Акридилол



Код АТХ:

- C07AG02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Карведилол

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки плоскоцилиндрические, с фаской и риской, от белого до белого с кремоватым оттенком цвета, допускается легкая мраморность.

	1 таб.
карведилол	6.25 мг

Вспомогательные вещества: лудипресс ЛЦЕ (лактозы моногидрат - 94.7-98.3%, повидон - 3-4%) - 81.95 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 0.9 мг, магния стеарат - 0.9 мг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

Таблетки квадратные с округленными углами, двояковыпуклые, с крестообразной насечкой на одной стороне и гравировкой "АЛ1" - на другой, от белого до белого с кремоватым оттенком цвета, допускается легкая мраморность.

	1 таб.
карведилол	12.5 мг

Вспомогательные вещества: лудипресс ЛЦЕ (лактозы моногидрат - 94.7-98.3%, повидон - 3-4%) - 95.3 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 1.1 мг, магния стеарат - 1.1 мг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

Таблетки овальные, двояковыпуклые, с частичной насечкой на обеих сторонах и гравировкой "АЛ2" на одной стороне, от белого до белого с кремоватым оттенком цвета, допускается легкая мраморность.

	1 таб.
карведилол	25 мг

Вспомогательные вещества: лудипресс ЛЦЕ (лактозы моногидрат - 94.7-98.3%, повидон - 3-4%) - 190.6 мг, карбоксиметилкрахмал натрия - 2.2 мг, магния стеарат - 2.2 мг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Карведилол - блокатор α_1-, β_1,- и β_2-адренорецепторов, оказывает органопротекторный эффект, является антиоксидантом, устраняющим свободные кислородные радикалы, обладает антипролиферативным действием в отношении гладкомышечных клеток стенок сосудов. Карведилол представляет собой рацемическую смесь R(+) и S(-) стереоизомеров, каждый из которых обладает одинаковыми альфа-адреноблокирующими и антиоксидантными свойствами. Бета-адреноблокирующее действие карведилола носит неселективный характер и обусловлено левовращающим S(-) стереоизомером.

Карведилол не имеет внутренней симпатомиметической активности и, подобно пропранололу, обладает мембраностабилизирующими свойствами. Блокируя β-адренорецепторы, он снижает активность ренин-ангиотензин-альдостероновой системы, уменьшая высвобождение ренина, поэтому задержка жидкости (характерная для селективных альфа-адреноблокаторов) возникает редко.

Селективно блокируя α_1-адренорецепторы, карведилол снижает ОПСС.

Карведилол не оказывает неблагоприятного влияния на липидный профиль, сохраняя нормальное соотношение липопротеинов высокой и низкой плотности (ЛПВП/ЛПНП).

У больных артериальной гипертензией карведилол снижает АД за счет сочетанной блокады α_1- и β-адренорецепторов. Снижение АД не сопровождается одновременным увеличением ОПСС, которое наблюдается при приеме неселективных бета-адреноблокаторов. ЧСС несколько уменьшается. Почечный кровоток и функция почек у больных с артериальной гипертензией сохраняются. Показано, что карведилол не изменяет ударный объем крови и уменьшает ОПСС; не нарушает кровоснабжение органов и периферический кровоток, в т.ч. в скелетной мускулатуре, предплечьях, нижних конечностях, кожных покровах, головном мозге и сонной артерии. Похолодание конечностей и повышенная утомляемость во время физической нагрузки отмечаются редко. Гипотензивный эффект карведилола при артериальной гипертензии сохраняется в течение длительного времени.

У больных ИБС карведилол оказывает противоишемическое и антиангинальное действие (увеличение общей продолжительности физической нагрузки, времени до развития депрессии сегмента ST глубиной 1 мм и времени до возникновения приступа стенокардии), сохраняющиеся при длительной терапии. Карведилол достоверно снижает потребность миокарда в кислороде и активность симпатоадреналовой системы. Также уменьшает преднагрузку (давление заклинивания в легочной артерии и легочное капиллярное давление) и постнагрузку (ОПСС). Карведилол снижает показатель смертности и уменьшает частоту госпитализаций, уменьшает симптоматику и улучшает функцию левого желудочка у больных с хронической сердечной недостаточностью ишемического и неишемического генеза. Эффекты карведилола являются дозозависимыми.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь карведилол быстро всасывается. Карведилол является субстратом белка-переносчика, выполняющего роль насоса в просвете кишечника, гликопротеина Р. C_{max} в плазме крови достигается примерно через 1 ч. Абсолютная биодоступность карведилола составляет примерно 25%.

Распределение

Карведилол обладает высокой липофильностью. Около 98-99% карведилола связывается с белками плазмы крови. Его V_d составляет приблизительно 2 л/кг. Карведилол подвергается биотрансформации в печени путем окисления и конъюгации с образованием ряда метаболитов. 60-75 % абсорбированного препарата метаболизируется при "первом прохождении" через печень. Показано существование кишечно-печеночной циркуляции исходного вещества.

Метаболизм

Метаболизм карведилола путем окисления является стереоселективным. R стереоизомер метаболизируется в основном с помощью CYP2D6 и CYP1A2, а S стереоизомер - в основном с помощью CYP2D9 и в меньшей степени с помощью CYP2D6. К другим изоферментам Р450, участвующим в метаболизме карведилола, относятся CYP3A4, CYP2E1 и CYP2C19. C_{max} R стереоизомера в плазме приблизительно в 2 раза превышает таковую для S стереоизомера.

R стереоизомер метаболизируется, главным образом, путем гидроксилирования. У медленных метаболизаторов CYP2D6 возможно увеличение плазменной концентрации карведилола, в первую очередь, R стереоизомера, что выражается в увеличении альфа-адреноблокирующей активности карведилола.

В результате деметилирования и гидроксилирования фенольного кольца образуются 3 метаболита (их концентрации в 10 раз ниже, чем концентрация исходного вещества) с бета-адреноблокирующей активностью (у 4'-гидроксифенольного метаболита она примерно в 13 раз сильнее, чем у самого карведилола). 3 активных метаболита обладают менее выраженными вазодилатирующими свойствами, чем карведилол. 2 из гидроксикарбазольных метаболитов карведилола являются чрезвычайно мощными антиоксидантами, причем их активность в этом отношении в 30-80 раз превышает таковую у карведилола.

Выведение

$T_{1/2}$ карведилола составляет около 6 ч, плазменный клиренс - около 500-700 мл/мин. Выведение происходит главным образом через кишечник, основной путь выведения - с желчью. Небольшая часть дозы выводится почками в виде различных метаболитов.

Фармакокинетика у особых групп больных

Больные с нарушением функции почек

При длительной терапии карведилолом интенсивность почечного кровотока сохраняется, скорость клубочковой фильтрации не изменяется.

У больных артериальной гипертензией и нарушением функции почек AUC, $T_{1/2}$ и C_{max} не изменяются. Почечное выведение неизмененного препарата у больных с почечной недостаточностью уменьшается, однако изменения фармакокинетических параметров при этом выражены незначительно.

Больные с нарушением функции печени

У больных с циррозом печени системная биодоступность препарата увеличивается на 80% вследствие уменьшения выраженности метаболизма при "первом прохождении" через печень. Следовательно, карведилол противопоказан больным с клинически манифестным нарушением функции печени.

Больные с сердечной недостаточностью

В некоторых исследованиях у пациентов, страдающих сердечной недостаточностью, клиренс R и S стереоизомеров карведилола был значительно ниже по сравнению с ранее наблюдавшимся клиренсом у здоровых добровольцев. Данные результаты свидетельствуют о том, что фармакокинетика R и S стереоизомеров карведилола при сердечной недостаточности значительно изменяется.

Больные пожилого и старческого возраста

Возраст не оказывает статистически значимого влияния на фармакокинетику карведилола у больных артериальной гипертензией.

Дети

Данные по фармакокинетике препарата у пациентов до 18 лет ограничены.

Больные сахарным диабетом

У больных сахарным диабетом 2 типа и артериальной гипертензией карведилол не влияет на концентрацию глюкозы в крови натощак и после еды, уровень гликозилированного гемоглобина (HbA_1) или дозу гипогликемических средств для приема внутрь. В некоторых клинических исследованиях было показано, что у больных сахарным диабетом 2 типа карведилол не вызывает снижения толерантности к глюкозе. У больных артериальной гипертензией, имевших инсулинорезистентность (синдром X), но без сопутствующего сахарного диабета, карведилол улучшает чувствительность к инсулину. Аналогичные результаты были получены у больных с артериальной гипертензией и сахарным диабетом 2 типа.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия: эссенциальная гипертензия (в монотерапии или в комбинации с другими антигипертензивными средствами, например, блокаторами медленных кальциевых каналов или диуретиками);

— ИБС (в т.ч. у больных с нестабильной стенокардией и безболевой ишемией миокарда);

— хроническая сердечная недостаточность: лечение стабильной и симптоматической легкой, умеренной и тяжелой хронической сердечной недостаточности (II-IV функциональные классы в соответствии с Нью-Йоркской ассоциацией кардиологов /NYHA/) ишемического или неишемического генеза в комбинации с ингибиторами АПФ и диуретиками, с или без сердечных гликозидов (стандартная терапия), при отсутствии противопоказаний.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Кардит
- Миокардит
- Сердечная недостаточность

- Стенокардия

Противопоказания:

— острая и хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации, требующая в/в введения инотропных средств;

— клинически значимое нарушение функции печени;

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

— AV-блокада II и III степени (за исключением больных с искусственным водителем ритма);

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

— СССУ (включая синоатриальную блокаду);

— выраженная артериальная гипотензия (систолическое АД менее 85 мм рт.ст.);

— кардиогенный шок;

— анамнестические указания на бронхоспазм и бронхиальную астму;

— непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;

— повышенная чувствительность к карведилолу или любому компоненту препарата.

С *осторожностью:* при ХОБЛ, депрессии, миастении, гипогликемии, AV-блокаде I степени, тиреотоксикозе, при обширных хирургических вмешательствах и проведении общей анестезии, стенокардии Принцметала, сахарном диабете, окклюзионных заболеваниях периферических сосудов, при подозрении на феохромоцитому, почечной недостаточности, псориазе.

Способ применения и дозы:

Внутрь, независимо от приема пищи, запивая достаточным количеством жидкости.

Эссенциальная гипертензия

Рекомендованная начальная доза составляет 12.5 мг 1 раз/сут в первые 2 дня проведения терапии, затем по 25 мг 1 раз/сут. При необходимости в дальнейшем дозу можно увеличивать с интервалами не менее 2 недель, доводя до максимальной рекомендованной дозы 50 мг 1 раз/сут (или разделенной на 2 приема).

Ишемическая болезнь сердца

Рекомендованная начальная доза составляет 12.5 мг 2 раза/сут в первые 2 дня, затем по 25 мг 2 раза/сут. При необходимости впоследствии дозу можно увеличивать с интервалами не менее 2 недель, доводя до высшей суточной дозы, равной 100 мг, разделенной на 2 приема.

Хроническая сердечная недостаточность

Дозу подбирают индивидуально, необходимо тщательное наблюдение врача. У больных, получающих сердечные гликозиды, диуретики и ингибиторы АПФ, следует скорректировать их дозы до начала лечения препаратом Акридилол.

Рекомендованная начальная доза составляет 3.125 мг (1/2 таб. по 6.25 мг) 2 раза/сут в течение 2 недель. При хорошей переносимости дозу увеличивают с интервалами не менее 2 недель до 6.25 мг 2 раза/сут, затем до 12.5 мг 2 раза/сут, потом до 25 мг 2 раза/сут. Дозу следует увеличивать до максимальной дозы, которая хорошо переносится больным. Рекомендованная максимальная доза - 25 мг 2 раза/сут для *всех больных с тяжелой хронической сердечной недостаточностью и для больных с легкой и умеренной степенью хронической сердечной недостаточности с* **массой тела пациента менее 85 кг**. У *пациентов с легкой и умеренной хронической сердечной недостаточностью и* **массой тела более 85 кг** - рекомендованная максимальная доза составляет 50 мг 2 раза/сут.

Перед каждым увеличением дозы врач должен осмотреть больного для выявления возможного нарастания симптомов хронической сердечной недостаточности или вазодилатации. При транзиторном нарастании симптомов хронической сердечной недостаточности или задержке жидкости в организме следует увеличить дозу диуретиков, хотя иногда приходится уменьшить дозу препарата Акридилол или временно отменить его.

Симптомы вазодилатации можно устранить уменьшением дозы диуретиков. Если симптомы сохраняются, можно снизить дозу ингибитора АПФ (если больной его принимает), а затем, при необходимости - дозу препарата Акридилол. В такой ситуации дозу препарата Акридилол не следует увеличивать, пока симптомы усиливающейся хронической сердечной недостаточности или артериальной гипотензии не улучшатся.

Если лечение препаратом Акридилол прерывают более чем на 1 неделю, то его назначение возобновляют в меньшей дозе, а затем увеличивают в соответствии с приведенными выше рекомендациями. Если лечение препаратом Акридилол прерывают более чем на 2 недели, то его назначение следует возобновлять в дозе 3.125 мг (1/2 таб. по 6.25 мг) 2 раза/сут, затем подбирают дозу в соответствии с приведенными выше рекомендациями.

Дозирование у особых групп больных

Существующие данные по фармакокинетике у **больных с различной степенью нарушения функции почек (включая почечную недостаточность)** позволяют полагать, что **больным с умеренной и тяжелой почечной недостаточностью** коррекции дозы препарата Акридилол не требуется.

Акридилол противопоказан пациентам с клиническими проявлениями **нарушения функции печени.**

Данные, которые продиктовали бы необходимость коррекции дозы у **пациентов пожилого возраста**, отсутствуют.

Побочное действие:

Нежелательные реакции, встречающиеся с частотой < 10%, расцениваются как очень часто. Нежелательные реакции, встречающиеся с частотой от < 1% до <10 %, расцениваются как часто. Нежелательные реакции, встречающиеся с частотой от < 0.1% до <1 %, расцениваются как нечасто. Нежелательные реакции, встречающиеся с частотой от < 0.01% до < 0.1%, расцениваются как редко. Нежелательные реакции, встречающиеся с частотой < 0.01%, включая отдельные сообщения, расцениваются как очень редко. Частота нежелательных реакций, за исключением головокружения, нарушения зрения и брадикардии, не зависит от дозы препарата.

Нежелательные реакции у больных с хронической сердечной недостаточностью

Со стороны ЦНС: очень часто - головокружение, головная боль (обычно легкие и возникающие чаще в начале лечения); астения (в т.ч. повышенная утомляемость), депрессия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - брадикардия, постуральная гипотензия, выраженное снижение АД, отеки (в т.ч. генерализованные, периферические, зависящие от положения тела, отеки промежности, отеки нижних конечностей, гиперволемия, задержка жидкости); нечасто - синкопальные состояния (включая пресинкопальные), AV-блокада и сердечная недостаточность в период увеличения дозы.

Со стороны ЖКТ: часто - тошнота, диарея, рвота.

Со стороны системы кроветворения: редко - тромбоцитопения; очень редко - лейкопения.

Со стороны обмена веществ: часто - увеличение массы тела, гиперхолестеринемия; у больных с уже имеющимся сахарным диабетом - гипергликемия или гипогликемия, нарушения гликемического контроля.

Прочие: часто - нарушения зрения; редко - почечная недостаточность и нарушение функции почек у больных с диффузным васкулитом и/или нарушением функции почек.

Нежелательные реакции у больных с артериальной гипертензией и ИБС

Характер побочных действий со стороны сердечно-сосудистой системы при лечении артериальной гипертензии и длительной терапии ИБС аналогичен таковому при хронической сердечной недостаточности, однако частота их несколько меньше.

Со стороны ЦНС: часто - головокружение, головная боль и общая слабость, обычно легкие и возникающие, в частности, в начале лечения; нечасто - лабильность настроения, нарушения сна, парестезии.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - брадикардия, постуральная гипотензия, синкопальные состояния (нечасто), особенно в начале терапии; нечасто - нарушения периферического кровообращения (похолодание конечностей, обострение синдрома перемежающейся хромоты и синдром Рейно), AV-блокада, стенокардия (боли в грудной клетке), развитие или усугубление симптомов сердечной недостаточности и периферические отеки.

Со стороны дыхательной системы: часто - бронхоспазм и одышка у предрасположенных больных; редко - заложенность носа.

Со стороны ЖКТ: часто - диспептические расстройства (в т.ч. тошнота, боли в животе, диарея); нечасто - запор, рвота.

Со стороны кожных покровов: нечасто - кожные реакции (кожная сыпь, дерматит, крапивница и кожный зуд).

Лабораторные показатели: очень редко - повышение активности печеночных трансаминаз (АЛТ, АСТ и ГГТ) тромбоцитопения и лейкопения.

Прочие: часто - боли в конечностях, уменьшение слезоотделения и раздражение глаз; нечасто - снижение потенции,

нарушение зрения; редко - сухость во рту и нарушения мочеиспускания; очень редко - обострение псориаза, чиханье, гриппоподобный синдром. Отдельные случаи аллергических реакций.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД, брадикардия, сердечная недостаточность, кардиогенный шок, остановка сердца; возможны нарушения дыхания, бронхоспазм, рвота, спутанность сознания и генерализованные судороги.

Лечение: помимо мероприятий общего характера необходимо проводить мониторинг и коррекцию жизненно важных показателей, при необходимости - в отделении интенсивной терапии. Можно использовать следующие мероприятия:

— уложить больного на спину (с приподнятыми ногами);

— при выраженной брадикардии - атропин по 0.5-2 мг в/в;

— для поддержания сердечно-сосудистой деятельности - глюкагон по 1-10 мг в/в струйно, затем по 2-5 мг в час в виде длительной инфузии;

— симпатомиметики (добутамин, изопреналин, орципреналин или эпинефрин (адреналин) в различных дозах, в зависимости от массы тела и ответа на лечение.

Если в клинической картине передозировки доминирует артериальная гипотензия, вводят норэпинефрин (норадреналин); его назначают в условиях непрерывного контроля показателей кровообращения. При резистентной к лечению брадикардии показано применение искусственного водителя ритма. При бронхоспазме вводят бета-адреномиметики в виде аэрозоля (при неэффективности - в/в) или аминофиллин в/в. При судорогах в/в медленно вводят диазепам или клоназепам.

Поскольку при тяжелой передозировке с симптоматикой шока возможно удлинение периода полувыведения карведилола и выведение препарата из депо, необходимо продолжать поддерживающую терапию достаточно длительное время. Продолжительность поддерживающей/дезинтоксикационной терапии зависит от степени тяжести передозировки, ее следует продолжать до стабилизации клинического состояния больного.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Бета-адреноблокаторы уменьшают плацентарный кровоток, что может привести к внутриутробной гибели плода и преждевременным родам. Кроме того, у плода и новорожденного могут возникать нежелательные реакции (в частности, гипогликемия и брадикардия, осложнения со стороны сердца и легких).

Исследования на животных не выявили у карведилола тератогенного эффекта.

Достаточного опыта применения препарата Акридилол у беременных нет. Карведилол противопоказан при беременности, за исключением случаев, когда возможные преимущества его применения у матери превышают потенциальный риск для плода.

У животных карведилол и его метаболиты проникают в грудное молоко. Данные о проникновении карведилола в грудное молоко у человека отсутствуют, поэтому, если прием препарата необходим в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Фармакокинетическое взаимодействие

Поскольку карведилол является как субстратом, так и ингибитором гликопротеина Р, при его одновременном приеме с препаратами, транспортируемыми гликопротеином Р, биодоступность последних может увеличиваться. Кроме того, биодоступность карведилола может изменяться под действием индукторов или ингибиторов гликопротеина Р. Ингибиторы и индукторы CYP2D6 и CYP2C9 могут стереоселективно изменять системный и/или пресистемный метаболизм карведилола, приводя к увеличению или снижению концентраций R и S стереоизомеров карведилола в плазме крови. Некоторые примеры подобных взаимодействий, наблюдавшихся у пациентов или у здоровых добровольцев, перечислены ниже, однако данный список не является полным.

Дигоксин

При одновременном приеме карведилола и дигоксина концентрации дигоксина повышаются примерно на 15%. В начале терапии карведилолом, при подборе его дозы или отмене препарата, рекомендуется регулярный контроль концентрации дигоксина в плазме крови.

Циклоспорин

В двух исследованиях при назначении карведилола пациентам, перенесшим пересадку почки и сердца и получавших циклоспорин перорально, отмечалось повышение концентрации циклоспорина. Оказалось, что вследствие ингибирования активности гликопротеина Р в кишечнике, карведилол увеличивает всасывание циклоспорина при его пероральном приеме. Чтобы поддерживать концентрации циклоспорина в терапевтическом диапазоне, потребовалось уменьшение дозы циклоспорина в среднем на 10-20%. В связи с выраженными индивидуальными колебаниями концентрации циклоспорина рекомендуется тщательный мониторинг его концентрации после начала терапии карведилолом и, при необходимости, соответствующая коррекция суточной дозы циклоспорина. В случае внутривенного введения циклоспорина, какого-либо взаимодействия с карведилолом не ожидается.

Рифампицин

В исследовании с участием здоровых добровольцев рифампицин снижал плазменные концентрации карведилола, вероятнее всего, путем индукции гликопротеина Р, приводя к снижению всасывания карведилола в кишечнике и снижению его антигипертензивного действия.

Амиодарон

У пациентов с сердечной недостаточностью амиодарон снижал клиренс S стереоизомера карведилола, подавляя CYP2C9. Средняя концентрация R стереоизомера карведилола не изменялась. Следовательно, в связи с повышением концентрации S стереоизомера карведилола, возможен риск увеличения бета-адреноблокирующего действия.

Флуоксетин

В рандомизированном исследовании с перекрестным дизайном у пациентов с сердечной недостаточностью одновременный прием флуоксетина (ингибитора CYP2D6) приводил к стереоселективному подавлению метаболизма карведилола - к повышению среднего показателя AUC для R (+) на 77%. Однако, разницы в побочных действиях, величине АД или ЧСС между двумя группами не отмечалось.

Фармакодинамическое взаимодействие

Инсулин или гипогликемические средства для приема внутрь

Препараты с бета-адреноблокирующими свойствами могут усиливать гипогликемическое действие инсулина или гипогликемических средств для приема внутрь. Симптомы гипогликемии, особенно тахикардия, могут маскироваться или ослабевать. Больным, получающим инсулин или гипогликемические средства для приема внутрь, рекомендуется регулярный контроль содержания глюкозы крови.

Препараты, снижающие содержание катехоламинов

Пациенты, принимающие одновременно средства с бета-адреноблокирующими свойствами и средства, снижающие содержание катехоламинов (например, резерпин и ингибиторы МАО), должны находиться под тщательным наблюдением в связи с риском развития артериальной гипотензии и/или выраженной брадикардии.

Дигоксин

Комбинированная терапия средств с бета-адреноблокирующими свойствами и дигоксина может приводить к дополнительному замедлению атриовентрикулярной проводимости. Верапамил, дилтиазем, амиодарон или другие антиаритмические средства Одновременный прием с карведилолом может повысить риск нарушения AV-проводимости.

Клонидин

Одновременное назначение клонидина с препаратами с бета-адреноблокирующими свойствами может потенцировать антигипертензивный и брадикардитический эффект. Если планируется прекратить комбинированную терапию препаратом с бета-адреноблокирующими свойствами и клонидином, первым следует отменить бета-адреноблокатор, а через несколько дней можно отменить клонидин, постепенно уменьшая его дозу.

Блокаторы медленных кальциевых каналов (БМКК)

При одновременном назначении карведилола и дилтиазема отмечались отдельные случаи нарушений проводимости (редко - с нарушениями показателей гемодинамики). Как и в случае с другими препаратами с бета-адреноблокирующими свойствами, назначение карведилола вместе с БМКК типа верапамила или дилтиазема рекомендуется проводить под контролем ЭКГ и АД.

Антигипертензивные средства

Как и другие препараты с бета-адреноблокирующей активностью, карведилол может усиливать действие других одновременно принимаемых антигипертензивных средств (например, альфа$_1$-адреноблокаторов) или препаратов, которые вызывают артериальную гипотензию в качестве побочного действия.

Средства для общей анестезии

Следует проводить тщательное наблюдение за основными показателями жизнедеятельности организма при

проведении общей анестезии в связи с возможностью синергичного отрицательного инотропного действия карведилола и средств для общей анестезии.

НПВП

Совместный прием НПВП и бета-адреноблокаторов может приводить к повышению АД и снижению контроля за АД.

Бронходилататоры (агонисты β-адренорецепторов)

Поскольку некардиоселективные бета-адреноблокаторы препятствуют бронхолитирующему эффекту бронходилататоров, являющихся стимуляторами β-адренорецепторов, необходим тщательный контроль за пациентами, получающими данные препараты.

Особые указания и меры предосторожности:

Хроническая сердечная недостаточность

У больных с хронической сердечной недостаточностью в период подбора дозы препарата Акридилол может отмечаться нарастание симптомов хронической сердечной недостаточности или задержка жидкости. При возникновении таких симптомов необходимо увеличить дозу диуретиков и не повышать дозу препарата Акридилол до стабилизации показателей гемодинамики.

Иногда бывает необходимо уменьшить дозу препарата Акридилол или, в редких случаях, временно отменить препарат. Подобные эпизоды не препятствуют дальнейшему правильному подбору дозы препарата Акридилол.

Акридилол с осторожностью используют в комбинации с сердечными гликозидами (возможно чрезмерное замедление AV-проводимости).

Функция почек при хронической сердечной недостаточности

При назначении препарата Акридилол больным с хронической сердечной недостаточностью и низким АД (систолическое АД менее 100 мм рт.ст.), ИБС и диффузными изменениями сосудов и/или почечной недостаточностью отмечалось обратимое ухудшение функции почек. Дозу препарата подбирают в зависимости от функционального состояния почек.

ХОБЛ

Больным с ХОБЛ (в т.ч. бронхоспастическим синдромом), не получающим пероральных или ингаляционных противоастматических средств, Акридилол назначают только в том случае, если возможные преимущества его применения превышают потенциальный риск. При наличии исходной предрасположенности к бронхоспастическому синдрому при приеме препарата Акридилол в результате повышения сопротивления дыхательных путей может развиться одышка. В начале приема и при увеличении дозы препарата Акридилол этих больных нужно тщательно наблюдать, снижая дозу препарата при появлении начальных признаков бронхоспазма.

Сахарный диабет

С осторожностью препарат назначают больным сахарным диабетом, поскольку он может маскировать или ослаблять симптомы гипогликемии (особенно тахикардию). У больных с хронической сердечной недостаточностью и сахарным диабетом применение препарата Акридилол может сопровождаться нарушениями гликемического контроля.

Заболевания периферических сосудов

Осторожность необходима при назначении препарата Акридилол пациентам с заболеваниями периферических сосудов (в том числе с синдромом Рейно), поскольку бета-адреноблокаторы могут усиливать симптомы артериальной недостаточности.

Тиреотоксикоз

Как и другие бета-адреноблокаторы, Акридилол может уменьшать выраженность симптомов тиреотоксикоза.

Общая анестезия и обширные хирургические вмешательства

Осторожность требуется у больных, которым проводится хирургическое вмешательство под общей анестезией, из-за возможности суммации отрицательных эффектов препарата Акридилол® и средств для общей анестезии.

Брадикардия

Акридилол может вызывать брадикардию, при урежении ЧСС менее 55 уд./мин дозу препарата следует снизить.

Повышенная чувствительность

Необходимо соблюдать осторожность при назначении препарата Акридилол пациентам с анамнестическими указаниями на тяжелые реакции повышенной чувствительности или проходящим курс десенсибилизации, поскольку бета-адреноблокаторы могут повысить чувствительность к аллергенам и степень тяжести анафилактических реакций.

Псориаз

Больным с анамнестическими указаниями на возникновение или обострение псориаза при применении бета-адреноблокаторов, Акридилол можно назначать только после тщательного анализа возможной пользы и риска.

Одновременный прием блокаторов медленных кальциевых каналов (БМКК)

У больных, одновременно принимающих БМКК типа верапамила или дилтиазема, а также другие антиаритмические средства, необходимо регулярно мониторировать ЭКГ и АД.

Феохромоцитома

Больным феохромоцитомой до начала применения любого бета-адреноблокатора необходимо назначить альфа-адреноблокатор. Хотя Акридилол обладает как бета-, так и альфа-адреноблокирующими свойствами, опыта его применения у таких больных нет, поэтому его с осторожностью следует назначать больным с подозрением на феохромоцитому.

Стенокардия Принцметала

Неселективные бета-адреноблокаторы могут провоцировать появление болей у больных со стенокардией Принцметала. Опыта назначения препарата Акридилол этим пациентам нет. Хотя его альфа-адреноблокирующие свойства могут предотвратить подобную симптоматику, назначать карведилол в таких случаях следует с осторожностью.

Контактные линзы

Пациенты, пользующиеся контактными линзами, должны помнить о возможности уменьшения количества слезной жидкости.

Синдром отмены

Лечение препаратом Акридилол проводится длительно. Его не следует прекращать резко, необходимо постепенно уменьшать дозу препарата с недельными интервалами. Это особенно важно у больных ИБС.

В случае необходимости проведения хирургического вмешательства с использованием общей анестезии необходимо предупредить врача-анестезиолога о предшествующей терапии препаратом Акридилол.

В период лечения исключается употребление алкоголя.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

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

При нарушениях функции почек

Рекомендуется контролировать функцию почек у пациентов с хронической почечной недостаточностью.

При нарушениях функции печени

Препарат противопоказан к применению при тяжелой печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

Данные, которые продиктовали бы необходимость коррекции дозы у **пациентов пожилого возраста**, отсутствуют.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света, недоступном для детей месте, при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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