ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ПРЕПАРАТА

КАРВЕДИЛОЛ-КВ

Состав.

Действующее вещество: карведилол;

1 таблетка содержит 12,5 или 25 мг карведилола;

вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, сахароза, повидон, кросповидон, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

Лекарственная форма. Таблетки.

Фармакотерапевтическая группа. Средства, влияющие на сердечно-сосудистую систему. Сочетанные блокаторы альфа- и бета-адренорецепторов. Код АТС C07A G02.

Клинические характеристики.

Показания.Артериальная гипертензия (в виде монотерапии и в комбинации с другими антигипертензивными средствами), стабильная стенокардия, хроническая сердечная недостаточность (I–III стадии по NYHA) в комбинации с диуретиками, дигоксином и ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента.

Противопоказания. Повышенная индивидуальнаячувствительность к компонентам препарата, артериальная гипотензия, декомпенсированная сердечная недостаточность, выраженная брадикардия (менее 50 уд/мин), атриовентрикулярная блокада II и III степени (за исключением пациентов с искусственным водителем ритма), синдром слабости синусового узла, кардиогенный шок, хронические обструктивные заболевания легких, бронхиальная астма, выраженные нарушения функции печени, метаболический ацидоз. Беременность, период грудного вскармливания, детский возраст (до 18 лет).

Способ применения и дозы. Назначают взрослым независимо от приема пищи. Доза и продолжительность лечения определяется индивидуально врачом в зависимости от заболевания, переносимости и эффективности терапии. При недостаточности кровообращения лучше принимать во время еды, чтобы замедлить всасывание и уменьшить риск ортостатических реакций. Таблетку глотают, не разжевывая, запивая достаточным количеством жидкости.

Артериальная гипертензия. Начальная доза обычно составляет 12,5 мг 1 раз в сутки в течение первых 2 дней (дозу можно разделить на два приема по 6,25 мг), что уже может обеспечить необходимый эффект. При необходимости дозу можно увеличить через 2 дня до 25 мг 1 раз в сутки, затем с интервалом не менее двух недель до 50 мг в сутки, однократно или за 2 приема (утром и вечером по 25 мг). Максимальная суточная доза — 50 мг.

Стенокардия. Начальная доза обычно составляет по 12,5 мг 2 раза в сутки в течение первых 2 дней, затем по 25 мг 2 раза в сутки (утром и вечером). При необходимости дозу можно увеличить с интервалами не менее двух недель до максимальной суточной дозы 100 мг, разделенной на 2 приема. Для больных пожилого возраста максимальная суточная доза составляет 50 мг, разделенная на 2 приема.

Хроническая сердечная недостаточность. Дозу подбирают индивидуально, проводя тщательное мониторирование состояния пациента. Пациент должен находиться под постоянным наблюдением в первые 2–3 ч после первого приема препарата и после приема увеличенной дозы. Дозы дигоксина, диуретиков и ингибиторов ангиотензинпревращающих ферментов должны быть зафиксированы до назначения препарата. Рекомендованная начальная доза обычно составляет 6,25 мг 1 раз в сутки. При хорошей переносимости и необходимости в повышении дозы, ее увеличивают с интервалами не менее двух недель до 6,25 мг два раза в сутки, затем — до 12,5 мг два раза в сутки, после чего — до 25 мг два раза в сутки. Для пациентов с массой тела меньше 85 кг максимальная суточная доза составляет 50 мг в два приема, для пациентов с массой тела более 85 кг — 100 мг в два приема.

Побочные реакции. Препарат, как правило, хорошо переносится. Редко могут наблюдаться: *со стороны сердечно-сосудистой системы:* брадикардия,ортостатическая гипотензия, стенокардия, атриовентрикулярная блокада, прогрессирование недостаточности кровообращения (похолодание конечностей), прогрессирование сердечной недостаточности, отеки нижних конечностей. *Со стороны центральной и периферической нервной системы:* головная боль, головокружение, слабость, мышечная слабость (как правило, в начале лечения), депрессия, расстройства сна, парестезии. *Со стороны пищеварительной системы:* сухость во рту, тошнота, боли в животе, диарея или запор, повышение уровня печеночных трансаминаз. *Со стороны обмена веществ:* гипергликемия, увеличение массы тела, гиперхолестеринемия. *Со стороны системы кроветворения:* тромбоцитопения, лейкопения. *Со стороны дыхательной системы:* одышка, бронхоспастические реакции у предрасположенных больных. *Аллергические реакции:* экзантема, зуд, кожные высыпания, появление и/или обострение псориаза, чихание, заложенность носа; очень редко — анафилактоидная реакция.

Прочие: очень редко — обострение синдрома «перемежающейся» хромоты, синдрома Рейно, боли в конечностях, нарушение мочеиспускания и/или функции почек, гриппоподобный синдром, уменьшение слезовыделения, проявление латентно текущего сахарного диабета или усиление его симптоматики.

Передозировка. *Симптомы:* резкая артериальная гипотензия (систолическое давление 80 мм рт.ст. и ниже), брадикардия (менее 50 уд/мин), кардиогенный шок, нарушение дыхательной функции (бронхоспазм), недостаточность кровообращения, судороги, остановка сердца. *Лечение:* в течение первых часов — индукция рвоты и промывание желудка, далее — контроль и коррекция жизненно важных показателей в отделении интенсивной терапии. Поддерживающая терапия: при выраженной брадикардии — атропин 0,5–2 мг внутривенно; для поддержания сердечной деятельности — глюкагон 1–5 мг (максимальная доза — 10 мг) внутривенно струйно, затем 2–5 мг/час в виде инфузий и/или адреномиметики (орципреналин, изопреналин) 0,5–1 мг внутривенно. При преобладании периферического сосудорасширяющего действия назначают норадреналин в повторных дозах по 5–10 мкг или в виде инфузии 5 мкг/мин. Для купирования бронхоспазма применяют бета$_2$-адреномиметики в виде аэрозоля, при неэффективности — внутривенно или аминофиллин внутривенно. При судорогах — диазепам или клоназепам внутривенно медленно. В тяжелых случаях интоксикации при кардиогенном шоке поддерживающую терапию продолжают достаточно долго, пока не стабилизируется состояние больного и с учетом периода полувыведения карведилола.

Применение в период беременности или кормления грудью. Препарат противопоказан при беременности. При необходимости применения в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Дети. Препарат противопоказан детям в возрасте до 18 лет.

Особенности применения. С осторожностью и под контролем врача (особенно в начале лечения и при каждом повышении дозы) препарат следует применять у лиц пожилого возраста, при сахарном диабете (маскирует клинические проявления гипергликемии) и гипогликемии, тиреотоксикозе, окклюзионных заболеваниях периферических сосудов, атриовентрикулярной блокаде I степени, хронической обструктивной болезни легких, вазоспастической стенокардии Принцметала (может провоцировать приступы), псориазе, нарушениях функций почек, депрессии, миастении, у больных феохромоцитомой (только в сочетании с альфа-адреноблокаторами), при обширных хирургических вмешательствах и общей анестезии, а также на фоне лечения альфа-адреноблокаторами, альфа-адреномиметиками, препаратами наперстянки, диуретиками и/или ингибиторами моноаминоксидазы. В этих случаях лечение следует начинать низкими дозами с последующим медленным повышением до эффективных. В начале лечения или при повышении дозы препарата у пациентов, особенно у пожилых, может отмечаться избыточное снижение артериального давления, особенно при вставании, что требует коррекции дозы.

Пациентам с сердечной недостаточностью рекомендуется принимать препарат во время еды с целью предотвращения ортостатической гипотензии. При появлении у этих пациентов отеков и/или нарастании симптомов сердечной недостаточности следует повысить дозу диуретиков и, при необходимости, уменьшить дозу карведилола вплоть до стабилизации состояния больного. В случае снижения частоты сердечных сокращений до 55 уд/мин препарат следует отменить.

При назначении пациентам с недостаточностью кровообращения, низким артериальным давлением (систолическое артериальное давление менее 100 мм рт. ст.), ишемической болезнью сердца и/или почечной недостаточностью необходимо контролировать функцию почек, при ее ухудшении — уменьшить дозу или отменить препарат и увеличить дозу диуретиков.

Пациентам с хроническими обструктивными заболеваниями легких с бронхоспастическим компонентом, не получающим противоастматические препараты, карведилол следует назначать только в том случае, если польза его применения превышает потенциальный риск. У лиц с тяжелой аллергией или проходящих курс десенсибилизации карведилол может усилить аллергические реакции. Больным, у которых ранее на фоне лечения бета-блокаторами возникал или обострялся псориаз, препарат можно назначать только после тщательной оценки возможной пользы и риска. Как и другие бета-блокаторы, карведилол может уменьшать выраженность тиреотоксикоза. В случае проведения хирургического вмешательства с использованием общей анестезии анестезиолога следует предупредить о предшествующей терапии карведилолом. Пациентам с феохромоцитомой до начала терапии следует назначить альфа-адреноблокаторы. Лица, пользующиеся контактными линзами, должны быть предупреждены о возможности уменьшения слезоотделения. В период лечения следует избегать употребления этанола.

При необходимости одновременного назначения блокаторов «медленных» кальциевых каналов — производных фенилалкиламина (верапамил) и бензотиазепина (дилтиазем), а также антиаритмических средств I класса (амиодарон) рекомендуется постоянное мониторирование ЭКГ и артериального давления.

При отмене одновременной терапии с клонидином следует сначала прекратить лечение карведилолом, затем, через несколько дней, отменить клонидин. Карведилол не влияет на концентрацию глюкозы в крови и не вызывает изменений показателей теста толерантности к глюкозе у больных инсулиннезависимым сахарным диабетом.

Терапия должна проводиться длительно и не должна быть резко прекращена, особенно у

больных ишемической болезнью сердца из-за возможности ухудшения течения основного заболевания. Рекомендуется в течение 1–2 недель снижать дозу наполовину каждые 3 дня. При прерывании лечения на 2 недели и более возобновлять лечение следует с минимальных доз.

Карведилол нельзя принимать вместе с алкоголем.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами. В период лечения следует воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Карведилол нельзя применять, если пациент получает внутривенные введения верапамила, дилтиазема, антиаритмических средств (особенно 1 класса).Потенцирование эффекта наблюдается при одновременном приеме с антигипертензивными средствами, нитратами и антиаритмическими препаратами. Препараты, снижающие содержание катехоламинов (резерпин, ингибиторы моноаминоксидазы), и клонидин повышают риск развития артериальной гипотензии и брадикардии. Ингибиторы микросомального окисления (циметидин) усиливают, а индукторы (фенобарбитал, рифампицин) — ослабляют эффекты карведилола. Одновременное применение с алкалоидами спорыньи ухудшает периферическое кровообращение. При применении с сердечными гликозидами (дигоксином), верапамилом и дилтиаземом возможно нарушение атриовентрикулярной проводимости, редко с гемодинамическими нарушениями. Карведилол повышает содержание дигоксина и циклоспорина в крови, что требует коррекции их доз. Общие анестетики усиливают отрицательный инотропный и гипотензивный эффекты карведилола. Карведилол может потенцировать действие инсулина и пероральных гипогликемических средств, маскируя симптомы гипогликемии (особенно тахикардию), что требует регулярного контроля уровня глюкозы в крови.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика. Антигипертензивное, сосудорасширяющее, антиангинальное средство. Неселективный альфа$_1$-, бета$_1$- и бета$_2$-адреноблокатор, без внутренней симпатомиметической активности. Сосудорасширяющее действие обусловлено, главным образом, блокадой альфа$_1$-адренорецепторов. Блокируя бета-адренорецепторы, снижает активность ренин-ангиотензин-альдостероновой системы, активность ренина плазмы при этом снижается без задержки выведения жидкости. Снижает артериальное давление, общее периферическое сопротивление сосудов, пред- и постнагрузку на сердце, умеренно уменьшает частоту сердечных сокращений, не влияя на почечный кровоток и функцию почек. Сочетание сосудорасширяющего действия и бета-адреноблокирующих свойств способствует тому, что у больных артериальной гипертензией снижение артериального давления не сопровождается одновременным повышением периферического сопротивления сосудов, как при приеме других бета-адреноблокаторов. Обладает мембраностабилизирующими свойствами.

Является мощным антиоксидантом, устраняющим свободные радикалы кислорода. Не влияет на липидный обмен, в частности на соотношение липопротеидов высокой/низкой плотности, и на содержание в крови ионов калия, натрия и магния.

Антигипертензивный эффект развивается через 2–3 ч после однократного приема и сохраняется в течение 24 ч. При продолжительном лечении максимальный эффект

развивается через 3–4 недели. У больных ишемической болезнью сердца оказывает противоишемическое и антиангинальное действие. У больных с нарушениями функции левого желудочка и/или недостаточностью кровообращения благоприятно влияет на гемодинамические показатели, повышая фракцию выброса левого желудочка и уменьшая его размеры, снижает конечный систолический и конечный диастолический объемы, а также периферическое и легочное сопротивление, увеличивает толерантность к физической нагрузке. Фракция выброса и сердечный индекс при нормальной функции сердца не изменяются. Действие карведилола более выражено у пациентов с тахикардией (частота сердечных сокращений более 82 уд/мин) и низкой фракцией выброса (менее 23%).

*Фармакокинетика.*Быстро и почти полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта. Максимальная концентрация в крови достигается примерно через 1 ч. Биодоступность составляет 25% за счет эффекта «первого прохождения через печень» (60–75%). Прием пищи не влияет на биодоступность и уровень максимальной концентрации, но удлиняет время ее достижения. Связывается с белками плазмы на 98–99%. Интенсивно метаболизируется преимущественно в печени за счет соединения с глюкуроновой кислотой. В результате деметилирования и гидроксилирования образуются три метаболита с выраженным бета-блокирующим и антиоксидантным действием. Объем распределения составляет около 2 л/кг и увеличивается при нарушении функции печени. Проходит через плацентарный барьер, выделяется в грудное молоко. Период полувыведения карведилола — 6–10 ч, плазменный клиренс — около 590 мл/мин. Экскретируется, в основном, с желчью, небольшая часть дозы выводится в виде метаболитов почками.

При нарушении функции печени объем распределения увеличивается на 80%. При циррозе печени биодоступность повышается в 4 раза, а максимальная концентрация в плазме крови — в 5 раз. У пожилых больных концентрация карведилола в плазме крови на 50% выше, чем у молодых. Нарушение функции почек не сопровождается кумуляцией карведилола. Практически не выводится при гемодиализе.

Фармацевтические характеристики.

Основные физико-химические свойства: таблетки круглой формы с двояковыпуклой поверхностью с риской, белого или почти белого цвета.

Срок годности. 2 года.

Условия хранения. Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. *Хранить в недоступном для детей месте!*

Упаковка. По 10 таблеток в блистере; по 3 блистера в пачке.

Категория отпуска. По рецепту.

12,5 мг
Carvedilol
Карведилол-КВ
α- і β- адреноблокатор
30 таблеток по 12,5 мг