Карведилол Сандоз



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 желтого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской с двух сторон и на боках и с надписью "С2" на одной стороне.

	1 таб.
карведилол	6.25 мг

Вспомогательные вещества: железа оксид желтый, лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, кросповидон, повидон К30, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Таблетки розовато-бежевого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской с двух сторон и на боках и с надписью "С3" на одной стороне.

	1 таб.
карведилол	12.5 мг

Вспомогательные вещества: железа оксид красный, железа оксид желтый, лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, кросповидон, повидон К30, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Таблетки белого или практически белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской с двух сторон и на боках и с надписью "С4" на одной стороне.

	1 таб.
карведилол	25 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, кросповидон, повидон К30, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Вегетотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Бета$_1$-,бета$_2$-адреноблокатор. Альфа$_1$-адреноблокатор. Оказывает сочетанное неселективное бета-адреноблокирующее, альфа$_1$-адреноблокирующее и антиоксидантное действие. Вазодилатирующий эффект связан, главным образом, с блокадой α_1-адренорецепторов. Благодаря вазодилатации снижает ОПСС. Не обладает внутренней симпатомиметической активностью и, подобно пропранололу, оказывает мембраностабилизирующее действие.

Устраняет свободные кислородные радикалы.

Совокупность сосудорасширяющего действия и бета-адреноблокирующих свойств карведилола приводит к тому, что у больных артериальной гипертензией снижение АД не сопровождается одновременным увеличением ОПСС, которое отмечается при приеме бета-адреноблокаторов. Незначительно уменьшается ЧСС, почечный кровоток и функция почек сохраняются. 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 недели.

У больных ИБС карведилол оказывает противоишемическое и антиангинальное действие. Снижает пред- и постнагрузку на сердце. Не оказывает выраженного влияния на липидный обмен и содержание ионов калия, натрия и магния в плазме.

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.

Карведилол оказывает благоприятный эффект на гемодинамику сердца и фракцию выброса левого желудочка как при дилатационной кардиомиопатии, так и при ишемической форме сердечной недостаточности. При сердечной недостаточности уменьшается конечно-систолический и конечно-диастолический объем, а также периферическое и легочное сосудистое сопротивление. Фракция выброса и сердечный индекс при нормальной функции сердца не изменяются.

В случае нарушения функции левого желудочка альфа$_1$-адреноблокирующее действие карведилола приводит к расширению артериальных и, в меньшей степени, венозных сосудов. Установлено, что при дополнительном назначении на фоне принимаемых сердечных гликозидов, ингибиторов АПФ и диуретиков карведилол уменьшает показатель смертности, замедляет прогрессирование болезни и улучшает общее состояние больного независимо от тяжести заболевания. Действие карведилола более выражено у пациентов с тахикардией (ЧСС более 82 уд./мин) и низкой фракцией выброса (менее 23%).

Во время лечения карведилолом соотношение Хс-ЛПВП/ЛПНП не изменяется.

Фармакокинетика

Всасывание

Абсорбция карведилола быстрая и высокая. C_{max} в плазме крови достигается через 1 ч после приема препарата. Концентрация в плазме пропорциональна принятой дозе. Биодоступность составляет около 30%. Одновременный прием пищи замедляет всасывание препарата, но не влияет на величину биодоступности.

Распределение

Связывание с белками плазмы составляет около 98-99%. V_d - около 2 л/кг.

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 с выраженными антиоксидантными и адреноблокирующими свойствами.

Выведение

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

Карведилол практически не выводится при гемодиализе.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При циррозе печени биодоступность карведилола в 4 раза выше, а максимальная концентрация в плазме крови в 5 раз выше, чем в норме.

V_d увеличивается (на 80%) в случае нарушения функции печени (за счет уменьшения эффекта первого прохождения через печень).

Следует учитывать, что у пожилых пациентов концентрация карведилола в плазме крови на 50% выше, чем в молодом возрасте.

Карведилол выводится в основном через ЖКТ, поэтому при нарушении функции почек кумуляции препарата не наблюдается.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия в виде моно- или комбинированной терапии (в сочетании с тиазидными диуретиками);

— стабильная стенокардия;

— хроническая сердечная недостаточность в комбинации с диуретиками, дигоксином или ингибиторами АПФ.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Сердечная недостаточность
- Стенокардия
- ТИА

Противопоказания:

— хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации;

— СССУ;

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

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

— кардиогенный шок, коллапс;

— бронхиальная астма;

— тяжелые нарушения функции печени;

— метаболический ацидоз;

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

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

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

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* и под контролем следует назначать препарат при сахарном диабете, гипогликемии, тиреотоксикозе, феохромоцитоме (только стабилизированная назначением альфа-адреноблокаторов), окклюзионных заболеваниях периферических сосудов, AV-блокаде I степени, хронических обструктивных заболеваниях легких, 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, а также пациентам пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

Карведилол Сандоз принимают внутрь, запивая достаточным количеством жидкости.

Артериальная гипертензия

Начальная доза - 12.5 мг 1 раз/сут (утром после завтрака) в течение первых 2-х дней, затем - по 25 мг 1 раз/сут. При необходимости через 14 дней доза может быть увеличена. Максимальная доза - 50 мг/сут в 1 или 2 приема (утром и вечером).

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

Стенокардия

Начальная доза - по 12.5 мг 2 раза/сут в течение первых 2-х дней, затем - по 25 мг 2 раза/сут (утром и вечером). В случае необходимости через 7-14 дней суточная доза может быть повышена до максимальной, составляющей 100 мг/сут, разделенной на 2 приема.

У **пожилых пациентов** максимальная суточная доза составляет 50 мг, разделенные на 2 приема.

Хроническая сердечная недостаточность

Дозу подбирают индивидуально, проводя тщательное мониторирование. Следует наблюдать за состоянием больного в течение первых 2-3 ч после первого приема или после первой увеличенной дозы. Доза и назначение других лекарственных средств, таких как дигоксин, диуретики и ингибиторы АПФ должны быть зафиксированы до назначения препарата Карведилол Сандоз.

Карведилол Сандоз следует принимать во время еды (для уменьшения риска ортостатической гипотензии).

Рекомендуемая начальная доза составляет 3.125 мг 2 раза/сут в течение 14 дней. При хорошей переносимости препарата и необходимости увеличения дозировки препарат назначают в дозе 6.25 мг 2 раза/сут, затем - до 25 мг 2 раза/сут. Больным назначают максимально переносимую дозу. Максимальная рекомендуемая доза - по 25 мг 2 раза/сут для **больных с массой тела до 85 кг** и по 50 мг 2 раза/сут - для **больных с массой тела более 85 кг**.

В начале лечения и до каждого увеличения дозы следует контролировать состояние больного, т.к. возможно ухудшение течения сердечной недостаточности. Может развиться задержка жидкости, а в связи с наличием сосудорасширяющего эффекта - артериальная гипотензия и вялость. При задержке жидкости следует повысить дозу диуретиков, кроме того, может потребоваться временное снижение дозы препарата Карведилол Сандоз. Иногда требуется временное прекращение лечения.

Побочное действие:

В рекомендуемых дозах Карведилол Сандоз хорошо переносится, однако в отдельных случаях возможны побочные эффекты.

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

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

Со стороны органов чувств: уменьшение слезовыделения.

Со стороны мочеполовой системы: нарушения со стороны функции почек, отеки.

Со стороны органов кроветворения: лейкопения, тромбоцитопения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: брадикардия, отростатическая гипотензия, стенокардия, AV-блокада, прогрессирование недостаточности кровообращения (холодные конечности), прогрессирование сердечной недостаточности.

Аллергические реакции: крапивница, зуд, высыпания, появление и/или обострение псориаза, чиханье, заложенность носа, бронхоспазм, одышка (у предрасположенных пациентов); очень редко - анафилактоидные реакции.

Прочие: редко обострение синдрома перемежающейся хромоты, синдрома Рейно, боли в конечностях, нарушение мочеиспускания, гриппоподобный синдром, увеличение массы тела.

Как и при применении других альфа-адреноблокаторов, может проявиться латентно текущий сахарный диабет или усилиться его симптоматика.

Передозировка:

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

Лечение: в течение первых 2 ч следует вызвать рвоту и промыть желудок. Передозировка требует интенсивного лечения. Больной должен находиться в положении с приподнятыми ногами (в положении Тренделенбурга). Антидотом бета-адреноблокирующего действия является орципреналин или изопреналин в дозе 0.5-1 мг в/в и/или глюкагон в дозе 1-5 мг (максимальная доза 10 мг). Тяжелая гипотензия лечится парентеральным введением жидкости и повторным введением эпинефрина (адреналина) в дозе 5-10 мг (или его в/в инфузия со скоростью 5 мкг/мин).

При чрезмерной брадикардии назначают в/в атропин в дозе 0.5-2 мг. Для поддержания сердечной деятельности в/в быстро (в течение 30 сек) вводят глюкагон, после чего проводят постоянную инфузию из расчета 2-5 мг/ч. 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-адреноблокаторы (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 должно продолжаться пока не стабилизируется состояние больного, с учетом $T_{1/2}$ карведилола 6-10 ч.

В условиях реанимации проводить контроль за показателями жизненно важных органов.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан при беременности.

При необходимости применения препарата Карведилол Сандоз в период лактации, следует отменить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении препарата Карведилол Сандоз со средствами, истощающими запасы катехоламинов (резерпин, ингибиторы МАО), может развиваться тяжелая брадикардия и артериальная гипотензия.

Одновременное назначение с карведилолом ингибиторов АПФ, тиазидных диуретиков, вазодилататоров, назначаемых одновременно, может привести к резкому падению АД.

Карведилол усиливает действие инсулина и производных сульфонилмочевины (одновременно маскируя или ослабляя выраженность симптомов гипогликемии, снижая расщепление гликогена печени до глюкозы). При одновременном назначении с инсулином или гипогликемическими препаратами перорального применения, следует контролировать уровень глюкозы в крови.

При одновременном применении с ингибиторами изофермента CYP2D6 (хинидин, флуоксетин, пропафенон) возможно повышение концентрации R(+) энантиомера карведилола.

Совместное применение карведилола с антиаритмическими средствами (особенно I класса) и блокаторами медленных кальциевых каналов (верапамил, дилтиазем) может спровоцировать выраженную артериальную гипотензию и сердечную недостаточность. В/в введение этих препаратов вместе с приемом карведилола противопоказано.

Карведилол повышает концентрацию дигоксина, что требует проведение контроля за его концентрацией, т.к. одновременное назначение с сердечными гликозидами может приводить к AV-блокаде.

Общие анестетики усиливают отрицательный инотропный и гипотензивный эффект карведилола.

Фенобарбитал и рифампицин ускоряют метаболизм и снижают концентрацию карведилола в плазме.

Ингибиторы микросомального окисления (циметидин), диуретики и ингибиторы АПФ повышают концентрацию и усиливают гипотензивный эффект карведилола.

Карведилол задерживает метаболизм циклоспорина.

Особые указания и меры предосторожности:

В случае снижения ЧСС до 55 уд./мин прием препарата следует прекратить.

У пациентов с аллергией или проходящих курс десенсибилизации, прием карведилола может повысить аллергочувствительность.

Пациентов, пользующихся контактными линзами, следует предупредить о том, что препарат снижает слезовыделение.

При завершении курса лечения препаратом Карведилол Сандоз одновременно с клонидином сначала постепенно снижают дозировку клонидина и затем сначала отменяют клонидин, а затем карведилол.

В период лечения исключить прием алкоголя.

При прогрессировании недостаточности кровообращения на фоне лечения рекомендуется увеличить дозу диуретиков, при почечной недостаточности провести корректировку дозы с учетом показателей функционального состояния почек.

При необходимости хирургического вмешательства с использованием общей анестезии следует предупредить анестезиолога о предшествующей терапии карведилолом.

Следует учитывать, что препарат может маскировать симптомы тиреотоксикоза и гипогликемии, поэтому рекомендуется проводить регулярный контроль уровня глюкозы в крови и проводить при необходимости корректировку доз.

Отмена препарата должна производиться постепенно (в течение 1-2 недель) во избежание развития синдрома отмены, особенно у больных ИБС.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

С осторожностью следует назначать пациентам, работа которых требует быстрой психомоторной реакции (управление транспортными средствами, работа с техникой).

При нарушениях функции почек

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

При нарушениях функции печени

Препарат противопоказан при выраженных нарушениях функции печени.

Применение в пожилом возрасте

С *осторожностью* и под контролем следует назначать препарат пациентам пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Противопоказано: возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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