

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
КАРВЕДІГАМА®
(Carvedigamma®)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: carvedilol; (+-)-1-(карбазол-4-ілоксі)-3-((2-(*o*-метоксифенокси)етил)аміно)-2-пропанол;

основні фізико-хімічні властивості:

таблетки по 6, 25 мг: білі, овальної форми, вкриті плівковою оболонкою, з тисненням „6.25” на одному боці;

таблетки по 12,5 мг: білі, овальної форми, вкриті плівковою оболонкою, з рискою з обох сторін, з тисненням „12.5” на одному боці;

таблетки по 25 мг: білі, овальної форми, вкриті плівковою оболонкою, з рискою з обох сторін, з тисненням „25” на одному боці;

склад: 1 таблетка містить: карведилолу –6,25 мг, 12,5 мг, 25 мг;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, лактози моногідрат, кросповідон, повідон, кремнію діоксид колоїдний, магнію стеарат, опадри ІІ білий YS-22-18096.

Форма випуску. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Блокатори альфа- та бета - рецепторів.

Код АТС C07A G02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Карведилол – комбінований неселективний β -блокатор, без ВСА (внутрішня симпатоміметична активність); селективний блокатор α_1 -адренорецепторів.

Карведилол являє собою рацемат двох стереоізомерів. Неселективна β_1 - і β_2 – адренорецепторна блокада характерна в основному S (-) енантіомеру.

Карведилол має антиоксидантні та кардіопротекторні властивості.

Частота серцевих скорочень помірно знижується. Ударний об’єм залишається незмінним.

Нирковий кровоток та функція печінки остаються незмінними.

При тривалому лікуванні хворих на стенокардію відзначався протиішемічний ефект.

Карведилол знижує перед- та пост- шлуночкові навантаження. Карведилол зменшує гіпертрофію лівого шлуночка.

Карведилол не має негативного впливу на профіль сироваточних ліпідів або електролітів. Співвідношення ліпопротеїнів високої щільності та ліпопротеїнів низької щільності залишається нормальним.

Фармакокінетика. Після перорального прийому карведилол швидко всмоктується. Максимальна концентрація у плазмі досягається через 1-2 години і має лінійну залежність. Абсолютна біодоступність препарату 25 %.

Приблизно 98-99 % карведилолу зв’язується з білками плазми.

Середній період напіввиведення карведилолу 6-10 годин. Плазмовий кліренс 590 мл/хвилину.

Менша частина виводиться нирками у вигляді метаболітів. Метабілізується карведилол в основному в печінці. Деметилування і гідроксилювання на фенольному кільці дає метаболіти, що мають адреноблокуючу дію. Один з них - 4’-гідроксифенілкарведилол проявляє β - адреноблокуючу активність у 13 разів більшу, ніж карведилол. Виводиться переважно з жовчю і фекаліями у виді метаболітів.

Показання для застосування.

- Артеріальна гіпертензія;

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

- ішемічна хвороба серця (стенокардія);
- хронічна серцева недостатність.

Спосіб застосування та дози.

При артеріальній гіпертензії максимальна одноразова доза не повинна перевищувати 25 мг Карведігами[®], рекомендована максимальна добова доза – 50 мг.

Дорослі. Рекомендована початкова доза – 12,5 мг за один прийом тричі на день протягом перших двох днів. Потім лікування продовжують при дозі 25 мг/день. За необхідності дозу можливо збільшувати з інтервалом не менше ніж два тижні.

Люди літнього віку. Рекомендована початкова доза – 12,5 мг один раз на день, якої дотримуються далі. Якщо терапевтична реакція неадекватна, дозування можна поступово збільшувати з інтервалами в два тижні.

Ішемічна хвороба серця (стенокардія).

Дорослі. Рекомендована початкова доза – 12,5 мг два рази на день, протягом двох днів. Потім лікування продовжується з призначенням 25 мг два рази на день. За необхідності дозування поступово збільшують з інтервалом у два тижні. Рекомендована максимальна добова доза – 100 мг.

Люди літнього віку. Рекомендована початкова доза – 12,5 мг два рази на день, протягом двох днів. Потім лікування продовжується з дозуванням 25 мг два рази на день, що і є максимальною добовою дозою.

Серцева недостатність.

При серцевій недостатності доза підбирається індивідуально. Початкова доза становить 6,25 мг один раз на день протягом двох тижнів. При добрій переносимості, дозу збільшують з інтервалом у 2 тижні – спочатку до 6,25 мг два рази на день, потім до

12,5 мг/день, і тільки згодом до 25 мг двічі на день. Дозу рекомендується збільшувати до найвищого рівня переносимості пацієнтом.

Максимальна рекомендована доза – 25 мг двічі на день, для хворих, маса тіла котрих менше 85 кг і 50 мг Карведігами[®] двічі на день при масі тіла більше 85 кг, якщо серцева недостатність не є тяжкою. Збільшення дози до 50 мг повинно проводитися обережно при постійному обстеженні лікарем.

На початку або при збільшенні дози може бути тимчасове погіршення симптомів серцевої недостатності, особливо у хворих з тяжкою серцевою недостатністю і/або при лікуванні високими дозами діуретиків. Не треба припиняти лікування Карведігамою[®] та збільшувати дозу.

Якщо лікування Карведігамою[®] припиняється більш ніж на два тижні, наступний прийом слід починати з дози 6,25 мг один раз на день і поступово збільшувати згідно з рекомендаціями.

За необхідності припинити лікування препарат відмінюють поступово, протягом 2 тижнів.

При печінковій недостатності, помірній дисфункції печінки дозування потрібно підбирати індивідуально для кожного хворого.

Прийом Карведігами[®] не залежить від прийому їжі, але хворим з серцевою недостатністю рекомендується приймати препарат під час їди, щоб уповільнити абсорбцію та знизити небезпеку ортостатичної гіпотензії.

Побічна дія.

Побічні реакції частіше виникають на початку лікування.

З боку ЦНС: запаморочення, непритомність, дискінезія, парестезія.

З боку органів зору: порушення зору, зниження слезовиділення, подразнення очей.

З боку ШКТ: нудота, діарея, блювання, запор, біль у животі.

З боку серцево-судинної системи: брадикардія, ортостатичні реакції, AV-блокада, напади стенокардії, погіршення серцевої недостатності.

З боку шкіри та підшкірної основи: рідко алергічна екзантема, шкірний свербіж, кропив'янка, реакції, які нагадують плоский лишай, поява псоріатичних бляшок або загострення псоріатичного процесу, якщо такий вже мається.

З боку порушення метаболізму та травлення: гіперглікемія (у хворих на цукровий діабет),

периферійний набряк, гіперволемія, затримка рідини, гіперхолестеринемія.

Інші: ортостатична гіпотензія, артеріальна гіпертензія, порушення периферійного кровотоку, тромбоцитопенія, лейкопенія, набряк ніг, погіршення функції нирок, утруднення сечовиведення, закладення носа, порушення сну, депресія, біль у кінцівках, набряк геніталій, підвищена активність трансамінази в сироватці крові.

У хворих зі схильністю до бронхіальної астми, спостерігалася астматична задишка, напади ядухи.

Рідко зустрічалися реакції у вигляді гострої печінкової недостатності і порушення печінкової функції у хворих з генералізованим атеросклерозом.

У хворих на цукровий діабет карведилол може викликати появу латентного цукрового діабету. При лікуванні карведилолом може виникнути помірне порушення глюкозного балансу, однак це є рідким явищем.

Протипоказання. Підвищена чутливість до карведилолу або інших компонентів препарату, серцева недостатність (IV класу класифікації по NYHA), хронічне обструктивне захворювання легень з бронхіальною обструкцією, клінічна дисфункція печінки, бронхіальна астма, артріовентрикулярна блокада II та III ступеня, тяжка брадикардія (< 50 ударів/хвилину), кардіогенний шок, синдром слабкості синусового вузла (включаючи синоартеріальні блокади), тяжка артеріальна гіпотензія (систолический тиск нижче 85 мм рт. ст.), метаболічний ацидоз, стенокардія Принцметала, тяжке порушення периферійного артеріального кровообігу, вагітність та лактація, одночасне внутрішньовенне лікування верапамілом, дилтіаземом.

Передозування.

Симптоми: передозування може викликати артеріальну гіпотензію, брадикардію, серцеву недостатність, кардіогенний шок і зупинку серця. Також можуть спостерігатися респіраторні проблеми, бронхоспазм, блювання, запаморочення, порушення свідомості і конвульсії.

Лікування. Якщо пацієнт не втратив свідомість, необхідно викликати блювання, потім покласти пацієнта на спину так, щоб голова була опущена, а ноги підняті. Пацієнта який втратив свідомість треба покласти на бік. Показана симптоматична терапія.

Застосовуються наступні методи лікування:

Атропін: 0,5 – 2 мг внутрішньовенно (для лікування тяжкої брадикардії);

Симпатоміметики, в залежності від їх ефективності та ваги хворого: добутамін, ізопреналін або адреналін.

Якщо домінуючим симптомом передозування є периферійна вазодилатація, пацієнту слід ввести норадреналін або мезатон. Необхідний постійний моніторинг кровообігу хворого. При лікуванні бронхоспазму треба симпатоміметики (в аерозольній формі або внутрішньовенно, якщо аерозоль не діє). Якщо у хворого конвульсії, можливе застосування діазепаму (повільна внутрішньовенна ін'єкція).

Карведилол не можна вивести за допомогою діалізу.

Зверніть увагу! У випадку серйозного передозування, коли хворий знаходиться в стані кардіогенного шоку, підтримуюче лікування повинно проводитися достатньо довго, оскільки виведення або перерозподіл карведилолу може проходити повільніше, ніж звичайно.

Особливості застосування.

Починати лікування потрібно тільки при стабільному перебігу захворювання. Хворі з некомпенсованими процесами потребують рекомпенсації. Хворі з тяжкою серцевою недостатністю, люди літнього віку або хворі з низьким тиском крові повинні знаходитися під наглядом близько 2 годин після першої дози та після підвищення дози, оскільки може посилитися гіпотензія. Артеріальна гіпотензія, яка викликана різким розширенням судин, лікується зниженням дози діуретиків. При необхідності дозу можна знизити або припинити прийом Карведігами®.

Оборотне погіршення функціонування нирок при лікуванні Карведігамою® відмічалось у хворих з серцевою недостатністю при низькому тиску крові, ішемічній хворобі серця і генералізованому атеросклерозі і/або нирковій недостатності. Цим хворим потрібен моніторинг функції нирок при

титруванні дози. При значному погіршенні ниркової функції дозу можна знизити або припинити прийом препарату.

Хворі з хронічними обструктивними легеневиими захворюваннями, які не приймають препарати перорально або у вигляді інгаляцій, не повинні приймати Карведігаму®. Застосування препарату можливе лише тоді, коли очікувана користь перевищує потенційний ризик.

Прийом Карведігами® може маскувати симптоми і ознаки тиреотоксикозу.

У хворих з синдромом Рейно може спостерігатися загострення симптомів.

У хворих зі слабким метаболізмом дебризоквіна потрібно проводити моніторинг на початку лікування. В зв'язку з недостатніми клінічними даними Карведігаму® не слід призначати хворим з нестійкою або вторинною гіпертензією, ортостазом, з гострим запальним захворюванням серця, гемодинамічною релевантною обструкцією серцевих клапанів або шляхів відтоку, термінальній стадії захворювання периферійних артерій, паралельним лікуванням α_1 -рецепторним антагоністом або α_2 -рецепторним антагоністом. Застосування Карведігами® не слід різко відмінити. Лікування Карведігамою® повинно відмінити поступово, протягом двох тижнів шляхом зниження дози.

Пацієнти з рідкісною спадковістю непереносимості галактози, дефіцитом лактази або з порушенням всмоктування глюкози та галактози не повинні приймати цей лікарський засіб.

Вагітність і лактація. Застосування Карведігами® в період вагітності та лактації не рекомендується. Застосування препарату можливе лише тоді, коли очікувана користь для матері перевищує потенційний ризик для плода або дитини.

Вплив на керування автотранспортними засобами або іншими складними механізмами.

Може виникнути зниження уваги, зокрема на початку та при підборі дозування препарату.

Педіатрія. Оскільки немає достатнього досвіду, препарат Карведігама® не слід застосовувати для лікування дітей.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

При одночасному прийомі блокаторів кальцієвого каналу (верапаміл, дилтіазем), необхідний моніторинг ЕКГ та тиску. Моніторинг потрібен також і при одночасному прийомі карведилолу та антиаритмічних препаратів I класу. У хворих, які приймають аміодарон, початок лікування β -блокаторами може викликати брадикардію, зупинку серця та шлуночкову фібриляцію. Загроза розвитку серцевої недостатності існує при одночасному прийманні протиаритмічних препаратів класу Ia або Ic.

Одночасне лікування резерпіном, гуанетидином, метилдопою, гуанфацином, інгібіторами моноаміноксидаз (виняток MAO-B-інгібітори) може викликати додаткове уповільнення серцевих скорочень. Рекомендується моніторинг важливих життєвих показників.

Одночасний прийом дигідропіринів та карведилолу може призвести до розвитку серцевої недостатності та тяжкої гіпотензії.

Нітрати можуть збільшити гіпотензивний ефект.

При одночасному прийманні карведилолу та серцевих глікозидів рекомендується моніторинг плазматичних концентрацій дигоксину.

Карведилол може посилювати дію інших гіпотензивних препаратів та препаратів, котрі мають гіпотензивний побічний ефект (барбітурати, фенотіазин, трициклічні антидепресанти, судинорозширювальні препарати).

При прийомі карведилолу не рекомендується приймати алкоголь.

Циклоспорин. Рекомендується контролювати концентрацією циклоспорину у плазмі.

Протидіабетичні засоби, включно інсулін. Ефект зниження рівня цукру може інтенсифікуватися. Симптоми гіпоглікемії можуть бути замасковані.

При припиненні комбінованого лікування карведилолом і клонідином, карведилол потрібно виводити декількома днями раніше, поступово зменшуючи дозу клонідину.

Інгаляційні анестетики. Потрібно звернути увагу на негативну інотропну і гіпотензивну взаємодію карведилолу і анестетиків при анестезії.

Нестероїдні протизапальні препарати, естрогени і кортикостероїди. Гіпотензивна дія карведилолу

зменшується через затримку води і натрію.

Препарати, які індукують або інгібують ензими цитохрому P₄₅₀. Пацієнти, які приймають ці препарати, потребують старанного моніторингу при одночасному лікуванні карведилолом, оскільки концентрація карведилолу в сироватці може знижуватися індукуючими та збільшуватися інгібіруючими ензимами препаратами.

Симптомиметики з альфа- і бета- міметичними ефектом. Небезпека розвитку артеріальної гіпертензії та брадикардії.

Ерготамін. Збільшується звуження судин.

При одночасному прийомі карведилолу і дигіталісу, збільшується час атріовентрикулярної провідності.

Умови та термін зберігання. При температурі 15°C – 25°C, в оригінальній упаковці, у недоступному для дітей місці.

Термін придатності – 2 роки. Не застосовувати препарат після закінчення терміну, зазначеному на упаковці.

Умови відпуску. За рецептом.

Форма випуску. По 10 таблеток у блістері, по 3 блістери в картонній коробці.

Виробник. Вьорваг Фарма ГмбХ і Ко. КГ.

Адреса. Кальверштрассе, 7, 71034 Бьоблінген, Німеччина.