

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ТЪРГОВСКО НАИМЕНОВАНИЕ НА ПРОДУКТА

EGILOK® tablets
ЕГИЛОК таблетки

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложено към разрешение за употреба № 11-6464/29.11.02	
629/19.11.02	<i>Алещев</i>

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Таблетките съдържат 25 mg, 50 mg или 100 mg от лекарственото вещество metoprolol.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетки за перорално приложение

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични приложения

Хипертония:

При лека или умерено тежка степен на хипертония, самостоятелно или в комбинация с диуретици и други антихипертензивни лекарства, Egilok е най-широко използваният селективен β -1 блокер за лечение, особено при пациенти под 60 год.

Ангина пекторис:

При пациенти със стенокардна болка, metoprolol намалява броя на ангинозните пристъпи и подобрява физическото им състояние.

След инфаркт на миокарда:

Намалява вероятността от реинфаркти.

Сърдечни ритъмни нарушения:

Използва се при синусова тахикардия, надкамерна тахикардия, камерни екстрасистоли, аритмии при пролапс на митралната клапа.

Функционални разстройства на сърдечната дейност. Хипертиреозидизъм.
Профилактика на мигренозните пристъпи.



4.2 Дозировка и начин на приложение

Таблетки за перорално приложение.

Дозировката се определя според индивидуалната чувствителност, както следва:

Хипертония: при лека и умерена степен по 50 mg един път дневно (сутрин) или разпределени в два приема (сутрин и вечер). При липса на ефект, дозата може постепенно да бъде увеличена до 100-200 mg и/или да се добавят и други антихипертезивни лекарства.

Максималната дневна доза е 400 mg.

Ангина пекторис: 100-200 mg на ден, разделени на два приема (сутрин и вечер). При тежки случаи дозата може да бъде увеличена до 400 mg.

Ритъмни нарушения: 100-200 mg, разделени в два приема /сутрин и вечер/. При необходимост дозата може да бъде увеличена до 400 mg.

Поддържаща терапия след прекаран инфаркт на миокарда: Обикновено 200 mg дневно, разделени на два приема (сутрин и вечер).

Функционални разстройства на сърдечната дейност, придружени от сърцебиене и при хипертиреозидизъм: 100 mg дневно, разпределени на два приема (сутрин и вечер). При необходимост дозата може да бъде увеличена до 400 mg.

Профилактика на мигренозни пристъпи: 100-200 mg дневно, разделени на два приема (сутрин и вечер).

4.3 Противопоказания

AV-блок втора и трета степен, декомпенсирана конгестивна сърдечна недостатъчност, клинично значима синусова брадикардия, синдром на болния синусов възел, кардиогенен шок, тежки периферни съдови артериални разстройства.

Свръхчувствителност към metoprolol и неговите деривати.

Поради относително малкия брой проучвания, metoprolol не бива да се прилага при сърдечна честота под 45/минута, P-Q интервал по-дълъг от 0.24 секунди, систолно кръвно налягане под 100 mm Hg и/или тежка сърдечна недостатъчност.

4.4 Специални предупреждения и препоръки при употреба

При лечение с metoprolol на пациенти с бронхиална астма е необходимо комбинирането му с β_2 -рецепторен агонист (спрей или таблетна форма) или корекция в дозата на вече прилагания такъв.

При пациенти със захарен диабет е необходимо често проследяване на въглехидратния метаболизъм и, ако е необходимо, трябва да се коригира дозата на инсулина и оралните противодиабетни средства.

Metoprolol може да се използва само при пациенти с компенсирана сърдечна недостатъчност и по време на лечението трябва да се вземат мерки за поддържане на компенсираното състояние.



Много рядко, при налични нарушения в AV-проводимостта и лечение с metoprolol, те могат да се задълбочат и да се развие AV-блок. Metoprolol може да влоши симптомите на периферни съдови разстройства. При пациенти с феохромоцитом, metoprolol трябва да бъде комбиниран с α -блоккер. При пациенти с увредена чернодробна функция или с чернодробна цироза поради намаление на метаболизма може да се увеличи бионаличността на metoprolol. Преди хирургични интервенции е необходимо анестезиологът да бъде уведомен за употребата на metoprolol (виж т. 4.5 Взаимодействия). Спирането на лечението с metoprolol трябва да става с постепенно намаляване на дозата за период от 10 дни. Пациентите със стенокардия трябва да останат под стриктен лекарски контрол при прекратяване на лечението. Анафилактичният шок при пациенти лекувани с metoprolol може да бъде особено тежък.

4.5 Взаимодействие с други лекарства и други видове взаимодействия

Да не се комбинира с:

- verapamil за венозно приложение или други венозни антиаритмични средства от групата на verapamil (риск от асистолия)
- MAO-инхибитори

Внимателно да се комбинира с:

- антиаритмични средства, блокери на калциевите канали от типа на verapamil и diltiazem, както и с парасимпатомиметици (риск от хипотония, брадикардия, AV-блок).
- дигиталисови гликозиди (риск от брадикардия, проводни нарушения), като metoprolol не повлиява положителния инотропен ефект на дигиталисовите лекарства.
- нитрати и други антихипертензивни лекарства, особено от типа на guanethidine, reserpine, α -methyl-dopa, clonidine и guanfacine (риск от хипотония и/или брадикардия). При комбинирано лечение с metoprolol и clonidine, последният трябва да бъде спрял няколко дни след прекратяване на лечението с metoprolol, поради риск от хипертонична криза.
- общи анестетици (кардиодепресивен ефект).
- α - и β -симпатомиметици (риск от хипертония, тежка брадикардия, сърдечен арест).
- ergotamine (засилване на вазоконстрикторния ефект).
- β_2 -симпатомиметици (функционален антагонизъм).
- средства, действащи върху централната нервна система (като сънотворни, транквилизатори, три- и тетрациклични антидепресанти, невролептици / и алкохол (риск от хипотония).
- нестероидни противовъзпалителни средства (напр. indomethcine)
- естрогени (съществува риск от редуциране на антихипертензивния ефект на metoprolol).



- орални противодиабетни средства и инсулин (metoprolol може да усили техния хипогликемичен ефект и да маскира симптомите на хипогликемия).
- курареподобни миорелаксанти (засилване на нервномускулната блокада).
- H₂-блокери, преди всичко cimetidine (засилване на ефектите на metoprolol поради по-високите му плазмени нива).
- rifampicin, барбитурати (ефектите на metoprolol може да бъдат инхибирани поради индукция на чернодробния метаболизъм).

Особено внимание трябва да се обръща при едновременното приложение на metoprolol с ганглиоблокери или други β-блокери (напр. капки за очи).

4.6 Бременност и лактация

Изисква се внимателна преценка на съотношението полза / риск при евентуално приложение на лекарството. Ако лечението е абсолютно необходимо, плодът и новороденото трябва да бъдат внимателно проследени за няколко дни, тъй като лекарството предизвиква редукция на плацентарния кръвоток и следователно може да забави растежа на плода или да предизвика брадикардия, подтискане на дишането, хипотония, хипогликемия.

Кърмене

Въпреки, че много малка част от терапевтичната доза на metoprolol се екскретира чрез майчиното мляко, кърмачето трябва да бъде внимателно наблюдавано (поради риск от брадикардия).

4.7 Шофиране и работа с машини по време на лечение с Egilok

Употребата на metoprolol повлиява способностите за шофиране и извършване на дейност с повишен риск, следователно дозата, при която тези дейности могат да бъдат извършвани, се определя индивидуално.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Нервна система:

Умора, замаяност, главоболие, рядко парестезии, мускулни крампи.

По-рядко: депресия, нарушение на способността за концентрация, сънливост, безсъние, кошмари и по изключение - промени на личността.

Сърдечно-съдова система:

Брадикардия, постурална хипотония (понякога със синкоп).

Сърдечна недостатъчност, едем, палпитации, аритмия, болки в сърдечната област и изключително рядко - проводни нарушения.

При налични периферни съдови разстройства, лекарството може да провокира появата на синдром на Raynaud и гангрена.



Гастроинтестинален тракт:

Понякога може да се получи гадене, повръщане, болки в корема, диария, запек и по-рядко сухота в устата и нарушение в чернодробните функции.

Кожа:

Рядко еритем, уртикария, подобни на псориазис и дистрофични кожни лезии, фоточувствителност, увеличено изпотяване, алопеция.

Дихателна система:

Рядко може да се получи задух при физически усилия, още по-рядко бронхоспазъм (дори без клинични данни за обструктивни нарушения), ринит.

Сетивни органи:

Рядко зрителни нарушения, сухота в очите, конюнктивити, шум в ушите.

Метаболизъм:

Може да се наблюдава увеличение на телесното тегло.

Кръвна картина:

Рядко може да се получи тромбоцитопения.

4.9 Предозиране

Може да се очаква появата на хипотония, синусова брадикардия, атрио-вентрикуларен блок, сърдечна недостатъчност, кардиогенен шок, бронхоспазъм, загуба на съзнание, кома, гадене, повръщане, цианоза. Изброените симптоми могат да са по-тежко изразени при комбинирането на metoprolol с други антихипертензивни лекарства, choinidine, барбитурати и алкохол.

Първите симптоми на предозиране се развиват 20 минути до 2 часа след приложението на свръхдозата.

Лечение на предозирането:

Провокира се повръщане и се прави стомашна промивка. В случаите с тежка хипотония, брадикардия и заплашваща сърдечна недостатъчност се прилага β_1 -агонист или атропин венозно.

При незадоволителен ефект може да се използва dopamine, dobutamine или погериперphine.

За повлияване на хипогликемията може да се приложи glucagon 1-10 mg, може да се наложи имплантация на пейсмейкър, а бронхоспазмът се повлиява от β_2 -рецепторен агонист.

Антидотите могат да се използват в дози, значително надвишаващи терапевтичните.



5.0 ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамика

Metoprolol е кардиоселективен β_1 -рецепторен блоккер без вътрешна симпатомиметична активност и без мембраностабилизиращ ефект. Намалява ефектите на повишената симпатомиметична активност върху сърцето.

Намалява повишеното кръвно налягане в изправено и легнало положение.

Намалява броя на стенокардните присъпти и подобрява физическото състояние на пациентите с ангина пекторис.

Приложен след прекаран инфаркт на миокарда, намалява риска от реинфаркт.

В терапевтични дози metoprolol има по-малък периферен вазо- и бронхоконстриктивен ефект в сравнение с неселективните β -блокери.

В сравнение с неселективните β -блокери, metoprolol в много по-малка степен повлиява синтеза на инсулин и въглехидратния метаболизъм.

Не променя значително кардиоваскуларният отговор при хипогликемия и не увеличава продължителността на хипогликемичния шок.

5.2 Фармакокинетика

Egilok се резорбира бързо и напълно от стомашно-чревния тракт.

Максимална плазмена концентрация се получава 1.5 часа след приложението му, а времето на полуелиминиране е средно 3.5 часа (между 1 и 9 часа).

Metoprolol се метаболизира в черния дроб, като метаболитите му са неактивни.

Около 5% от приложената доза се екскретира непроменена с урината, така че приложението на metoprolol при пациенти с нарушение на бъбречната функция е безопасно и не налага допълнителна корекция на дозата.

Нарушения в чернодробната функция обаче променят екскрецията на лекарството, затова при тежка чернодробна недостатъчност дозата му трябва да бъде редуцирана.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Остра интоксикация

Плъхове:	перорална LD ₅₀	3090 mg/kg
	интравенозна LD ₅₀	90 mg/kg

Мишки:	перорална LD ₅₀	2090 mg/kg
	интравенозна LD ₅₀	118 mg/kg

Хронична интоксикация



Хроничната интоксикация е изследвана при перорално приложение на лекарственото вещество при кучета в дневна доза от 2x5, 2x20 и 2x50 mg/kg и при плъхове в дневна доза 1x10, 1x100 и 1x200 mg/kg в продължение на 6 месеца. При ЕКГ-изследвания на третираните животни бе установено намаление на сърдечната честота и увеличение на PR-QT интервала, което може да бъде свързано с фармакологичните свойства на лекарственото вещество. При тези изследвания не бяха установени никакви токсични или други нежелани ефекти.

Тератогенност

Metoprolol, прилаган при бременни плъхове и зайци по време на органогенезата (в дневни дози съответно 10, 50, 200 mg/kg и 5, 12,5 и 25 mg/kg), не оказва ембриотоксичен или тератогенен ефект.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Помощни вещества

Освен лекарственото вещество metoprolol tartarate Ph.Eur., всяка таблетка съдържа още:

Cellulose microcrystalline Ph.Eur., Sodium starch glycollate Ph.Eur., Colloidal anhydrous silica Ph.Eur., Polyvidone (K-90) Ph.Eur., Magnesium stearate Ph.Eur.

6.2 Несъвместимости

Физични: електрически товар (разпрашаване!)

Химични: силни киселини и основи, силни окислители

6.3 Срок на годност

3 години

6.4 Препоръки за съхранение

Да се съхранява под 25⁰C.

6.5 Вид и състав на опаковката

Таблетките са в поставени в шишенце от кафяво стъкло с осигурена срещу отваряне полиетиленова капачка с вибрационен абсорбатор.

6.6 Инструкции за употреба/съхранение

Виж точка 6.4



7. ПРОИЗВОДИТЕЛ

EGIS PHARMACEUTICALS LTD.
1106 BUDAPEST, Kereszturi ut 30-38
HUNGARY
Phone: (36-1) 265 5555
Fax: (36-1)265 5529

8. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РЕГИСТРАЦИЯТА

EGIS PHARMACEUTICALS LTD.
1106 BUDAPEST, Kereszturi ut 30-38
HUNGARY
Phone: (36-1) 265 5555
Fax: (36-1)265 5529

9. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР

10. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТЕРА

11. ДАТА НА ПОСЛЕДНА РЕДАКЦИЯ НА ТЕКСТА

Март, 2002

