

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Эгилок, 25 мг, таблетки

Эгилок, 50 мг, таблетки

Эгилок, 100 мг, таблетки

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: метопролол.

Эгилок, 25 мг, таблетки

Каждая таблетка содержит 25 мг метопролола тартрата.

Эгилок, 50 мг, таблетки

Каждая таблетка содержит 50 мг метопролола тартрата.

Эгилок, 100 мг, таблетки

Каждая таблетка содержит 100 мг метопролола тартрата.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: карбоксиметилкрахмал натрия (см. раздел 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки.

Эгилок, 25 мг, таблетки

Белые или почти белые, круглые, двояковыпуклые таблетки с крестообразной разделительной линией и двойным скосом (форма «двойной снеп») на одной стороне и с гравировкой E 435 – на другой стороне, без запаха.

Линия разлома (риска) нанесена лишь для облегчения разламывания таблетки при возникновении затруднений при ее проглатывании целиком, а не для деления на равные дозы.

Эгилок, 50 мг, таблетки

Белые или почти белые, круглые, двояковыпуклые таблетки, с риской на одной стороне и с гравировкой E 434 – на другой стороне, без запаха.

Линия разлома (риска) нанесена лишь для облегчения разламывания таблетки при возникновении затруднений при ее проглатывании целиком, а не для деления на равные дозы.

Эгилок, 100 мг, таблетки

Белые или почти белые, круглые, двояковыпуклые таблетки, с фаской, с риской на одной стороне и с гравировкой E 432 – на другой стороне, без запаха.

Линия разлома (риска) нанесена лишь для облегчения разламывания таблетки при возникновении затруднений при ее проглатывании целиком, а не для деления на равные дозы.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат Эгилок показан к применению у взрослых пациентов.

- Артериальная гипертензия (АГ): снижение артериального давления (АД) и уменьшение риска сердечно-сосудистой и коронарной смерти (включая внезапную смерть).
- Стенокардия.
- Нарушения ритма сердца, включая суправентрикулярную тахикардию.
- В комплексной терапии после инфаркта миокарда (ИМ).
- Функциональные нарушения сердечной деятельности, сопровождающиеся тахикардией.
- Профилактика приступов мигрени.
- Гипертиреоз (комплексная терапия).

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

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

Артериальная гипертензия (АГ): снижение АД и уменьшение риска сердечно-сосудистой и коронарной смерти (включая внезапную смерть)

100–200 мг препарата Эгилок однократно утром или в 2 приема (утром и вечером). При мягкой или умеренной степени артериальной гипертензии начальная доза 25–50 мг два раза в день (утром и вечером). При необходимости дозу можно увеличить или добавить другое антигипертензивное средство.

Длительная антигипертензивная терапия 100–200 мг препарата Эгилок в сутки позволяет снизить общую смертность, включая внезапную смерть, а также частоту возникновения инсультов и нарушений коронарного кровообращения у пациентов с АГ.

Стенокардия

Начальная доза 25–50 мг от двух до трех раз в сутки. При необходимости суточную дозу можно постепенно повысить до 200 мг в сутки в 2 приема (утром и вечером). При необходимости к терапии может быть добавлен другой антиангинальный препарат.

Нарушения ритма сердца, включая суправентрикулярную тахикардию

Начальная доза от 25 до 50 мг два или три раза в день. При необходимости суточную дозу можно постепенно повысить до 200 мг в сутки в 2 приема (утром и вечером). При необходимости к терапии может быть добавлен другой антиаритмический препарат.

В комплексной терапии после инфаркта миокарда (ИМ)

Лечение в остром периоде

При развитии симптомов, указывающих на острый инфаркт миокарда (ОИМ), следует как можно скорее начать внутривенное введение метопролола.

Данную терапию следует начинать в отделении кардиореанимации или аналогичном незамедлительно после стабилизации показателей гемодинамики пациента. Следует провести три болюсные инъекции по 5 мг с 2-минутным интервалом в зависимости от гемодинамического состояния пациента (см. раздел 4.3. Противопоказания).

Если пациент хорошо перенес внутривенное введение полной дозы препарата (15 мг), через 15 минут после последней внутривенной инъекции следует назначить препарат Эгилок в дозе 50 мг 4 раза в сутки и продолжать его применение в течение 48 часов.

Если пациент не переносит внутривенное введение полной дозы препарата (15 мг), следует с осторожностью назначать препарат для приема внутрь, начиная с более низкой дозы.

Поддерживающая терапия

Поддерживающая доза составляет 200 мг в сутки в 2 приема (утром и вечером). Назначение препарата Эгилок в дозе 200 мг в сутки позволяет снизить смертность у пациентов, перенесших ИМ, и снизить риск развития повторного ИМ (в том числе и у пациентов с сахарным диабетом).

Функциональные нарушения сердечной деятельности, сопровождающиеся тахикардией

100 мг препарата Эгилок (по 50 мг 2 раза в сутки), рекомендуется принимать таблетку утром. При необходимости доза может быть увеличена до 200 мг.

Профилактика приступов мигрени

100–200 мг в сутки в 2 приема (утром и вечером).

Гипертиреоз (комплексная терапия)

150–200 мг в сутки в 3–4 приема.

Особые группы пациентов

Пациенты с почечной недостаточностью

Нет необходимости корректировать дозу у пациентов с нарушением функции почек.

Пациенты с печеночной недостаточностью

Обычно из-за низкой степени связи с белками плазмы коррекция дозы метопролола не требуется. Однако при тяжелом нарушении функции печени (у пациентов с тяжелой формой цирроза печени или портокавальным анастомозом) может потребоваться снижение дозы.

Лица пожилого возраста

Нет необходимости корректировать дозу у пациентов пожилого возраста.

Дети

Безопасность и эффективность применения препарата у детей в возрасте до 18 лет не установлены.

Способ применения

Внутрь.

Таблетки следует принимать натощак.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к метопрололу, другим β -адреноблокаторам или любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1.;
- Атриовентрикулярная блокада (AV) II и III степени;
- Сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;
- Постоянная или интермиттирующая терапия инотропными средствами, действующими как β -адреномиметики;
- Клинически значимая синусовая брадикардия;
- Синдром слабости синусового узла (у пациентов без функционирующего постоянного электрокардиостимулятора);
- Кардиогенный шок;
- Выраженные нарушения периферического кровообращения;
- Артериальная гипотензия;

- Препарат Эгилек противопоказан при ОИМ при частоте сердечных сокращений (ЧСС) ниже 45 ударов в минуту, с интервалом PQ более 0,24 секунд или систолическим АД ниже 100 мм рт.ст.;
- При серьезных периферических сосудистых заболеваниях при угрозе гангрены;
- Пациентам, получающим β -адреноблокаторы, противопоказано внутривенное введение блокаторов «медленных» кальциевых каналов типа верапамила;
- Возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

Препарат Эгилек следует принимать с осторожностью:

AV блокада I степени, стенокардия Принцметала, бронхиальная астма, хроническая обструктивная болезнь легких, сахарный диабет, тяжелая почечная недостаточность, беременность, период лактации.

Пациентам, принимающим β -адреноблокаторы, не следует вводить внутривенно блокаторы «медленных» кальциевых каналов типа верапамила.

Пациентам с обструктивной болезнью легких не рекомендуется назначать β -адреноблокаторы. В случае плохой переносимости других антигипертензивных средств или их неэффективности, можно назначать метопролол, поскольку он является селективным препаратом. Необходимо назначать минимально эффективную дозу, при необходимости возможно назначение β_2 -адреномиметика.

При применении β_1 -адреноблокаторов риск их влияния на углеводный обмен или возможность маскирования симптомов гипогликемии значительно меньше, чем при применении неселективных β -адреноблокаторов.

У пациентов с хронической сердечной недостаточностью в стадии декомпенсации необходимо добиться стадии компенсации как до, так и во время лечения препаратом.

Пациентам со стенокардией Принцметала не рекомендуется назначать неселективные β -адреноблокаторы.

Очень редко у пациентов с нарушением атриовентрикулярной проводимости может наступать ухудшение (возможный исход – AV-блокада). Если на фоне лечения развилась брадикардия, дозу препарата Эгилек необходимо уменьшить или следует постепенно отменить препарат.

Метопролол может ухудшать симптомы нарушения периферического кровообращения, в основном, вследствие снижения АД.

Следует проявлять осторожность при назначении препарата пациентам с тяжелой почечной недостаточностью, при метаболическом ацидозе, совместном назначении с сердечными гликозидами.

Пациентам с феохромоцитомой параллельно с препаратом Эгилок следует назначать α -адреноблокатор.

У пациентов с циррозом печени биодоступность метопролола увеличивается.

В случае хирургического вмешательства следует проинформировать врача-анестезиолога, что пациент принимает β -адреноблокатор.

Следует избегать резкой отмены препарата. При необходимости отмены препарата ее следует проводить постепенно. У большинства пациентов прием препарата можно отменить за 14 дней. Дозу препарата снижают постепенно, в несколько приемов, до достижения конечной дозы 25 мг 1 раз в сутки. Пациенты с ишемической болезнью сердца должны находиться под тщательным наблюдением врача во время отмены препарата.

У пациентов, принимающих β -адреноблокаторы, анафилактический шок протекает в более тяжелой форме.

Вспомогательные вещества

Данный препарат содержит менее 1 ммоль (23 мг) натрия на одну таблетку, то есть, по сути, не содержит натрия.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Следует избегать совместного назначения препарата Эгилок со следующими лекарственными средствами:

Производные барбитуровой кислоты: барбитураты (исследование проводилось с фенобарбиталом) незначительно усиливают метаболизм метопролола вследствие индукции ферментов.

Пропафенон: при назначении пропафенона четырем пациентам, получавшим лечение метопрололом, отмечалось увеличение плазменной концентрации метопролола в 2-5 раз, при этом у двух пациентов отмечались побочные эффекты, характерные для метопролола. Данное взаимодействие было подтверждено в ходе исследования на 8 добровольцах. Вероятно, взаимодействие обусловлено ингибированием пропафеноном, подобно хинидину, метаболизма метопролола посредством системы цитохрома CYP2D6. Принимая во внимание тот факт, что пропафенон обладает свойствами β -

адреноблокатора, совместное назначение метопролола и пропранолола не представляется целесообразным.

Верапамил: комбинация β -адреноблокаторов (атенолола, пропранолола и пиндолола) и верапамила может вызывать брадикардию и приводить к снижению АД. Верапамил и β -адреноблокаторы имеют взаимодополняющий ингибирующий эффект на атриовентрикулярную проводимость и функцию синусового узла.

Комбинация препарата Эгилок со следующими лекарственными средствами может потребовать коррекции дозы:

Антиаритмические средства I класса: сочетание антиаритмических средства I класса и β -адреноблокаторов может приводить к усилению отрицательного инотропного эффекта, что может быть причиной серьезных гемодинамических побочных эффектов у пациентов с нарушенной функцией левого желудочка. Также следует избегать подобной комбинации у пациентов с синдромом слабости синусового узла и нарушением атриовентрикулярной проводимости. Взаимодействие описано на примере дизопирамида.

Амиодарон: совместное применение амиодарона и метопролола может приводить к выраженной синусовой брадикардии. Принимая во внимание крайне длительный период полувыведения ($T_{1/2}$) амиодарона (50 дней), следует учитывать возможное взаимодействие спустя продолжительное время после отмены амиодарона.

Дилтиазем: дилтиазем и β -адреноблокаторы взаимно усиливают ингибирующий эффект на атриовентрикулярную проводимость и функцию синусового узла. При комбинации метопролола с дилтиаземом отмечались случаи выраженной брадикардии.

Нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП): НПВП ослабляют антигипертензивный эффект β -адреноблокаторов. Данное взаимодействие документировано для индометацина. Не отмечено описанного взаимодействия для сулиндака. В исследованиях с диклофенаком описанной реакции не отмечалось.

Дифенгидрамин: дифенгидрамин уменьшает клиренс метопролола до α -гидроксиметопролола в 2,5 раза. Одновременно наблюдается усиление действия метопролола.

Эпинефрин (адреналин): сообщалось о 10 случаях выраженной АГ и брадикардии у пациентов, принимавших неселективные β -адреноблокаторы (включая пиндолол и пропранолол) и получавших эпинефрин (адреналин). Взаимодействие отмечено и в группе здоровых добровольцев. Предполагается, что подобные реакции могут наблюдаться и при применении эпинефрина совместно с местными анестетиками при

случайном попадании в сосудистое русло. Предполагается, что этот риск гораздо ниже при применении кардиоселективных β -адреноблокаторов.

Хинидин: хинидин ингибирует метаболизм метопролола у особой группы пациентов с быстрым гидроксилированием (в Швеции примерно 90% населения), вызывая, главным образом, значительное увеличение плазменной концентрации метопролола и усиление β -блокады. Полагают, что подобное взаимодействие характерно и для других β -адреноблокаторов, в метаболизме которых участвует CYP2D6.

Клонидин: гипертензивные реакции при резкой отмене клонидина могут усиливаться при совместном приеме β -адреноблокаторов. При совместном применении, в случае отмены клонидина, прекращение приема β -адреноблокаторов следует начинать за несколько дней до отмены клонидина.

Рифампицин: рифампицин может усиливать метаболизм метопролола, уменьшая плазменную концентрацию метопролола.

Сердечные гликозиды: сердечные гликозиды при совместном применении с β -адреноблокаторами могут замедлять атриовентрикулярную проводимость и вызывать брадикардию.

Концентрация метопролола в плазме крови может повышаться при совместном применении с циметидином, гидралазином, алкоголем, селективными ингибиторами обратного захвата серотонина, такими как пароксетин, флуоксетин и сертралин. Пациенты, одновременно принимающие метопролол и другие β -адреноблокаторы (глазные капли) или ингибиторы моноаминоксидазы (МАО), должны находиться под тщательным наблюдением. На фоне приема β -адреноблокаторов ингаляционные анестетики усиливают кардиодепрессивное действие. На фоне приема β -адреноблокаторов пациентам, получающим пероральные гипогликемические средства, может потребоваться коррекция дозы последних.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Препарат Эгилек не следует назначать во время беременности и в период грудного вскармливания, за исключением тех случаев, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода и/или ребенка. В целом, β -адреноблокаторы уменьшают плацентарный кровоток, что может приводить к замедлению роста плода, внутриутробной гибели плода, выкидышу и преждевременным родам. В связи с чем при применении метопролола у беременной женщины следует проводить соответствующее

наблюдение за состоянием плода и матери. β -адреноблокаторы могут вызвать брадикардию у плода, новорожденного или ребенка, находящегося на грудном вскармливании, что следует учитывать при назначении этих препаратов в последнем триместре беременности и непосредственно перед родами.

Отмену препарата Эгилек следует проводить постепенно за 48–72 часа до планируемых родов. Если это невозможно, следует проводить наблюдение за состоянием новорожденного в течение 48–72 часов после родов для выявления возможных признаков и симптомов блокады β -адренорецепторов (например, осложнений со стороны сердца и легких).

Лактация

Метопролол концентрируется в грудном молоке в количестве, которое примерно в 3 раза превышает количество, обнаруженное в плазме крови матери. Риск возникновения неблагоприятных эффектов у ребенка, находящегося на грудном вскармливании, является низким при применении препарата в терапевтических дозах. Однако следует проводить наблюдение за ребенком, находящимся на грудном вскармливании, для выявления признаков блокады β -адренорецепторов.

Фертильность

Данные о влиянии метопролола на фертильность отсутствуют.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

При применении препарата возможны эпизоды головокружения или общей слабости, в связи с чем необходимо воздержаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

Препарат Эгилек хорошо переносится пациентами, нежелательные реакции в основном являются легкими и обратимыми.

В результате клинических исследований или при применении метопролола в клинической практике были описаны следующие нежелательные эффекты. Во многих случаях причинно-следственная связь с приемом метопролола не была установлена.

Резюме нежелательных реакций

Для оценки частоты случаев применяли следующие критерии: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1\,000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10\,000$, но $< 1/1\,000$), очень редко ($< 1/10\,000$).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Очень редко: тромбоцитопения.

Нарушения метаболизма и питания

Нечасто: увеличение массы тела.

Психические нарушения

Нечасто: депрессия, ослабление внимания, сонливость или бессонница, ночные кошмары;

Редко: повышенная нервная возбудимость, тревожность;

Очень редко: амнезия/нарушение памяти, подавленность, галлюцинации.

Нарушения со стороны нервной системы

Очень часто: повышенная утомляемость;

Часто: головокружение, головная боль;

Нечасто: парестезия;

Очень редко: нарушение вкусовых ощущений.

Нарушения со стороны органа зрения

Редко: нарушение зрения, сухость и/или раздражение глаз, конъюнктивит.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта

Очень редко: звон в ушах.

Нарушения со стороны сердца

Часто: брадикардия, ощущение сердцебиения;

Нечасто: временное усиление симптомов сердечной недостаточности, АВ блокада I степени, кардиогенный шок у пациентов с ОИМ;

Редко: другие нарушения сердечной проводимости, аритмии.

Нарушения со стороны сосудов

Часто: ортостатическая гипотензия (очень редко сопровождающаяся обмороком), похолодание конечностей;

Очень редко: гангрена у пациентов с предшествующими тяжелыми нарушениями периферического кровообращения.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Часто: одышка при физической нагрузке;

Нечасто: бронхоспазм;

Редко: ринит.

Желудочно-кишечные нарушения

Часто: тошнота, боль в животе, диарея, запор;

Нечасто: рвота;

Редко: сухость во рту.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

Редко: нарушение функции печени;

Очень редко: гепатит.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Нечасто: кожная сыпь (в виде крапивницы), повышенная потливость;

Редко: выпадение волос;

Очень редко: фотосенсибилизация, обострение псориаза.

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани

Нечасто: судороги;

Очень редко: артралгия.

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез

Редко: импотенция/сексуальная дисфункция.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Телефон: +7 (800) 550-99-03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:
<https://www.roszdravnadzor.gov.ru/>

Республика Казахстан

РГП на ПХВ «Национальный центр экспертизы лекарственных средств и медицинских изделий» Комитета медицинского и фармацевтического контроля Министерства здравоохранения Республики Казахстан

Адрес: 010000, г. Астана, ул. А. Иманова, 13

Телефон: 8 (7172) 235 135

Электронная почта: farm@dari.kz

Сайт: <http://www.ndda.kz/>

Республика Беларусь

УП «Центр экспертиз и испытаний в здравоохранении»

Адрес: 220037, г. Минск, пер. Товарищеский, 2а

Телефон: +375 (17) 242-00-29

Факс: +375 (17) 242-00-29

Электронная почта: rcpl@rceth.by

Сайт: <http://www.rceth.by/>

Республика Армения

«Научный Центр экспертизы лекарств и медицинских технологий им. академика Э. Габриеляна» АОЗТ

Адрес: 0051, г. Ереван, пр. Комитаса 49/5

Телефон: (+374 60)83-00-73, (+374 10) 23-08-96; (+374 10)23-16-82

Электронная почта: vigilance@pharm.am

Сайт: <http://www.pharm.am>

4.9. Передозировка

Симптомы

Последствиями передозировки препарата Эгилек могут быть выраженное снижение АД, синусовая брадикардия, АВ блокада, сердечная недостаточность, кардиогенный шок, остановка сердца, бронхоспазм, нарушение сознания/кома, тошнота, рвота и цианоз.

Сопутствующее употребление алкоголя, прием антигипертензивных средств, хинидина или барбитуратов могут привести к ухудшению состояния пациента.

Первые признаки передозировки могут проявляться в течение 20 минут – 2-х часов после приема препарата.

Лечение

Принять активированный уголь, при необходимости выполнить промывание желудка. В случае выраженного снижения АД, брадикардии или угрозы сердечной недостаточности следует вводить β_1 -адреномиметик (например, добутамин) внутривенно с интервалом 2–5 минут или инфузионно до достижения терапевтического эффекта. В случае недоступности селективного β_1 -агониста можно вводить внутривенно допамин или атропина сульфат для блокады блуждающего нерва.

Если терапевтический эффект не достигнут, можно использовать другие симпатомиметики, такие как добутамин или норэпинефрин (норадреналин).

Можно ввести глюкагон в дозе 1–10 мг. Иногда может возникнуть необходимость применения электрокардиостимулятора. Для купирования бронхоспазма следует вводить внутривенно β_2 -адреномиметик.

Необходимо учитывать, что дозы антидотов, необходимые для устранения симптомов, возникающих при передозировке β -адреноблокаторов, намного выше терапевтических, поскольку β -адренорецепторы находятся в связанном состоянии с β -адреноблокатором.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: бета-адреноблокаторы; селективные бета-адреноблокаторы

Код АТХ: C07AB02

Механизм действия, фармакодинамические эффекты

Метопролол – β_1 -адреноблокатор, блокирующий β_1 -рецепторы в дозах значительно меньших, чем дозы, требующиеся для блокирования β_2 -рецепторов. Метопролол обладает незначительным мембраностабилизирующим эффектом и не проявляет активности частичного агониста. Метопролол снижает или ингибирует агонистическое действие, которое оказывают на сердечную деятельность катехоламины, выделяющиеся при нервных и физических стрессах. Это означает, что метопролол обладает способностью препятствовать увеличению ЧСС, минутного объема и усилению

сократимости сердца, а также повышению АД, вызываемых резким выбросом катехоламинов.

Клиническая эффективность и безопасность

Пациентам с симптомами обструктивных заболеваний легких при необходимости можно назначать метопролол в сочетании с β_2 -адреномиметиками. При совместном применении с β_2 -адреномиметиками препарат Эгилок в терапевтических дозах в меньшей степени влияет на вызываемую β_2 -адреномиметиками бронходилатацию, чем неселективные β -адреноблокаторы.

Метопролол в меньшей степени, чем неселективные β -адреноблокаторы влияет на продукцию инсулина и углеводный метаболизм. Влияние препарата Эгилок на реакцию сердечно-сосудистой системы в условиях гипогликемии значительно менее выражено по сравнению с неселективными β -адреноблокаторами.

Клинические исследования показали, что препарат Эгилок может вызывать незначительное повышение концентрации триглицеридов и уменьшение содержания свободных жирных кислот в крови. В некоторых случаях отмечалось незначительное уменьшение фракции липопротеинов высокой плотности (ЛПВП), что менее выражено, чем в случае применения неселективных β -адреноблокаторов. Однако в одном из клинических исследований было показано значительное снижение концентрации общего холестерина в сыворотке крови при лечении метопрололом в течение нескольких лет.

Качество жизни в период лечения метопрололом не ухудшается или улучшается. Улучшение качества жизни при лечении метопрололом наблюдали у пациентов после ИМ.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Метопролол почти полностью абсорбируется после приема внутрь. При приеме препарата в пределах терапевтических доз концентрация препарата в плазме крови находится в линейной зависимости от принятой дозы. Максимальная концентрация в плазме крови ($C_{\max}$) достигается через 1,5–2 часа после приема препарата.

После приема внутрь первой дозы метопролола системного кровообращения достигает около 50% дозы. При повторных приемах показатель системной биодоступности возрастает до 70%. Прием препарата вместе с пищей может повысить системную биодоступность на 30–40%.

Распределение

Связь с белками плазмы крови низкая, около 5–10%.

Биотрансформация

Метопролол подвергается окислительному метаболизму в печени с образованием 3 основных метаболитов, ни один из которых не обладает клинически значимым β -блокирующим эффектом.

Элиминация

Около 5% от принятой дозы выводится почками в неизменном виде, в отдельных случаях этот показатель может достигать 30%.

Средний $T_{1/2}$ метопролола из плазмы крови составляет около 3,5 часов (минимально – 1 час, максимально – 9 часов). Плазменный клиренс составляет приблизительно 1 л/мин.

Особые группы пациентов

Лица пожилого возраста

У пациентов пожилого возраста не наблюдается значительных изменений в фармакокинетике метопролола по сравнению с пациентами молодого возраста.

Почечная недостаточность

Системная биодоступность и выведение метопролола не меняется у пациентов со сниженной функцией почек. Выведение метаболитов у таких пациентов, однако, снижено. Значительное накопление метаболитов наблюдалось у пациентов со скоростью клубочковой фильтрации менее 5 мл/мин. Однако такое накопление метаболитов не усиливает β -блокирующий эффект.

Печеночная недостаточность

У пациентов со сниженной функцией печени фармакокинетика метопролола (в связи с низким уровнем связи с белками) меняется незначительно. Однако у пациентов с тяжелой формой цирроза печени или портокавальным анастомозом биодоступность метопролола может увеличиваться, а общий клиренс уменьшаться. У пациентов с портокавальным анастомозом общий клиренс составлял приблизительно 300 мл/мин, а площадь под кривой «концентрация в плазме крови – время» (AUC) была в 6 раз больше по сравнению с аналогичным показателем у здоровых пациентов.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Целлюлоза микрокристаллическая

Карбоксиметилкрахмал натрия (тип А)

Кремния диоксид коллоидный безводный
Повидон (К-90)
Магния стеарат

6.2. Несовместимость

Не применимо

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре от 15 до 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

Эгилок, 25 мг, таблетки

По 60 таблеток в стеклянном флаконе коричневого цвета с ПЭ крышкой с амортизатором-гармошкой, с контролем первого вскрытия. 1 флакон вместе с листком-вкладышем упакован в картонную пачку.

Эгилок, 50 мг, таблетки

По 60 таблеток в стеклянном флаконе коричневого цвета с ПЭ крышкой с амортизатором-гармошкой, с контролем первого вскрытия. 1 флакон вместе с листком-вкладышем упакован в картонную пачку.

Эгилок, 100 мг, таблетки

По 30 или 60 таблеток в стеклянном флаконе коричневого цвета с ПЭ крышкой с амортизатором-гармошкой, с контролем первого вскрытия. 1 флакон вместе с листком-вкладышем упакован в картонную пачку.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата, и другие манипуляции с препаратом

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Венгрия

ЗАО «Фармацевтический завод ЭГИС»

1106, Будапешт, ул. Керестури, 30–38

Телефон: (+36–1) 803-5555

Электронная почта: mailbox@egis.hu

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ООО «ЭГИС-РУС»

121552, г. Москва, ул. Ярцевская, д. 19, блок В, этаж 13

Телефон: +7 (495) 363-39-66

Электронная почта: pharmacovigilance@egis.ru

Республика Казахстан

Представительство ЗАО «Фармацевтический завод ЭГИС» в Республике Казахстан

050060, г. Алматы, ул. Жарокова 286 Г.

Телефон: + 7 (727) 247 63 34, + 7 (727) 247 63 33.

Электронная почта: egis@egis.kz

Республика Беларусь

Представительство ЗАО «Фармацевтический завод ЭГИС» (Венгрия) в Республике Беларусь

220053, г. Минск, пер. Ермака, д. 6А.

Телефон: (017) 380-00-80, (017) 227-35-51, (017) 227-35-52.

Факс: (017) 227-35-53.

Электронная почта: info@egis.by

Республика Армения

Представительство ЗАО «Фармацевтический завод ЭГИС» в Республике Армения

0010, г. Ереван, ул. Анрапетутян, дом 67, 4 этаж.

Телефон: +374-10-574686.

Электронная почта: info@egis.am

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

ЛП-№(000231)-(РГ-RU)

**9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ,
ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)**

Дата первой регистрации в ЕАЭС: 17.05.2021

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Эгилек доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://eec.eaeunion.org>

V_0007