

**МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ  
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ**

**ИНСТРУКЦИЯ  
по применению лекарственного препарата для медицинского применения  
Эгилок®**

**Регистрационный номер:** \_\_\_\_\_  
**Торговое название:** Эгилок®

**Международное непатентованное название:** метопролол

**Лекарственная форма:** таблетки

**Состав:** каждая таблетка содержит 25 мг, 50 мг или 100 мг действующего вещества метопролола тартрата. Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая 41,5/83/166 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) 7,5/15/30 мг, кремния диоксид коллоидный безводный 2/4/8 мг, повидон (К-90) 2/4/8 мг, магния стеарат 2/4/8 мг.

**Описание:** Таблетки 25 мг: Белые или почти белые, круглые, двояковыпуклые таблетки с крестообразной разделительной линией и двойным скосом (форма «двойной снеп») на одной стороне и с гравировкой Е 435 - на другой стороне, без запаха.

Таблетки 50 мг: Белые или почти белые, круглые, двояковыпуклые таблетки, с риской на одной стороне и с гравировкой Е 434 - на другой стороне, без запаха.

Таблетки 100 мг: Белые или почти белые, круглые, двояковыпуклые таблетки, с фаской, с риской на одной стороне и с гравировкой Е 432 - на другой стороне, без запаха.

**Фармакотерапевтическая группа:** бета<sub>1</sub>-адреноблокатор селективный

**Код ATX:** C07AB02

## **ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА**

### **Фармакодинамика:**

Механизм действия:

Метопролол подавляет влияние повышенной активности симпатической системы на сердце, а также вызывает быстрое снижение частоты сердечного ритма, сократимости, сердечного выброса и артериального давления.

При *артериальной гипертензии* метопролол снижает артериальное давление у пациентов в положении «стоя» и «лежа». Длительный антигипертензивный эффект препарата связан с постепенным снижением общего периферического сосудистого сопротивления.

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 не смертельный инфаркт и инсульт).

Как и другие бета-адреноблокаторы, метопролол снижает потребность миокарда в кислороде за счет снижения системного артериального давления, частоты сердечных сокращений и сократимости миокарда. Снижение частоты сердечных сокращений 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 метопролол тартрат, принимаемый начиная с низких доз ( $2 \times 5$  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. Он не увеличивает продолжительность приступов гипогликемии.

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

#### **Фармакокинетика:**

Метопролол быстро и полностью всасывается в желудочно-кишечном тракте. Для препарата характерна линейная фармакокинетика в терапевтическом диапазоне доз.

Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 1,5-2 ч после приема внутрь. После всасывания метопролол в значительной степени подвергается метаболизму первичного прохождения через печень. Биодоступность метопролола составляет примерно 50% при однократном и примерно 70% при регулярном приеме.

Прием одновременно с пищей может повысить биодоступность метопролола на 30-40%.

Метопролол незначительно (~ 5-10%) связывается с белками плазмы крови.

Объем распределения составляет 5,6 л/кг.

Метопролол метаболизируется в печени изоферментами цитохрома Р-450. Метаболиты не обладают фармакологической активностью.

Период полувыведения ( $t_{1/2}$ ) 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%.

Существенных изменений фармакокинетики метопролола у пожилых пациентов не выявлено.

Нарушение функции почек не влияет на системную биодоступность или выведение метопролола. Однако в этих случаях наблюдается снижение экскреции метаболитов. При тяжелой почечной недостаточности (скорость клубочковой фильтрации менее 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 шунта биодоступность может возрасти, а общий клиренс из организма снизиться. После портокавального шунтирования общий клиренс препарата из организма составляет примерно 0,3 л/мин, а площадь под кривой концентрации-времени увеличивается примерно в 6 раз по сравнению с таковой у здоровых добровольцев.

## **ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ**

Артериальная гипертензия (в монотерапии или (при необходимости) в сочетании с другими гипотензивными препаратами); функциональные нарушения сердечной деятельности, сопровождающиеся тахикардией.

Ишемическая болезнь сердца: инфаркт миокарда (вторичная профилактика – комплексная терапия), профилактика приступов стенокардии.

Нарушения ритма сердца (наджелудочковая тахикардия, желудочковая экстрасистолия).

Гипертриеоз (комплексная терапия).

Профилактика приступов мигрени.

## **ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ**

Повышенная чувствительность к метопрололу или любому другому компоненту препарата, а также другим бета-адреноблокаторам; атриовентрикулярная блокада (AV) II или III степени; синоатриальная блокада; синусовая брадикардия (ЧСС менее 50/мин), синдром слабости синусового узла; кардиогенный шок; тяжелые нарушения периферического кровообращения; сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, возраст до 18 лет (ввиду отсутствия достаточных клинических данных), одновременное в/в введение верапамила, тяжелая форма бронхиальной астмы и феохромоцитома без одновременного применения альфа-адреноблокаторов.

В связи с недостаточностью клинических данных Эгиолок® противопоказан при остром инфаркте миокарда, сопровождающимся частотой сердечных сокращений ниже 45 уд/мин, с интервалом PQ более 240 мс, и системическим артериальным давлением ниже 100 мм рт.ст.

## **С ОСТОРОЖНОСТЬЮ**

Сахарный диабет, метаболический ацидоз, бронхиальная астма, хроническая обструктивная болезнь легких (ХОБЛ), почечная/печеночная недостаточность, миастения, феохромоцитома (при одновременном применении с альфа-адреноблокаторами), тиреотоксикоз, AV блокада I степени, депрессия (в т.ч. в анамнезе), псориаз, облитерирующие заболевания периферических сосудов ("перемежающаяся" хромота, синдром Рейно), беременность, период лактации, пожилой возраст, у пациентов с отягощенным аллергологическим анамнезом (возможно снижение ответа при применении адреналина).

## **ПРИМЕНЕНИЕ ПРИ БЕРЕМЕННОСТИ И ЛАКТАЦИИ**

Применение препарата не рекомендуется во время беременности. Применение препарата возможно только в том случае, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Если прием препарата необходим, следует тщательно следить за плодом, а затем и за новорожденным в течение нескольких дней (48 - 72 ч) после родов, так как возможно развитие брадикардии, угнетение дыхания, снижение артериального давления и гипогликемия.

Несмотря на то, что при приеме терапевтических доз метопролола лишь небольшие количества препарата выделяются в грудное молоко, новорожденного следует держать под наблюдением (возможна брадикардия). Применение препарата в период лактации не рекомендуется. При необходимости применения препарата в период лактации рекомендуется прекратить грудное вскармливание.

## **СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ**

Эгиолок® таблетки принимают внутрь. Таблетки можно принимать с пищей или вне зависимости от приема пищи. При необходимости таблетку можно разломить пополам.

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

Рекомендуемые дозы:

***Артериальная гипертензия***

При мягкой или умеренной степени артериальной гипертензии начальная доза 25-50 мг два раза в день (утром и вечером). При необходимости суточную дозу можно постепенно повысить до 100-200 мг/сут или добавить другое гипотензивное средство.

***Стенокардия***

Начальная доза 25-50 мг от двух до трех раз в сутки. В зависимости от эффекта, эту дозу можно постепенно повысить до 200 мг в сутки или добавить другой антиангинальный препарат.

***Поддерживающая терапия после инфаркта миокарда***

Обычная суточная доза – 100 - 200 мг/сут, разделенная на два приема (утром и вечером).

***Нарушения ритма сердца***

Начальная доза от 25 до 50 мг два или три раза в день. При необходимости суточную дозу можно постепенно повысить до 200 мг/сут или добавить другое противоаритмическое средство.

***Гипертрофия***

Обычная суточная доза составляет 150-200 мг в сутки за 3 - 4 приема.

***Функциональные расстройства сердца, сопровождающиеся ощущением сердцебиения***

Обычная суточная доза составляет 50 мг 2 раза в день (утром и вечером); при необходимости ее можно повысить до 200 мг в два приема.

***Профилактика приступов мигрени***

Обычная суточная доза составляет 100 мг/сут в два приема (утром и вечером); при необходимости ее можно повысить до 200 мг/сут в 2 приема.

***Особые группы пациентов***

При нарушении функции почек изменение режима дозирования не требуется.

При циррозе печени обычно не требуется изменение дозы в связи с низким связыванием метопролола с белками плазмы крови (5-10%). При тяжелой печеночной недостаточности (например, после операции портокавального шунтирования) может возникнуть необходимость в снижении дозы Эгилок®.

У пожилых больных коррекции дозы не требуется.

***ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ***

Эгилок® обычно хорошо переносится пациентами. Побочные эффекты обычно слабые 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:  $\geq 10\%$ , часто: 1-9,9 %, нечасто: 0,1-0,9 %, редко: 0,01-0,09 %, очень редко (включая отдельные сообщения):  $\leq 0,01\%$ .

Со стороны нервной системы: очень часто - повышенная утомляемость; часто - головокружение, головная боль; редко - повышенная возбудимость, тревожность, импотенция/сексуальная дисфункция; 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, атриовентрикулярная блокада I степени; редко - нарушения проводимости, аритмия; очень редко - гангrena (у пациентов с нарушениями периферического кровообращения).

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

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

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

Прием 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 артериального давления, синусовая брадикардия, предсердно-желудочковая блокада, сердечная недостаточность, кардиогенный шок, асистолия, тошнота, рвота, бронхоспазм, цианоз, гипогликемия, потеря сознания, кома.

Перечисленные выше симптомы могут усиливаться при одновременном приеме этанола, гипотензивных препаратов, хинидина и барбитуратов.

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

*Лечение:* необходимо тщательное наблюдение за пациентом (контроль артериального давления, 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 больной в сознании).

В случае чрезмерного снижения АД, брадикардии и угрозе сердечной недостаточности - в/в, с интервалом в 2-5 мин, бета-адреномиметики - до достижения желаемого эффекта или в/в 0.5-2 мг атропина. При отсутствии положительного эффекта - допамин, добутамин или норэpinefrin (норадреналин). При гипогликемии - введение 1-10 мг глюкагона, установка временного водителя ритма. При бронхоспазме следует ввести бета<sub>2</sub>-адреномиметики. При судорогах - медленное в/в введение диазепама. Гемодиализ неэффективен.

## **ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ ПРЕПАРАТАМИ**

Антигипертензивные эффекты препарата Эгилок® и других гипотензивных средств обычно усиливаются. Во избежание артериальной гипотензии необходимо тщательное наблюдение за пациентами, получающими комбинации таких средств. Однако суммацией эффектов антигипертензивных препаратов можно при необходимости пользоваться для достижения эффективного контроля артериального давления.

Одновременное применение метопролола и блокаторов «медленных» кальциевых каналов типа дилтиазема и верапамила может привести к усилению отрицательных инотропного и хронотропного эффектов. Следует избегать внутривенного введения блокаторов кальциевых каналов типа верапамила пациентам, получающим бета-адреноблокаторы.

*Следует соблюдать осторожность при одновременном приеме со следующими средствами:*

Пероральные антиаритмические препараты (типа хинидина и амиодарона) - риск брадикардии, атриовентрикулярной блокады.

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

Другие гипотензивные препараты (особенно группы гуанетидина, резерпина, альфа-метилдофа, клонидина и гуанфацина) из-за риска гипотензии и/или брадикардии.

Прекращение одновременного приема 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 центральную нервную систему, например: снотворные, транквилизаторы, три- и тетрациклические антидепрессанты, нейролептики и этанол повышают риск артериальной гипертензии.

Средства для наркоза (риск угнетения сердечной деятельности).

Альфа- и бета-симпатомиметики (риск артериальной гипертензии, значительной брадикардии; возможность остановки сердца).

Эрготамин (усиление вазоконстрикторного эффекта).

Бета<sub>2</sub>-симпатомиметики (функциональный антагонизм).

Нестероидные противовоспалительные препараты (например, индометацин) - могут ослаблять антигипертензивный эффект.

Эстрогены (возможно снижение антигипертензивного эффекта метопролола).

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

Куареподобные миорелаксанты (усиление нервно-мышечной блокады).

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

Индукторы ферментов (рифамицин 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 моноаминооксидазы требует тщательного медицинского наблюдения.

## **ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ**

Контроль больных, принимающих бета-адреноблокаторы, включает регулярное измерение частоты сердечных сокращений (ЧСС) и артериального давления, концентрации глюкозы крови у больных сахарным диабетом. При необходимости, для больных сахарным диабетом, дозу инсулина или гипогликемических средств для приема внутрь следует подобрать индивидуально. Следует обучить больного методике подсчета ЧСС и проинструктировать о необходимости врачебной консультации при ЧСС менее 50 уд/мин. При приеме дозы выше 200 мг в сутки уменьшается кардиоселективность.

При сердечной недостаточности лечение препаратом Эгилок® начинают только после достижения стадии компенсации сердечной функции.

Возможно усиление выраженности реакций повышенной чувствительности и отсутствие эффекта от введения обычных доз эpineфрина (адреналина) у пациентов с отягощенным аллергологическим анамнезом.

Анафилактический шок может протекать тяжелее у больных, принимающих Эгилок®.

Может усилить симптомы нарушения периферического артериального кровообращения.

Следует избегать резкого прекращения приема препарата Эгилок®. Препарат следует отменять постепенно путем снижения доз в течение примерно 14 дней. Резкая отмена может усилить симптомы стенокардии и повысить риск коронарных нарушений. Особое внимание при отмене препарата необходимо уделить пациентам с заболеванием коронарных артерий.

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 у пациентов с тиреотоксикозом противопоказана, поскольку способна усилить симптоматику.

При сахарном диабете 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. В случае назначения препарата Эгилок® больным сахарным диабетом следует контролировать концентрацию глюкозы крови и при необходимости корректировать дозу инсулина или гипогликемических средств для приема внутрь (см. раздел "Взаимодействие с другими лекарственными препаратами").

При необходимости назначения пациентам с бронхиальной астмой, в качестве сопутствующей терапии назначают бета<sub>2</sub>-адреностимуляторы; при феохромоцитоме -альфа-адреноблокаторами.

При необходимости проведения хирургического вмешательства необходимо предупредить хирурга/анестезиолога о проводимой терапии (выбор средства для общей анестезии с минимальным отрицательным инотропным действием), отмены препарата не рекомендуется. Препараты, снижающие запасы катехоламинов (например, резерпин), могут усилить действие бета-адреноблокаторов, поэтому больные, принимающие такие сочетания препаратов, должны находиться под постоянным наблюдением врача на предмет выявления чрезмерного снижения артериального давления или брадикардии.

У пожилых пациентов рекомендуется регулярно осуществлять контроль функции печени. Коррекция режима дозирования требуется только в случае появления у пациента пожилого возраста нарастающей брадикардии (менее 50 уд/мин), выраженного снижения АД (системическое артериальное давление ниже 100 мм рт.ст.), атриовентрикулярной блокады, бронхоспазма, желудочковых аритмий, тяжелых нарушений функции печени, иногда необходимо прекратить лечение. Пациентам с тяжелой почечной недостаточностью рекомендуется осуществлять контроль функции почек.

Следует проводить особый контроль за состоянием пациентов с депрессивными расстройствами, принимающими метопролол; в случае развития депрессии, вызванной приемом бета-адреноблокаторов, рекомендуется прекратить терапию.

При возникновении прогрессирующей брадикардии следует снизить дозу или прекратить прием препарата.

Из-за отсутствия достаточного количества клинических данных препарат не рекомендуется применять у детей.

**Влияние на способность управлять транспортными средствами и сложной техникой.** Необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и при занятиях потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания (риск развития головокружения и повышенной утомляемости).

## ФОРМА ВЫПУСКА

Таблетки 25 мг: по 60 таблеток во флаконе коричневого стекла с ПЭ крышкой с амортизатором-гармошкой, с контролем первого вскрытия. 1 флакон вместе с инструкцией по применению упакован в картонную пачку. Или по 20 таблеток в блистере из ПВХ/ПВДХ//ал. фольга. 3 блистера вместе с инструкцией по применению упакованы в картонную пачку.

Таблетки 50 мг: по 60 таблеток во флаконе коричневого стекла с ПЭ крышкой с амортизатором-гармошкой, с контролем первого вскрытия. 1 флакон вместе с инструкцией по применению упакован в картонную пачку. Или по 15 таблеток в блистере из ПВХ/ПВДХ//ал. фольга. 4 блистера вместе с инструкцией по применению упакованы в картонную пачку.

Таблетки 100 мг: по 30 или 60 таблеток во флаконе коричневого стекла с ПЭ крышкой с амортизатором-гармошкой, с контролем первого вскрытия. 1 флакон вместе с инструкцией по применению упакован в картонную пачку.

**СРОК ГОДНОСТИ**

5 лет. Не применять после срока годности указанного на упаковке

**УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ**

Хранить при температуре от 15 до 25 °C, в недоступном для детей месте.

**УСЛОВИЯ ОТПУСКА**

**По рецепту**

**ПРОИЗВОДИТЕЛЬ**

ОАО Фармацевтический завод ЭГИС

1106 Будапешт, ул. Керестури, 30-38 ВЕНГРИЯ,  
телефон: (36-1)803-5555, факс: (36-1)803-5529

Представительство ОАО "Фармацевтический завод ЭГИС" (Венгрия) г.Москва  
121108, г. Москва, ул. Ивана Франко, д. 8, телефон: (495) 363-39-66

\* В случае расфасовки и упаковки препарата в России дополнительно указывается:

Расфасовано, упаковано:

ООО СЕРДИКС

Россия, 142150 Московская обл., Подольский р-н, д. Софыино, стр. 1/1

Представитель фирмы



E.B. Творогова