в т.ч. в анамнезе), псориазе, беременности, пациентам пожилого возраста, при непереносимости фруктозы, нарушении всасывания глюкозы/галактозы, недостаточности сахаразы/изомальтазы.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают 1 раз/сут, утром, независимо от приема пищи.

С целью предупреждения брадикардии дозу следует подбирать индивидуально и увеличивать постепенно.

При *артериальной гипертензии* рекомендуемая начальная доза составляет 50 мг 1 раз/сут. При недостаточности терапевтического эффекта суточную дозу можно увеличить до 100 мг или 200 мг, либо дополнительно назначить другое антигипертензивное средство. Максимальная суточная доза составляет 200 мг.

При *стенокардии* рекомендуемая начальная доза составляет 50 мг 1 раз/сут. При недостаточности терапевтического эффекта суточную дозу можно увеличить до 100 мг или 200 мг, либо дополнительно назначить другое антигипертензивное средство.

Для *вторичной профилактики инфаркта миокарда* обычная поддерживающая доза составляет 200 мг 1 раз/сут.

При *сердечной недостаточности в стадии компенсации* рекомендуемая начальная доза - 25 мг 1 раз/сут. Через 2 недели суточную дозу можно повысить до 50 мг, затем через две недели до 100 мг и наконец, еще через 2 недели - до 200 мг.

При *нарушениях ритма сердца* назначают по 50-200 мг 1 раз/сут.

При *гипертиреозе* обычная доза составляет 50-200 мг 1 раз/сут.

При *гиперкинетическом кардиальном синдроме* препарат назначают в дозе 50-200 мг 1 раз/сут.

Для *профилактики приступов мигрени* препарат назначают в дозе 100-200 мг 1 раз/сут.

У пожилых пациентов и пациентов с почечной недостаточностью, а также у **пациентов, находящихся на гемодиализе**, коррекции дозы не требуется.

При **тяжелой печеночной недостаточности** дозу препарата следует уменьшать в соответствии с клиническим состоянием пациента.

Таблетки следует принимать целиком, не разжевывая, запивая жидкостью. Таблетки можно разламывать пополам.

Побочное действие:

Определение частоты побочных реакций: очень часто (>1/10); часто (>1/100, <1/10); иногда (>1/1000, <1/100); редко (>1/10 000, <1/1000); очень редко (<1/10 000), включая отдельные сообщения.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: очень часто (особенно в начале курса лечения) - повышенная утомляемость, слабость, головокружение и головная боль; иногда - снижение концентрации внимания, замедление скорости психических и двигательных реакций, нарушения сна, сонливость, бессонница, кошмарные сновидения, депрессия, тремор, судороги, беспокойство; редко - возбудимость, тревога, парестезии в конечностях (у больных с перемежающейся хромотой и синдромом Рейно); очень редко - кратковременная потеря памяти, спутанность сознания и галлюцинации, мышечная слабость, астения, миастения.

Со стороны органов чувств: редко - снижение зрения, снижение секреции слезной жидкости, сухость и болезненность глаз, конъюнктивит, шум в ушах, снижение слуха.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - чрезмерное снижение АД, ортостатическая гипотензия (головокружение, иногда потеря сознания), усиленное сердцебиение, синусовая брадикардия; редко - снижение сократимости миокарда, развитие (усугубление) сердечной недостаточности (отеки, отечность стоп и/или нижней части голени, одышка), нарушения ритма сердца, проявление ангиоспазма (усиление нарушения периферического кровообращения, похолодание нижних конечностей, синдром Рейно), нарушение проводимости миокарда, кардиалгия; очень редко - усугубление ранее существовавших нарушений AV-проводимости.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, боль в животе, сухость во рту, запоры или диарея; очень редко - повышение активности печеночных ферментов, гипербилирубинемия; в отдельных случаях - нарушение функции печени (темная моча, желтушность склер или кожи, холестаз), изменения вкуса.

Дерматологические реакции: усиление потоотделения; редко - высыпания на коже (обострение псориаза), гиперемия кожи, экзантема, обратимая алопеция; очень редко - фотодерматоз, псориазоподобные кожные реакции.

Аллергические реакции: крапивница, кожный зуд, сыпь.

Со стороны дыхательной системы: заложенность носа, бронхоспазм при назначении в высоких дозах (утрата селективности и/или у предрасположенных пациентов), одышка.

Со стороны системы кроветворения: очень редко - тромбоцитопения (необычные кровотечения и кровоизлияния), агранулоцитоз, лейкопения.

Со стороны обмена веществ: снижение уровня холестерина ЛПВП и повышение уровня триглицеридов (наряду с нормальным уровнем общего холестерина), увеличение массы тела.

Со стороны эндокринной системы: гипергликемия (у больных инсулиннезависимым сахарным диабетом), гипогликемия (у больных, получающих инсулин), гипотиреоидное состояние.

Влияние на плод: внутриутробная задержка роста, гипогликемия, брадикардия.

Прочие: боль в спине или суставах, снижение либидо и/или потенции, при резком прекращении лечения - синдром "отмены" (усиление приступов стенокардии, повышение АД).

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД, выраженная тяжелая синусовая брадикардия, головокружение, тошнота, рвота, цианоз, аритмия, желудочковая экстрасистолия, бронхоспазм, обморок; при острой передозировке - кардиогенный шок, потеря сознания, кома, АВ-блокада (вплоть до развития полной поперечной блокады и остановки сердца), кардиалгия.

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

Перечисленные выше симптомы могут усилиться при одновременном приеме алкоголя, антигипертензивных препаратов, хинидина и барбитуратов.

Лечение: интенсивная терапия и тщательное наблюдение за пациентом (параметры кровообращения и дыхания, функция почек, уровень глюкозы крови, электролиты сыворотки крови). Если препарат принят недавно, его дальнейшее всасывание может быть снижено промыванием желудка, стимуляцией рвоты и введением активированного угля.

При выраженном снижении АД: пациент должен находиться в положении Тренделенбурга; в случае чрезмерного снижения АД, брадикардии и угрозе сердечной недостаточности следует в/в ввести бета-адреностимуляторы с интервалом в 2-5 мин, до достижения желаемого эффекта или в/в ввести 0.5-2 мг атропина сульфата.

При отсутствии достаточного эффекта следует применять допамин, добутамин или норэпинефрин (норадреналин).

В качестве последующих мер возможно назначение глюкагона в дозе 1-10 мг глюкагона, постановка искусственного водителя ритма.

Бронхоспазм можно купировать в/в введением стимуляторов β_2 -адренорецепторов (например, тербуталина).

Метопролол плохо выводится с помощью гемодиализа

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата Эгилок Ретард при беременности возможно только по строгим показаниям в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. При необходимости назначения препарата при беременности необходимо тщательное наблюдение, особенно за состоянием плода, поскольку возможны брадикардия, артериальная гипотензия, гипогликемия плода. Лечение необходимо прерывать за 48-72 ч до родов. В тех случаях, когда это невозможно, необходимо обеспечить наблюдение за новорожденным в течение 48-72 ч после родов.

Влияние метопролола на новорожденного при кормлении грудью не изучено, поэтому женщинам, принимающим Эгилок Ретард, следует прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении Эгилока Ретард с ингибиторами MAO возможно значительное усиление гипотензивного действия. Перерыв между приемом ингибиторов MAO и Эгилока Ретард должен составлять не менее 14 дней.

Одновременное в/в введение верапамила может спровоцировать остановку сердца, одновременное назначение нифедипина приводит к значительному снижению АД.

При сочетании с гипотензивными средствами, диуретиками, нитроглицерином или блокаторами медленных кальциевых каналов может развиваться резкое снижение АД (особая осторожность необходима при сочетании с празозином); с верапамилом, дилтиаземом, антиаритмическими средствами (амиодароном), резерпином, метилдопой, клонидином, гуанфацином, средствами для общей анестезии и сердечными гликозидами - увеличение выраженности урежения ЧСС и угнетение AV-проводимости.

Средства для ингаляционного наркоза (производные углеводородов) повышают риск угнетения функции миокарда и развития артериальной гипотензии.

Бета-адреностимуляторы, теофиллин, кокаин, эстрогены (задержка натрия), индометацин и другие НПВС (вызывающие задержку натрия и блокирование синтеза простагландинов почками) ослабляют гипотензивный эффект препарата.

При одновременном применении с препаратом Эгилок Ретард три- и тетрациклические антидепрессанты, антипсихотические средства (нейролептики), седативные и снотворные препараты усиливают угнетающее влияние на ЦНС.

При совместном приеме с гипогликемическими средствами для приема внутрь возможно снижение их эффекта; с инсулином - повышение риска развития гипогликемии, усиление ее выраженности и продолжительности, маскировка некоторых симптомов гипогликемии (тахикардия, потливость, повышение АД).

Индукторы микросомальных ферментов печени (рифампицин, барбитураты) ускоряют метаболизм метопролола, что приводит к снижению концентрации метопролола в плазме крови и уменьшению эффекта Эгилока Ретард.

Ингибиторы микросомальных ферментов печени (циметидин, пероральные контрацептивы, фенотиазины) повышают концентрацию метопролола в плазме крови.

Аллергены, используемые для иммунотерапии или экстракты аллергенов для кожных проб при совместном применении с метопрололом, повышают риск возникновения системных аллергических реакций или анафилаксии; йодсодержащие рентгеноконтрастные вещества для в/в введения повышают риск развития анафилактических реакций.

Метопролол снижает клиренс производных ксантина, особенно с исходно повышенным клиренсом теофиллина под влиянием курения.

Метопролол снижает клиренс лидокаина, повышает концентрацию лидокаина в плазме крови.

Усиливает и пролонгирует действие антидеполяризующих миорелаксантов; удлиняет антикоагулянтный эффект кумаринов.

При совместном применении с этанолом увеличивается риск выраженного снижения АД и отмечается усиление угнетающего действия на ЦНС.

При совместном применении с алкалоидами спорыньи увеличивается риск развития нарушений периферического кровообращения.

Особые указания и меры предосторожности:

Контроль за больными, принимающими бета-адреноблокаторы, включает регулярное наблюдение за ЧСС и АД, содержанием глюкозы у больных сахарным диабетом. Следует обучить пациента методике подсчета ЧСС и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при ЧСС менее 50 уд./мин. При приеме препарата в дозе более 200 мг/сут уменьшается кардиоселективность метопролола.

До начала лечения следует компенсировать хроническую сердечную недостаточность, и состояние компенсации должно быть поддержано в течение всего процесса лечения.

Возможно усиление выраженности реакций повышенной чувствительности (на фоне отягощенного аллергологического анамнеза) и отсутствие эффекта от введения средних доз эпинефрина (адреналина). У больных, принимающих препарат, анафилактический шок может протекать особенно тяжело.

Препарат может усилить существующую брадикардию. У пациентов, получающих бета-адреноблокаторы, эпинефрин (адреналин) может повышать АД и вызвать (рефлекторную) брадикардию; эта реакция менее вероятна в случае применения селективных бета-адреноблокаторов.

Препарат может усилить симптомы нарушения периферического кровообращения.

При необходимости назначения препарата больным бронхиальной астмой может потребоваться одновременное применение бета₂-адреностимуляторов (изменение дозы ранее применяемых бета₂-адреностимуляторов).

При необходимости назначения препарата больным феохромоцитомой следует применять альфа-адреноблокаторы.

Прием препарата может маскировать некоторые клинические проявления гипертиреоза (например, тахикардию). Резкая отмена у больных с тиреотоксикозом противопоказана, поскольку при этом возможно усиление его симптомов.

При стенокардии напряжения подобранная доза препарата должна обеспечивать ЧСС в покое в пределах 55-60 уд./мин, при нагрузке - не более 110 уд./мин. У курильщиков эффективность препарата может быть ниже.

При назначении препарата больным сахарным диабетом следует более часто контролировать показатели

углеводного обмена и при необходимости корректировать дозу инсулина и пероральных гипогликемических средств. При сахарном диабете препарат может маскировать тахикардию, вызванную гипогликемией. В отличие от неселективных бета-адреноблокаторов практически не усиливает вызванную инсулином гипогликемию и не задерживает восстановление концентрации глюкозы в крови до нормального уровня.

Препараты, снижающие запасы катехоламинов (например, резерпин), могут усилить действие препарата Эгилок Ретард, поэтому пациенты, принимающие такие сочетания препаратов, должны находиться под постоянным контролем врача на предмет выявления чрезмерного снижения АД и брадикардии.

Пациентам с тяжелой почечной недостаточностью рекомендуется осуществлять контроль функции почек (1 раз в 4-5 месяцев).

Биодоступность метопролола может повышаться при циррозе печени.

У пациентов пожилого возраста рекомендуется регулярно контролировать функцию печени. Коррекция режима дозирования требуется только в случае появления у пациентов пожилого возраста нарастающей брадикардии (менее 50 уд./мин), выраженного снижения АД (систолическое АД ниже 100 мм рт.ст.), AV-блокады, бронхоспазма, желудочковых аритмий, тяжелых нарушений функции печени, иногда может потребоваться прекращение лечения.

Следует проводить особый контроль состояния пациентов с депрессивными расстройствами в анамнезе. В случае развития депрессии Эгилок Ретард следует отменить.

Перед любой хирургической операцией врач-анестезиолог должен быть предупрежден, что пациент принимает Эгилок Ретард. Отмену препарата следует провести не менее чем за 48 ч до хирургической операции, за исключением особых случаев, например, тиреотоксикоза или феохромоцитомы. В случаях, когда отмена препарата перед хирургической операцией невозможна, следует выбрать средство для общей анестезии с минимальным отрицательным инотропным действием.

При одновременном применении препарата Эгилок Ретард с клонидином в случае отмены Эгилока Ретард клонидин следует отменять через несколько дней во избежание развития гипертонического криза.

При резком прекращении лечения может возникнуть синдром отмены (усиление приступов стенокардии, повышения АД), поэтому отмену препарата проводят постепенно, сокращая дозу в течение 10 дней. Особое внимание при отмене препарата необходимо уделять пациентам со стенокардией.

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

Принимая во внимание, что препарат содержит сахарозу, его не рекомендуется назначать пациентам с непереносимостью фруктозы, нарушениями всасывания глюкозы/галактозы, а также с недостаточностью сахаразы/изомальтазы.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С осторожностью следует назначать препарат при хронической почечной недостаточности.

У пожилых пациентов, пациентов с нарушениями функции почек, а также при необходимости проведения гемодиализа изменения режима дозирования не требуется.

При нарушениях функции печени

Состорожностью следует назначать препарат при печеночной недостаточности.

У пациентов с нарушениями функции печени дозу препарата следует подбирать индивидуально в зависимости от клинического состояния.

Применение в пожилом возрасте

Состорожностью следует назначать препарат пациентам пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказано: возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

Эгилор Ретард

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°C. Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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