Карведилол-Тева



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки круглые, двояковыпуклые, белого или почти белого цвета.

	1 таб.
карведилол	3.125 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, лактозы моногидрат, гидроксипропилцеллюлоза, крахмал кукурузный, тальк, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Таблетки круглые, двояковыпуклые, белого или почти белого цвета.

	1 таб.
карведилол	6.25 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, лактозы моногидрат, гидроксипропилцеллюлоза, крахмал кукурузный, тальк, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Таблетки круглые, двояковыпуклые, белого или почти белого цвета.

	1 таб.
карведилол	12.5 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, лактозы моногидрат, гидроксипропилцеллюлоза, крахмал кукурузный, тальк, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Таблетки круглые, двояковыпуклые, белого или почти белого цвета.

	1 таб.
карведилол	25 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, лактозы моногидрат, гидроксипропилцеллюлоза, крахмал кукурузный, тальк, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

30 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Бета- и альфа-адреноблокатор без внутренней симпатомиметической активности. Оказывает сочетанное неселективное действие, обусловленное блокадой β- и α_1-адренорецепторов. Вазодилатирующий эффект связан, главным образом, с блокадой α_1- адренорецепторов. Благодаря вазодилатации уменьшает ОПСС. Оказывает мембраностабилизирующее действие. Обладает выраженной антиоксидантной активностью.

Благодаря совокупности сосудорасширяющего и бета-адреноблокирующего действия карведилола у пациентов с артериальной гипертензией снижение АД не сопровождается одновременным увеличением ОПСС, которое отмечается при приеме бета-адреноблокаторов; карведилол незначительно уменьшает ЧСС, сохраняя при этом почечный кровоток и функцию почек. Так как периферический кровоток сохраняется, похолодание конечностей отмечается очень редко, в отличие от больных, у которых проводится лечение бета-адреноблокаторами.

Антигипертензивный эффект развивается быстро - через 2-3 ч после однократного приема и продолжается в течение 24 ч. При продолжительном лечении максимальный эффект отмечается через 3-4 нед.

У больных ИБС карведилол оказывает противоишемическое антиангинальное действие. Снижает пред- и постнагрузку на сердце.

У пациентов с нарушениями функции левого желудочка и/или недостаточностью кровообращения карведилол оказывает благоприятный эффект на гемодинамические показатели: повышает функцию выброса левого желудочка и уменьшает его размеры. Благоприятное воздействие карведилола на гемодинамику сердца, фракцию выброса левого желудочка наблюдается как при дилатационной кардиомиопатии, так и при сердечной недостаточности, обусловленной ишемией миокарда. При сердечной недостаточности карведилол уменьшает конечно-систолический и конечно-диастолический объем, а также периферическое и легочное сосудистое сопротивление. Фракция выброса и сердечный индекс при нормальной функции сердца не изменяются.

Действие карведилола более выражено у пациентов с тахикардией (ЧСС более 82 уд./мин) и низкой фракцией выброса (менее 23%).

Не оказывает выраженного влияния на липидный обмен и содержание ионов калия, натрия, магния в плазме крови. На фоне лечения карведилолом соотношение Хс-ЛПВП/Хс-ЛПНП не изменяется.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь карведилол быстро и почти полностью всасывается из ЖКТ. C_{max} в плазме крови достигается через 1 ч после приема препарата. Биодоступность составляет 25%. Концентрация в плазме крови и доза находятся в линейной зависимости. Биодоступность и величина C_{max} в плазме крови не зависят от приема пищи, увеличивается лишь время достижения C_{max}.

Распределение

Связывание с белками плазмы крови высокое - 98-99%. V_d составляет около 2 л/к. Проникает через плацентарный барьер и выделяется с грудным молоком.

Метаболизм

Метаболизируется преимущественно в печени за счет интенсивного соединения с глюкуроновой кислотой. Путем деметилирования и гидроксилирования фенильного кольца образуются три активных метаболита, обладающих выраженным антиоксидантным и адреноблокирующим действием.

Выведение

$T_{1/2}$ карведилола составляет 6-10 ч, плазменный клиренс - около 590 мл/мин. Выводится в основном с желчью и небольшая часть - почками.

Фармакокинетка в особых клинических случаях

У пациентов с нарушениями функции печени V_d увеличивается на 80 % за счет уменьшения эффекта "первого прохождения" через печень. Карведилол практически не удаляется из крови при гемодиализе.

У пациентов пожилого возраста концентрация карведилола в плазме крови на 50% выше, чем у молодых. Так как карведилол выводится в основном через ЖКТ, нарушение функции почек не сопровождается кумуляцией препарата.

При циррозе печени биодоступность карведилола в 4 раза, а C_{max} в плазме крови в 5 раз выше, чем у пациентов с нормальной функцией печени.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия (в виде монотерапии и в комбинации с другими антигипертензивными средствами);

— стабильная стенокардия;

— хроническая сердечная недостаточность (II и III функциональный класс по классификации NYHA) в комбинации с диуретиками, дигоксином или ингибиторами АПФ.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Сердечная недостаточность
- Стенокардия

Противопоказания:

— сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;

— СССУ;

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

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

— кардиогенный шок;

— бронхиальная астма;

— выраженные нарушения функции печени;

— метаболический ацидоз;

— беременность;

— период лактации;

— детский и подростковый возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

— одновременное в/в введение верапамила, дилтиазема или других антиаритмических средств (особенно антиаритмиков I класса);

— повышенная чувствительность к карведилолу или другим компонентам препарата.

С *осторожностью* и под контролем врача следует применять препарат у пациентов с сахарным диабетом, при гипогликемии, тиреотоксикозе, феохромоцитоме (только при стабильном течении, достигнутом терапией альфа-адреноблокаторами), окклюзионных заболеваниях периферических сосудов, AV-блокаде I степени, ХОБЛ, стенокардии Принцметала, псориазе, нарушениях функции почек, депрессии, миастении, при лечении альфа-адреноблокаторами и альфа-адреномиметиками, при одновременном применении с препаратами наперстянки, диуретиками и/или ингибиторами МАО; у пациентов пожилого возраста, при обширных хирургических вмешательствах и общей анестезии.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь. Таблетки следует запивать достаточным количеством жидкости.

Артериальная гипертензия

Для взрослых начальная доза составляет 12.5 мг 1 раз/сут в течение первых 2 дней. Затем назначают по 25 мг 1 раз/сут. В случае необходимости, дозу увеличивают. Максимальная доза - 50 мг/сут в 1 или 2 приема (утром и вечером). Повышение дозы следует проводить постепенно с интервалом не менее 2 недель.

У **пациентов пожилого возраста** в ряде случаев может быть эффективна доза 12.5 мг.

Стенокардия

Для взрослых начальная доза - по 12.5 мг 2 раза/сут в течение первых 2 дней. Затем назначают по 25 мг 2 раза/сут(утром и вечером). В случае необходимости, дозу повышают с интервалом в 2 недели до максимальной, составляющей 100 мг/сут, разделенной на 2 приема.

Для **пациентов пожилого возраста** максимальная суточная доза составляет 50 мг, разделенная на 2 приема.

Хроническая сердечная недостаточность

Дозу подбирают индивидуально. При увеличении дозы проводят тщательное мониторирование. Следует наблюдать за состоянием больного в течение первых 2-3 ч после первого приема препарата или после первой увеличенной дозы. Дополнительное применение Карветренда возможно только при стабильном клиническом состоянии. Необходимо, чтобы режим дозирования других лекарственных препаратов, таких как дигоксин, диуретики и ингибиторы АПФ, был определен до назначения Карветренда.

Рекомендуемая начальная доза составляет 3.125 мг 2 раза/сут в течение 14 дней. При хорошей переносимости препарата и необходимости увеличения дозы назначают по 6.25 мг 2 раза/сут, затем до 12.5 мг и далее - до 25 мг 2 раза/сут. Препарат назначают в максимальной переносимой дозе. Максимальная рекомендуемая доза:
для **пациентов с массой тела до 85 кг** - по 25 мг 2 раза/сут; для **пациентов с массой тела более 85 кг** - по 50 мг 2 раза/сут.

Пациентам с сердечной недостаточностью с целью предотвращения ортостатической гипотензии рекомендуется принимать препарат во время еды.

В начале лечения и при каждом увеличении дозы состояние больных следует контролировать, т.к. возможно ухудшение течения сердечной недостаточности. Может произойти задержка жидкости, и в связи с сосудорасширяющим действием - артериальная гипотензия и вялость. При задержке жидкости следует повысить дозы диуретиков, кроме того, может потребоваться временное снижение дозы Карветренда. В некоторых случаях лечение Карветрендом следует временно приостановить.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: редко - тошнота, сухость во рту, боли в животе, диарея или запор, рвота, повышение активности печеночных трансаминаз.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: редко - головная боль, головокружение, чувство усталости, потеря сознания, мышечная слабость (как правило, в начале лечения), нарушение сна, депрессия, парестезии.

Со стороны органов кроветворения: редко - лейкопения, тромбоцитопения.

Аллергические реакции: редко - экзатема, крапивница, зуд, высыпания, появление и/или обострение псориаза, чиханье, заложенность носа; в отдельных случаях - анафилактоидная реакция.

Со стороны дыхательной системы: редко - одышка, бронхоспазм (у предрасположенных пациентов).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - брадикардия, ортостатическая гипотензия, стенокардия, AV-блокада, прогрессирование недостаточности кровообращения (холодные конечности), прогрессирование сердечной недостаточности, отеки нижних конечностей; редко - обострение синдрома "перемежающейся хромоты", синдрома Рейно.

Со стороны обмена веществ: редко - увеличение массы тела, нарушение углеводного обмена. Как и при применении других альфа-адреноблокаторов, может проявиться латентно текущий сахарный диабет или усилиться его симптомы.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - нарушение мочеиспускания, нарушение функции почек.

Прочие: редко - боли в конечностях, гриппоподобный синдром, уменьшение слезоотделения.

При применении в рекомендуемых дозах препарат хорошо переносится.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД (систолическое - 80 мм рт.ст. и ниже), брадикардия (менее 50 уд./мин), нарушения дыхательной функции (бронхоспазм), хроническая недостаточность кровообращения, кардиогенный шок, остановка сердца.

Лечение: в течение первых часов следует вызвать рвоту и промыть желудок. Передозировка требует интенсивного лечения. Антидотом в отношении бета-адреноблокирующего действия является орципреналин или изопреналин 0.5-1 мг в/в и/или глюкагон в дозе 1-5 мг (максимальная доза 10 мг). При выраженной брадикардии назначают в/в атропин в дозе 0.5-2 мг. Для поддержания сердечной деятельности в/в струйно (в течение 30 сек) вводят глюкагон, после этого проводят длительную инфузию из расчета 2-5 мг/час. Если преобладает периферическое сосудорасширяющее действие (теплые конечности, помимо значительной артериальной гипотензии) необходимо назначить норадреналин в повторных дозах по 5-10 мкг или в виде инфузии - 5 мкг/мин. Для купирования бронхоспазма назначают бета-адреномиметики (в виде аэрозоля или в/в) или аминофиллин в/в. Если развиваются судороги, рекомендуется медленное введение диазепама или клоназепама. В тяжелых случаях интоксикации, когда доминируют симптомы шока, лечение антидотами следует продолжать до стабилизации состояния пациента, с учетом периода $T_{1/2}$

карведилола 6-10 ч. В ОИТ следует проводить контроль и коррекцию жизненно важных показателей.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение при беременности и в период лактации противопоказано.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении карведилол может потенцировать действие других антигипертензивных средств или препаратов, которые оказывают гипотензивный эффект (в т.ч. нитратов).

При совместном применении карведилола и дилтиазема могут развиваться нарушения проводимости сердца и нарушения гемодинамики.

При одновременном приеме карведилола и дигоксина повышается концентрация последнего и может увеличиваться время AV-проведения.

Карведилол может потенцировать действие инсулина и пероральных гипогликемических средств, при этом симптомы гипогликемии (особенно тахикардия) могут маскироваться, поэтому у больных сахарным диабетом рекомендуется регулярный контроль уровня сахара в крови.

Ингибиторы микросомального окисления (циметидин) усиливают, а индукторы (фенобарбитал, рифампицин) ослабляют гипотензивный эффект карведилола.

Препараты, снижающие содержание катехоламинов (резерпин, ингибиторы МАО), повышают риск развития артериальной гипотензии и выраженной брадикардии.

При одновременном применении циклоспорина увеличивается концентрация последнего (рекомендуется коррекция суточной дозы циклоспорина).

При одновременном назначении клонидина возможно потенцирование эффектов карведилола - усиление антигипертензивного действия и брадикардии.

Общие анестетики усиливают отрицательный инотропный и гипотензивный эффекты карведилола.

Особые указания и меры предосторожности:

Терапию Карветрендом следует проводить длительно, не допуская внезапного прекращения приема препарата, т.к. это может приводить к ухудшению течения основного заболевания. В случае необходимости снижение дозы препарата следует проводить постепенно, в течение 1-2 недель.

В начале терапии Карветрендом или при повышении дозы препарата у пациентов, особенно пожилого возраста, может отмечаться чрезмерное снижение АД, преимущественно при вставании. Необходима коррекция дозы препарата.

В случае снижения ЧСС до 55 уд./мин препарат следует отменить.

У больных с хронической сердечной недостаточностью при подборе дозы возможно нарастание симптомов сердечной недостаточности, появление отеков. При этом не следует увеличивать дозу Карветренда. Рекомендуется назначать диуретики в высоких дозах вплоть до стабилизации состояния больного.

Рекомендуется постоянное мониторирование ЭКГ и АД при одновременном назначении Карветренда и блокаторов медленных кальциевых каналов, производных фенилалкиламина (верапамил) и бензотиазепина (дилтиазем), а также - с антиаритмическими средствами I класса.

Рекомендуется контролировать функцию почек у пациентов с хронической почечной недостаточностью, артериальной гипотензией и хронической сердечной недостаточностью.

В случае проведения хирургического вмешательства с использованием общей анестезии следует предупредить анестезиолога о предшествующей терапии карведилолом.

Карветренд не влияет на концентрацию глюкозы в крови и не вызывает изменений показателей теста толерантности к глюкозе у пациентов с инсулиннезависимым сахарным диабетом.

Больным с феохромоцитомой до начала терапии необходимо назначить альфа-адреноблокаторы.

У лиц, страдающих аллергией или проходящих курс десенсибилизации, карведилол может повысить

аллергочувствительность.

Больным, использующим контактные линзы, следует учитывать, что препарат может вызвать уменьшение слезоотделения.

В период лечения следует избегать употребления этанола.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Не рекомендуется управлять автомобилем в начале терапии и при увеличении дозы Карветренда. Следует воздержаться от других видов деятельности, связанных с необходимостью высокой концентрации внимания и быстрых психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С*осторожностью* и под контролем врача следует применять препарат при нарушениях функции почек.

При нарушениях функции печени

Препарат противопоказан к применению при выраженных нарушениях функции печени.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью и под контролем врача следует применять у пожилых пациентов.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан детям и подросткам до 18 лет.

Условия хранения:

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

Таблетки следует хранить в картонной пачке, т.к. при хранении на свету возможно изменение цвета таблеток.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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