Карведилол



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, белого цвета, с фаской и риской.

	1 таб.
карведилол	12.5 мг
-"-	25 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, сахароза, поливидон K25, кросповидон, метилцеллюлоза, натрия кроскармеллоза.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
30 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Альфа- и бета-адреноблокатор без внутренней симпатомиметической активности.

Блокирует α_1-, β_1 и β_2-адренорецепторы. Оказывает вазодилатирующее, антиангинальное и антиаритмическое действие.

Вазодилатирующий эффект связан, главным образом, с блокадой α_1-адренорецепторов. Благодаря вазодилатации снижает ОПСС. Обладает мембраностабилизирующими свойствами. Сочетание вазодилатации и блокады β-адренорецепторов приводит к следующим эффектам: у больных с артериальной гипертензией снижение АД не сопровождается увеличением ОПСС, не снижается периферический кровоток (в отличие от бета-адреноблокаторов). ЧСС уменьшается незначительно.

У больных ИБС оказывает антиангинальное действие. Уменьшает пред- и постнагрузку на сердце. Не оказывает выраженного влияния на липидный обмен и содержание калия, натрия, и магния в плазме крови. У больных с нарушениями функции левого желудочка или недостаточностью кровообращения, благоприятно влияет на гемодинамические показатели и улучшает фракцию выброса и размеры левого желудочка. Оказывает антиоксидантное действие, устраняя свободные кислородные радикалы.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь карведилол быстро и практически полностью всасывается из ЖКТ. Биодоступность составляет 25% (из-за высокой степени метаболизма в печени). Концентрация в плазме крови пропорциональна принятой дозе. C_{max} в плазме крови достигается через 1 ч. Прием пищи замедляет всасывание карведилола, не влияя на его биодоступность.

Распределение

Связывание с белками плазмы почти полное - 98-99%. Проникает через плацентарный барьер, выделяется с грудным молоком.

Метаболизм

Метаболизируется с образованием метаболитов, обладающих высокой способностью блокировать β-адренорецепторы.

Выведение

$T_{1/2}$ - 6-10 ч. Выводится , в основном, с желчью.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пожилых пациентов концентрация карведилола в плазме крови приблизительно на 50% выше, чем у молодых пациентов.

У больных с нарушениями функции печени биодоступность может возрастать до 80%.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия (в качестве моно- или комбинированной терапии);

— стабильная стенокардия;

— хроническая сердечная недостаточность (в составе комбинированной терапии).

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Сердечная недостаточность
- Стенокардия

Противопоказания:

— тяжелая печеночная недостаточность;

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

— СССУ;

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

— хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;

— острая сердечная недостаточность;

— кардиогенный шок;

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

— беременность;

— лактация (грудное вскармливание);

— детский и подростковый возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к карведилолу и другим компонентам препарата.

С осторожностью назначают препарат при стенокардии Принцметала, тиреотоксикозе, окклюзионных заболеваниях периферических сосудов, феохромоцитоме, псориазе, почечной недостаточности, AV-блокаде I степени, обширных хирургических вмешательствах и общей анестезии, при сахарном диабете, гипогликемии, депрессии, миастении.

Способ применения и дозы:

Режим дозирования устанавливают индивидуально.

Препарат принимают внутрь, независимо от приема пищи.

При *артериальной гипертензии* в течение первых 7-14 дней рекомендуемая начальная доза составляет 12.5 мг/сут (1 таб.) утром после завтрака. Дозу можно разделить на 2 приема по 6.25 мг Карведилола (1/2 таб. по 12.5 мг). Далее препарат назначают в дозе 25 мг (1 таб. 25 мг) в 1 прием утром, или разделить на 2 приема по 12.5 мг (1 таб. 12.5 мг). При необходимости через 14 дней возможно еще раз повысить дозу.

При *стабильной стенокардии* начальная доза Карведилола составляет 12.5 мг (1 таб. 12.5 мг) 2 раза/сут. Через 7-14 дней доза может быть повышена до 25 мг (1 таб. 25 мг) 2 раза/сут. При недостаточной эффективности и хорошей переносимости через 14 днейи доза Карведилола может быть еще увеличена. Суточная доза Карведилола при стенокардии не должна превышать 50 мг (2 таб. по 25 мг), назначаемого 2 раза/сут.

Пациентам в возрасте старше 70 лет суточная доза Карведилола не должна превышать 25 мг (1 таб. 25 мг) 2 раза/сут.

При отмене препарата снижение дозы следует проводить постепенно в течение 1-2 недель.

При пропуске очередного приема препарат надо принять как можно скорее. Однако если наступает время следующего приема, то нужно принять только одну разовую дозу (без удвоения).

При перерыве в приеме препарата более 2 недель необходимо возобновлять лечение с наименьших доз Карведилола.

Таблетки принимают после еды, запивая небольшим количеством воды.

При *хронической сердечной недостаточности* дозу подбирают индивидуально, под тщательным наблюдением врача. Рекомендуемая начальная доза составляет 3.125 мг 2 раза/сут в течение 2 недель. При хорошей переносимости дозу увеличивают с интервалом не менее 2 недель до 6.25 мг 2 раза/сут, затем по 12.5 мг 2 раза/сут и далее - до 25 мг 2 раза/сут. Дозу следует увеличивать до максимальной, которая хорошо переносится пациентом. У пациентов с массой тела менее 85 кг целевая доза составляет 50 мг/сут, у пациентов с массой тела более 85 кг целевая доза составляет 75-100 мг/сут. Если лечение прерывается более чем на 2 недели, то его возобновление начинают с дозы 3.125 мг 2 раза/сут, с последующим увеличением дозы.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головная боль, головокружение, синкопальные состояния, мышечная слабость (чаще в начале лечения), нарушения сна, депрессия, парестезии.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: брадикардия, ортостатическая гипотензия, стенокардия, AV-блокада; редко - нарушения периферического кровообращения, перемежающаяся хромота, прогрессирование сердечной недостаточности.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, тошнота, абдоминальные боли, диарея, запор, рвота,

повышение активности печеночных трансаминаз.

Со стороны системы кроветворения: тромбоцитопения, лейкопения.

Со стороны мочевыделительной системы: тяжелые нарушения функции почек, отеки.

Аллергические реакции: кожные реакции (экзантема, крапивница, зуд, сыпь), обострение псориаза, чиханье, заложенность носа, бронхоспазм, одышка (у предрасположенных пациентов).

Прочие: гриппоподобный синдром, боли в конечностях, уменьшение слезоотделения, увеличение массы тела.

Передозировка:

Симптомы: выраженная артериальная гипотензия, брадикардия, нарушения дыхания (в т.ч. бронхоспазм), сердечная недостаточность, кардиогенный шок, остановка сердца.

Лечение: если пациент находится в сознании, необходимо вызвать рвоту. Больному следует придать горизонтальное положение с приподнятыми ногами.

Пациента без сознания следует уложить на бок и принять меры для удаления невсосавшегося препарата. В таких случаях требуется госпитализация.

При необходимости проводят симптоматическую терапию, вводят агонисты адренорецепторов.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

На фоне терапии Карведилолом дилтиазем и верапамил нельзя назначать в/в из-за возможного выраженного уменьшения ЧСС и выраженного снижения АД.

Некоторые антиаритмические препараты, препараты для наркоза, антигипертензивные препараты, антиангинальные препараты, другие бета-адреноблокаторы (в т.ч. применяемые в виде глазных капель), ингибиторы МАО, симпатолитики (резерпин) и сердечные гликозиды могут усиливать эффект Карведилола. При одновременном назначении с Карведилолом дозы данных препаратов следует подбирать с осторожностью.

При одновременном применении с индукторами печеночных ферментов (например, с рифампицином, фенобарбиталом) концентрация карведилола в плазме крови может снижаться, а при совместном применении с ингибиторами печеночных ферментов (например, циметидином) концентрация карведилола в плазме может возрастать.

При одновременном применении Карведилол может увеличивать концентрацию дигоксина в плазме крови.

Одновременное назначение Карведилола с алкалоидами спорыньи ухудшает периферическое кровообращение.

Карведилол может усиливать эффект гипогликемических препаратов и маскировать проявления гипогликемии (рекомендуется регулярно контролировать уровень глюкозы в крови).

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью следует назначать препарат пациентам с бронхоспастическим синдромом, хроническим бронхитом, эмфиземой легких.

В начале лечения Карведилолом и при повышении дозы препарата возможно резкое снижение АД и ортостатические реакции. Может наблюдаться головокружение вплоть до обмороков, особенно у пожилых пациентов, при сердечной недостаточности, при применении комбинированной антигипертензивной терапии или при применении диуретиков.

Препарат не рекомендован к применению пациентам с низким АД.

Лечение Карведилолом не должно резко прекращаться, в особенности у пациентов со стенокардией, т.к. это может привести к ухудшению состояния. Снижение дозы препарата должно быть постепенным в течение 1-2 недель.

В период применения Карведилола необходимо контролировать функцию почек у пациентов с почечной

недостаточностью, ИБС, заболеваниями периферических сосудов, артериальной гипотензией и/или сердечной недостаточностью. При ухудшении функции почек препарат следует отменить.

Назначение бета-адреноблокаторов пациентам с заболеваниями периферических сосудов, с псориазом и анафилактическими реакциями в анамнезе может привести к ухудшению течения заболевания, а при стенокардии Принцметала может провоцировать появление загрудинных болей. Кроме того, применение Карведилола может снижать чувствительность аллергических проб.

Назначение препарата может маскировать симптомы тиреотоксикоза и ранние симптомы гипергликемии. При сахарном диабете рекомендуется регулярный контроль уровня глюкозы в крови и при необходимости коррекция гипогликемической терапии.

На фоне применения Карведилола с осторожностью следует проводить общую анестезию с использованием препаратов с отрицательным инотропным действием (эфир, циклопропан, трихлорэтилен). Пациент должен проинформировать врача о приеме Карведилола. Перед обширными хирургическими вмешательствами рекомендуется постепенная отмена препарата.

Необходимо соблюдать осторожность при применении препарата в случае выраженного метаболического ацидоза.

При применении препарата у пациентов с феохромоцитомой перед началом терапии назначают альфа-адреноблокаторы.

Следует избегать применения препарата при ношении контактных линз из-за уменьшения слезоотделения.

В период применения препарата следует избегать употребления алкоголя.

Следует учитывать, что при необходимости отмены комбинированной терапии Карведилолом и клонидином Карведилол следует отменять первым, за несколько дней до постепенного уменьшения дозы клонидина.

Использование в педиатрии

Безопасность и эффективность применения Карведилола у **детей и подростков в возрасте до 18 лет** не установлены.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Следует иметь в виду, что в начале лечения и при повышении дозы Карведилола АД может чрезмерно снижаться, вызывая головокружение. Поэтому в период лечения пациентам следует воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С осторожностью назначают препарат при почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелой печеночной недостаточности.

Применение в пожилом возрасте

Пациентам в возрасте старше 70 лет суточная доза Карведилола не должна превышать 25 мг (1 таб. 25 мг) 2 раза/сут.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан детям и подросткам до 18 лет.

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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