

ИНСТРУКЦИЯ
по применению препарата
КАРВЕДИЛОЛ ГЕКСАЛ

Регистрационное удостоверение _____

Торговое название препарата: **КАРВЕДИЛОЛ ГЕКСАЛ**

Международное непатентованное название: Карведилол

Лекарственная форма: таблетки.

Состав:

Таблетки по 3,125 мг:

Активное вещество: карведилол 3,125 мг;

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

Таблетки по 6,25 мг:

Активное вещество: карведилол – 6,25мг;

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

Таблетки по 12,5 мг:

Активное вещество: карведилол – 12,5мг;

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

Таблетки по 25 мг:

Активное вещество: карведилол – 25мг;

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

Таблетки по 50 мг:

Активное вещество: карведилол – 50мг;

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

Описание

Таблетки по 3,125 мг:

Таблетки светло-розового цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской с двух сторон и на боках и нанесением «С1» на одной стороне.

Таблетки по 6,25 мг:

Таблетки желтого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской с двух сторон и на боках и нанесением «С2» на одной стороне.

Таблетки по 12,5 мг:

Таблетки розовато-бежевого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской с двух сторон и на боках и нанесением «С3» на одной стороне.

Таблетки по 25 мг:

Таблетки белые или практически белые, круглые, двояковыпуклые, с риской с двух сторон и на боках и нанесением «С4» на одной стороне.

Таблетки по 50 мг:

Таблетки белые или практически белые, круглые, двояковыпуклые, с риской с двух сторон и на боках и нанесением «С5» на одной стороне.

Фармакотерапевтическая группа: альфа- и бета-адреноблокатор.

Код АТХ: C07AG02

Фармакологические свойства*Фармакодинамика:*

Оказывает сочетанное неселективное бета-блокирующее, альфа 1-блокирующее и антиоксидантное действие. Вазодилатирующий эффект связан, главным образом, с блокадой альфа -1 рецепторов. Благодаря вазодилатации снижает общее периферическое сосудистое сопротивление. Не обладает внутренней симпатомиметической активностью и, подобно пропранололу, оказывает мембраностабилизирующее действие.

Мощный антиоксидант, устраняет свободные кислородные радикалы. Сочетание вазодилататоров и бета-адреноблокаторов оказывает следующее действие:

Совокупность сосудорасширяющего действия и бета-адреноблокирующих свойств карведилола приводит к тому, что у больных артериальной гипертензией снижение артериального давления не сопровождается одновременным увеличением общего периферического сопротивления, которое отмечается при приеме бета-адреноблокаторов. Незначительно уменьшается частота сердечных сокращений, 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 часа после однократного приема и продолжается в течение 24 часов. При продолжительном лечении максимальный эффект отмечается через 3-4 недели.

У больных ишемической болезнью сердца 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

Куроч
2

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 ангиотензин-превращающего фермента 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 (частота сердечных сокращений более 82 уд/мин) и низкой фракцией выброса (менее 23%).

Во время лечения карведилолом соотношение холестерина ЛПВП/ЛПНП не изменяется.

Фармакокинетика

Абсорбция карведилола быстрая и высокая. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 1 час после приема препарата. Концентрация в плазме пропорциональна принятой дозе. Величина биологической доступности составляет около 30 %. Одновременный прием пищи замедляет всасывание препарата, но не влияет на величину биологической доступности.

Связывание с белками плазмы составляет около 98 – 99%. Объем распределения – около 2 л/кг и увеличивается (на 80%) в случае нарушения функции печени (за счет уменьшения эффекта первого прохождения через печень).

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.

Период полувыведения карведилола составляет 6-10 часов, плазменный клиренс – около 590 мл/мин. Выводится в основном с желчью и небольшая часть – через почки.

Проникает через плацентарный барьер и выделяется с грудным молоком.

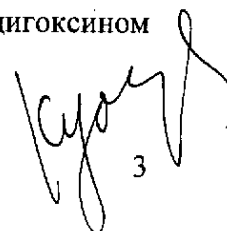
Карведилол практически не выводится при гемодиализе.

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

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

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 ангиотензин-превращающего фермента (АПФ).


3

Противопоказания

Повышенная чувствительность к препарату и другим компонентам препарата.

Хроническая сердечная недостаточность в стадии декомпенсации.

Синдром слабости синусового узла.

Атриовентрикулярная блокада II-III ст., за исключением больных с искусственным водителем ритма.

Выраженная брадикардия (частота сердечных сокращений менее 50 уд/мин).

Кардиогенный шок, коллапс.

Бронхиальная астма.

Тяжелые нарушения функции печени.

Метаболический ацидоз.

Беременность.

Период лактации.

Возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Совместное внутривенное введение верапамила, дилтиазема или других антиаритмических средств (особенно противоаритмических средств I класса).

С осторожностью и под контролем проводить лечение больных с сахарным диабетом, при гипогликемии, тиреотоксикозе, феохромоцитоме (только стабилизированная назначением альфа-адреноблокаторов), окклюзионных заболеваниях периферических сосудов, атриовентрикулярной 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; лиц пожилого возраста.

Способ применения и дозы

Карведилол Гексал принимают внутрь, запивая достаточным количеством жидкости.

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

Артериальная гипертензия:

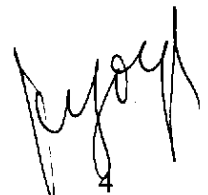
Начальная доза - 12,5 мг/сутки однократно (утром после завтрака) в течение первых 2-х дней, затем по 25 мг один раз в день. При необходимости через 14 дней доза может быть увеличена. Максимальная доза - 50 мг в день однократно или в 2 приема (утром и вечером).

У пожилых пациентов в ряде случаев доза 12,5 мг может быть эффективна.

Стенокардия:

Начальная доза - по 12,5 мг 2 раза в сутки в течение первых 2-х дней, затем по 25 мг два раза (утром и вечером) в день. В случае необходимости через 7-14 дней суточная доза может быть повышена до максимальной, составляющей 100 мг/день, разделенной на 2 приема.

У лиц пожилого возраста максимальная суточная доза составляет 50 мг, разделенных на 2 приема.



Хроническая сердечная недостаточность:

Дозу подбирают индивидуально, проводя тщательное мониторирование. Следует наблюдать за состоянием больного в течение первых 2-3 часов 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 Карведилол Гексала.

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

Рекомендуемая начальная доза 3,125 мг два раза в день в течение 14 дней. При хорошей переносимости препарата и необходимости увеличения дозировки препарат назначают в дозе 6,25 мг два раза в день, затем до 25 мг два раза в день. Больным назначают максимально переносимую дозу. Максимально рекомендуемая доза – по 25 мг два раза в день для больных с массой тела до 85 кг и по 50 мг дважды в день для больных с массой тела более 85 кг.

В начале лечения и до каждого увеличения дозы следует контролировать состояние больного, так как возможно ухудшение течения сердечной недостаточности.

Может развиваться 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 Карведилол Гексала. Иногда требуется временная приостановка лечения.

Побочное действие

В рекомендуемых дозах Карведилол Гексал 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 нервной системы:

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.

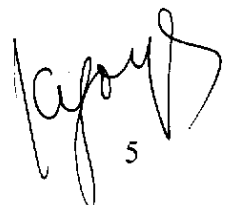
Аллергические реакции: крапивница, зуд, высыпания, появление и/или обострение псориаза, чихание, заложенность носа, бронхоспазм, одышка (у предрасположенных пациентов), очень редко – анафилактикоидная реакция.

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

Эндокринные нарушения: увеличение веса.

Прочие: редко – обострение синдрома «перемежающейся» хромоты, синдрома Рейно, боли в конечностях, нарушение мочеиспускания, гриппоподобная симптоматика.

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


5

Передозировка

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

Лечение: в течение первых двух часов вызвать рвоту и промыть желудок.

Передозировка требует интенсивного лечения. Больной должен находиться в положении с приподнятыми ногами, т.е. в положении Тренделенбурга. Антидотом бета-блокирующего действия является орципреналин или изопреналин 0,5-1 мг внутривенно и/или глюкагон в дозе 1-5 мг (максимальная доза 10 мг).

Тяжелая гипотензия лечится парентеральным введением жидкости и повторным введением адреналина в дозе 5-10 мг (или его внутривенная инфузия со скоростью 5 мкг/мин).

При чрезмерной брадикардии назначают внутривенно атропин в дозе 0,5-2 мг. Для поддержания сердечной деятельности: внутривенно быстро (в течение 30 сек) вводят глюкагон, после чего проводят постоянную 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-адреноблокаторы (в виде аэрозоля или внутривенно) или аминофиллин внутривенно.

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 полувыведения карведилола 6-10 часов.

В условиях реанимации проводить контроль за показателями жизненноважных органов.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

- Средства, истощающие запасы катехоламинов (резерпин, ингибиторы МАО) могут вызывать тяжелую брадикардию и артериальную гипотензию.

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

- 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.

- Ингибиторы изоэнзима CYP2D6 (хинидин, флуоксетин, пропafenон) из-за возможности повышения концентрации R (+) энантиомера карведилола.

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

- Повышает концентрацию дигоксина, что требует проведение контроля за его концентрацией, т.к. одновременное назначение с сердечными гликозидами может приводить в атриовентрикулярной блокаде.
- Общие анестетики усиливают отрицательный инотропный и гипотензивный эффект.
- 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

В случае снижения частоты сердечных сокращений до уровня 55 уд/мин прием препарата следует отменить.

У лиц, страдающих аллергией или проходящих курс десенсибилизации, прием карведилола может повысить аллергическую чувствительность.

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

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

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

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.

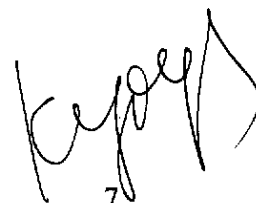
С осторожностью следует назначать пациентам, работа которых требует быстрой психомоторной реакции (управление транспортными средствами, работа с техникой).

Отмена препарата должна производиться постепенно (в течение 1-2 недель) во избежание развития синдрома «отмены», особенно у больных ишемической болезнью сердца.

Форма выпуска

По 10 таблеток в блистеры из ПВХ/алюминиевой фольги.

По 1, 2, 3, 4 или 5 блистеров вместе с инструкцией по применению в картонную пачку.



Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.

Хранить лекарственное средство в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не использовать позже даты, указанной на упаковке!

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель

ГЕКСАЛ АГ, произведено
Салутас Фарма ГмбХ, Германия,
83607 Хольцкирхен, Индустриштрассе 25

HEXAL AG, manufactured by
Salutas Pharma GmbH, Germany,
Holzkirchen, 83607, Industriestrasse 25.

**По вопросам качества препарата
обращаться по адресу:**

121170 Москва, ул. Кульнева, д. 3

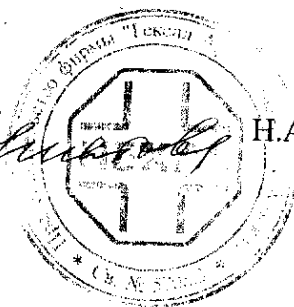
Тел.: (495) 787 – 85 – 88; Факс: (495) 787 – 85 – 92; e-mail: hexal@hexal.ru

И.о. Директора ИДКЭЛС



А.Н.Васильев

Начальник отдела регистрации



Н.А.Игнатова