

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО СРЕДСТВА

1. Название лекарства

КАРВИДИЛ®

Международное непатентованное название: карведилол
(Carvedilolum)

2. Количественный и качественный состав

1 таблетка содержит 6,25; 12,5 или 25 мг карведилола.

Вспомогательное вещество: лактозы моногидрат.

Полный список вспомогательных веществ см. ниже в разделе 6.1.

3. Лекарственная форма

Таблетки.

Таблетки 6,25 мг

Круглые двояковыпуклые таблетки желтоватого цвета с темно-желтыми вкраплениями и риской на одной стороне.

Таблетки 12,5 мг

Круглые двояковыпуклые таблетки розового цвета с темно-розовыми вкраплениями и риской на одной стороне.

Таблетки 25 мг

Круглые двояковыпуклые таблетки белого цвета с риской на одной стороне.

4. Терапевтические показатели

4.1. Показания

Артериальная гипертензия, стенокардия, хроническая сердечная недостаточность (в составе комплексной терапии).

4.2. Способы применения и дозы

Внутрь, запивая достаточным количеством жидкости.

При артериальной гипертензии – 12,5 мг 1 раз в день в первые 2 дня, затем по 25 мг 1 раз в день, с возможным постепенным увеличением дозы с интервалом не менее 2 недель.

При стенокардии – 12,5 мг 2 раза в день в первые 2 дня, затем по 25 мг 2 раза в день (максимально – до 100 мг, разделенные на 2 приема).

При хронической сердечной недостаточности (на фоне подобранной терапии препаратами наперстянки, диуретиками и ингибиторами ангиотензин-превращающего фермента) лечение начинают с 3,125 мг 2 раза в день в течение 2 недель, затем (при хорошей переносимости) эту дозу увеличивают до 6,25 мг 2 раза в день, затем – до 12,5–25 мг 2 раза в день (при массе тела менее 85 кг – максимальная доза составляет 25 мг 2 раза в день, при массе тела более 85 кг – 50 мг 2 раза в день). Если лечение прерывается более, чем на 2 недели, то его возобновление начинают с дозы 3,125 мг 2 раза в день, с последующим увеличением дозы.

4.3. Противопоказания

Повышенная чувствительность к препарату. Острая и декомпенсированная хроническая сердечная недостаточность, требующая внутривенного введения инотропных средств. АВ блокада II, III степени, печеночная недостаточность, выраженная брадикардия, синдром слабости синусного узла, кардиогенный шок, бронхиальная астма, артериальная гипотензия (систолическое артериальное давление меньше 85 мм рт.ст.), беременность, период лактации, возраст до 18 лет (безопасность и эффективность применения не установлены).

С осторожностью – бронхоспастический синдром, хронический бронхит, эмфизема легких, стенокардия Принд-

метала, сахарный диабет, гипогликемия, гипертиреоз, заболевания периферических сосудов, феохромоцитома, депрессия, миастения, аспергилл, почечная недостаточность.

4.4. Предупреждения

Препарат следует с осторожностью назначать пациентам, работа которых требует быстрой психомоторной реакции (во время работы с машинами и механизмами, при управлении транспортными средствами), больным, использующим контактные линзы (уменьшение слезоотделения). Отмена должна осуществляться постепенно (во избежание развития синдрома «отмены»), в течение нескольких дней (особенно у больных ишемической болезнью сердца). При хранении на свету возможно изменение цвета таблеток. Может маскировать симптомы тиреотоксикоза, гипогликемии. Клинический опыт применения карведилола в педиатрической практике отсутствует. В случае необходимости проведения хирургического вмешательства с использованием анестезии необходимо предупредить анестезиолога о предшествующей терапии карведилолом. При прогрессировании сердечной недостаточности на фоне лечения рекомендуется увеличить дозу диуретиков, при почечной недостаточности дозу регулируют в зависимости от функционального состояния почек. В период лечения исключается употребление алкоголя.

4.5. Взаимодействия

Усиливает действие инсулина и производных сульфонилмочевины (одновременно маскируя или ослабляя выраженность симптомов гипогликемии, снижая расщепление гликогена печени до глюкозы), гипотензивных препаратов (ингибиторов АПФ, тиазидных диуретиков, вазодилаторов). С осторожностью используют совместно с антиаритмическими средствами и блокаторами медленных кальциевых каналов (верапамил, дилтиазем), не назначая их внутривенно. Увеличивает содержание дигоксина в сыворотке крови. Системные анестетики усиливают отрицательный инотропный и гипотензивный эффект. Фенобарбитал, рифампицин ускоряют метаболизм и снижают концентрацию карведилола в плазме. Ингибиторы микросомального окисления (циметидин) усиливают эффект. Диуретики и ингибиторы АПФ усиливают гипотензивный эффект.

4.6. Применение во время беременности и кормления грудью

Применение в период беременности допускается только в том случае, если ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Испытания на животных показали, что карведилол или его метаболиты проникают через плацентарный барьер и выделяются с грудным молоком. Неизвестно, выделяется ли карведилол с материнским молоком. При необходимости применения Карвидила в период вскармливания грудью ввиду возможного риска брадикардии у новорожденного следует либо прекратить кормление ребенка грудью, либо отменить лечение препаратом, в зависимости от необходимости применения Карвидила у матери.

4.7. Способность влиять на реакции при действиях, требующих внимания

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

4.8. Побочные действия

Со стороны центральной 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, АВ блокада,

редко – «перемежающаяся» хромота, окклюзионные нарушения периферического кровообращения, прогрессирование сердечной недостаточности.

Со стороны пищеварительной системы: сухость во рту, тошнота, абдоминальные боли, диарея или запор, рвота, повышение активности «печеночных» трансаминаз.

Со стороны органов кроветворения: тромбоцитопения, лейкопения.

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

Аллергические реакции: кожные аллергические реакции (экзантема, крапивница, зуд, высыпания), обострение псориатических высыпаний, чиханье, заложенность носа, бронхоспазм, одышка (у предрасположенных пациентов).

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

4.9. Мероприятия, предпринимаемые при передозировке

Симптомы: выраженное снижение артериального давления (систолическое АД – 80 мм рт.ст. и ниже), брадикардия (менее 50 уд/мин), нарушение дыхательной функции (в т.ч. бронхоспазм), сердечная недостаточность, кардиогенный шок, остановка сердца.

Лечение: пациент должен находиться в лежачем положении. При необходимости нужно проводить интенсивную терапию под наблюдением врача. Сразу после передозировки можно вызвать рвоту или промыть желудок.

- *Выраженная брадикардия:* 2 мг атропина в/в.

- *Поддержание сердечно-сосудистой функции:* в течение 30 сек ввести в/в 5-10 мг глюкагона, продолжать его введение непрерывной инфузией 5 мг/час; назначение симпатомиметиков (добутамин, изопреналин, адреналин).

- *Бронхоспазм:* введение бета-симпатомиметиков (внутривенно или ингаляции аэрозоля) или аминофиллина (внутривенно). В случае конвульсий рекомендуется медленно ввести внутривенно диазепам или клоназепам.

При тяжелых случаях передозировки (с симптомами шока) лечение следует проводить достаточно долго, учитывая, что период полувыведения карведилола 7-10 часов.

5. Фармакологические свойства

5.1. Фармакодинамика

Блокатор альфа- и бета-адренорецепторов. Код АТХ: C07AG02

Блокирует альфа1-, бета1- и бета2-адренорецепторы, оказывает вазодилатирующее, антиангинальное и антиаритмическое действие. Вазодилатирующий эффект связан, главным образом, с блокадой альфа1-рецепторов. Благодаря вазодилатации снижает общее периферическое сопротивление сосудов. Не имеет собственной симпатомиметической активности, обладает мембраностабилизирующими свойствами. Сочетание вазодилатации и блокады бета-адренорецепторов приводит к следующим эффектам: у больных с артериальной гипертензией снижение артериального давления не сопровождается увеличением общего периферического сопротивления сосудов, не снижается периферический кровоток (в отличие от бета-адреноблокаторов). Частота сердечных сокращений снижается незначительно. У больных ишемической болезнью сердца оказывает антиангинальное действие. Уменьшает пред- и постнагрузку на сердце. Не оказывает выраженного влияния на липидный обмен и содержание K^+ , Na^+ и Mg^{2+} в плазме. 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. Снижает риск смерти больных с декомпенсированной сердечной недостаточностью (на 65 %) и частоту госпитализаций (на 38 %). При умеренной хронической сердечной недостаточности снижает риск смерти на 28 %. Эффективность более выражена у пациентов с тахикардией (частота сердечных сокращений более 82 уд/мин) и низкой фракцией выброса

(менее 23 %). Терапевтический эффект проявляется при ишемической этиологии хронической сердечной недостаточности и у больных с дилатационной кардиомиопатией.

5.2. Фармакокинетика

После приема внутрь быстро и почти полностью всасывается в желудочно-кишечном тракте. Т_{Смакс.} в плазме – 1 ч. Биодоступность – 25 %. Связь с белками плазмы – 98-99 %. Объем распределения – около 2 л/кг. Метаболизируется в печени (имеет эффект «первого» прохождения через печень). Метаболиты обладают выраженным антиоксидантным и адреноблокирующим действием. T_{1/2} – 6-10 ч. Плазменный клиренс – 590 мл/мин. Выводится, в основном, с желчью. У больных с нарушением функции печени биодоступность может возрасти до 80 %. Проникает через плацентарный барьер, выделяется с грудным молоком.

5.3. Данные по предклинической безопасности

В исследованиях на животных (мыши, крысы) препарат не обладает карциногенной и мутагенной активностью, однако обладает тератогенной активностью. В дозе, превышающей 200 мг/кг/день, препарат обладает токсическим действием на взрослых крыс (угнетение, потеря в весе).

6. Фармацевтические свойства

6.1. Вспомогательные вещества

Лактозы моногидрат, целлюлоза микрокристаллическая, кросповидон, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат, железа оксид желтый (Е 172) (таблетки по 6,25 мг и 12,5 мг), железа оксид красный (Е 172) (таблетки по 12,5 мг).

6.2. Несовместимость

Не применима.

6.3. Срок годности

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

6.4. Условия хранения

Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

6.5. Параметры упаковки

По 14 таблеток в блистере из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой.

По 2 блистера вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

6.6. Особые инструкции по применению и предупреждения

См. раздел «Предупреждения».

7. Производитель

АО «Гриндекс». Ул. Крустпилс, 53, Рига, LV-1057, Латвия

8. Владелец регистрационного удостоверения

АО «Гриндекс». Ул. Крустпилс, 53, Рига, LV-1057, Латвия

Телефон: +371 67083205

Факс: +371 67083505

Эл. почта: grindeks@grindeks.lv

9. Дата последнего пересмотра документации

Июнь 2010 г.