

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування препарату

КАРВИДЕКС® (CARVIDEX)

Склад:

діюча речовина: карведилол;

1 таблетка, вкрита плівковою оболонкою, містить 6,25 мг, 12,5 мг або 25 мг карведилолу;

допоміжні речовини: лактоза, моногідрат; кросповідон; кремнію діоксид колоїдний безводний; повідон; магнію стеарат; полісорбати; барвник Opadry OY-58900 білий (гіпромелоза, титану діоксид (E 171), поліетиленгліколі).

Лікарська форма. Таблетки, вкриті плівковою оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Засоби, які впливають на серцево-судинну систему. Блокатори альфа- та бета-адренорецепторів. Код АТС C07A G02.

Клінічні характеристики.

Показання. Есенціальна гіпертензія; ішемічна хвороба серця (стабільна стенокардія); хронічна серцева недостатність (додаткове лікування).

Противоказання. Підвищена чутливість до карведилолу або до інших компонентів препарату, стенокардія Принцметала, легенева гіпертензія, легеневе серце, декомпенсована серцева недостатність, що потребує внутрішньовенної терапії інотропними засобами, виражені порушення функцій печінки, період вагітності та годування груддю, атріовентрикулярна блокада II і III ступеня (якщо не встановлений постійний водій ритму), виражена брадикардія (<50 ударів за хвилину), синдром слабкості синусового вузла (включаючи синоатріальну блокаду), виражена артеріальна гіпотензія (сistolічний тиск 85 мм рт. ст.), обструктивні захворювання дихальних шляхів, включаючи бронхоспазм та бронхіальну астму в анамнезі, метаболічний ацидоз, феохромоцитома (при відсутності адекватного контролю α -блокаторами), кардіогенний шок, непереносимість галактози, дефіцит лактази Лаппа, глюкозо-галактозна мальабсорбція, непереносимість фруктози, або цукрозо-ізомальтозна недостатність, дитячий вік.

Спосіб застосування та дози.

Таблетки приймають перорально, запиваючи достатньою кількістю рідини. Пацієнтам з серцевою недостатністю рекомендовано застосовувати карведилол під час їди з метою уповільнення абсорбції і зменшення ризику виникнення ортостатичної гіпотензії.

Есенціальна гіпертензія.

Карвидекс® можна застосовувати як у монотерапії, так і у комбінації з іншими антигіпертензивними препаратами, особливо тіазидними діуретиками. Препарат рекомендовано застосовувати 1 раз на добу, однак максимальна рекомендована разова доза становить 25 мг, а максимальна рекомендована добова доза – 50 мг.

Дорослі. Дозу індивідуально підбирає лікар. Рекомендована початкова доза у перші 2 дні становить 12,5 мг 1 раз на добу. Потім лікування продовжують у дозі 25 мг на добу. Надалі, за необхідності, доза може бути поступово збільшена з інтервалом у 2 тижні або більше.

Пацієнти літнього віку. Рекомендована початкова доза становить 12,5 мг 1 раз на добу і може бути достатньою для подальшого лікування. Однак, якщо терапевтичний ефект цієї дози недостатній, її можна поступово збільшувати з інтервалом у 2 тижні або більше.

Ішемічна хвороба серця (стабільна стенокардія).

Рекомендований режим застосування – двічі на добу.

Дорослі. Дозу індивідуально підбирає лікар. Рекомендована початкова доза у перші 2 дні становить 12,5 мг двічі на добу. Потім лікування продовжують у дозі 25 мг двічі на добу. Надалі, за необхідності, доза може бути поступово збільшена з інтервалом у 2 тижні або більше до рекомендованої максимальної дози 100 мг на добу, розділеної на два прийоми.

Пацієнти літнього віку. Дозу індивідуально підбирає лікар. Рекомендована початкова доза у перші 2 дні становить 12,5 мг двічі на добу. Потім лікування продовжують у дозі 25 мг двічі на добу, що є рекомендованою максимальною добовою дозою.

Хронічна серцева недостатність.

Карвидекс® застосовують при серцевій недостатності помірного та тяжкого ступеня як додаткову терапію до загальноприйнятої базової терапії діуретиками, інгібіторами АПФ, дигіталісом та/або судинорозширювальними засобами. Стан пацієнтів повинен бути клінічно стабільним (відсутність змін у NYHA-класі, відсутність випадків госпіталізації з приводу серцевої недостатності), а базова терапія повинна бути постійною протягом щонайменше останніх 4 тижнів перед початком лікування. Додатково пацієнти повинні мати зменшену фракцію викиду лівого шлуночка, частоту серцевих скорочень >50 ударів /хв та систолічний артеріальний тиск >85 мм рт. ст.

Дозу індивідуально підбирає лікар. Початкова доза протягом двох тижнів становить 3,125 мг (за необхідності застосовують препарат у відповідному дозуванні) двічі на добу. За умови толерантності дозу можна повільно збільшувати з інтервалом не меншим ніж 2 тижні до дози 6,25 мг двічі на добу, потім – до 12,5 мг двічі на добу і зрештою – до 25 мг двічі на добу. Дозу потрібно збільшувати до максимального рівня, який добре переноситься пацієнтом. Рекомендована максимальна доза становить 25 мг двічі на добу для пацієнтів з масою тіла до 85 кг та 50 мг двічі на добу для пацієнтів з масою тіла понад 85 кг за умови, що серцева недостатність не тяжкої форми. Збільшення дози до 50 мг двічі на добу потрібно проводити обережно, під ретельним медичним наглядом.

На початку лікування або при збільшенні дози, особливо у пацієнтів з тяжкою серцевою недостатністю та /або тих, які приймають діуретики у високих дозах, може виникнути тимчасове посилення симптомів серцевої недостатності. Це зазвичай не є причиною для відміни лікування, але дозу не потрібно збільшувати. Пацієнт повинен знаходитися під наглядом терапевта/кардіолога протягом 2 годин після початку лікування або збільшення дози. Перед кожним підвищенням дози необхідно оцінити можливі ознаки ускладнення перебігу серцевої недостатності або симптоми, що свідчать про надмірне розширення судин (наприклад перевірити функцію нирок, масу тіла, показники артеріального тиску, частоту серцевих скорочень та ритм). Ускладнення перебігу серцевої недостатності або затримка рідини лікується призначенням збільшеної дози діуретиків, а дозу карведилолу не потрібно збільшувати, поки стан пацієнта не стабілізується. Якщо виникла брадикардія або у випадку подовження атріовентрикулярної провідності, в першу чергу, необхідно контролювати рівень дигоксину. Іноді може виникнути необхідність зниження дози карведилолу або тимчасового припинення лікування. Часто навіть у таких випадках лікування може бути успішно продовжене завдяки титруванню дози карведилолу. Протягом титрування дози слід регулярно контролювати функцію нирок, рівень тромбоцитів та глюкози (у випадку інсулінонезалежного та /або інсулінозалежного цукрового діабету). Однак після завершення титрування дози частота досліджень може бути зменшена.

Якщо прийом карведилолу було припинено менше ніж 2 тижні тому, подальше лікування потрібно розпочинати з дози 3,125 мг (за необхідності застосовують препарат у відповідному дозуванні) двічі на добу і поступово збільшувати згідно з вищенаведеними рекомендаціями.

Порушення функції нирок.

Дозування встановлює лікар індивідуально для кожного пацієнта. Але згідно з фармакокінетичними показниками малоімовірно, що пацієнтам з порушенням функції нирок буде необхідна корекція дози.

Порушення функції печінки помірного ступеня.

Може виникнути необхідність у корекції дози.

Пацієнти літнього віку.

Пацієнти літнього віку можуть бути чутливіші до дії карведилолу і тому їм слід перебувати під наглядом лікаря.

У випадках, коли пацієнт приймає β -блокатори, а особливо за наявності ішемічної хвороби серця, відміну карведилолу необхідно проводити поступово, протягом 7-10 днів, наприклад, зменшуючи добову дозу вдвічі кожні три дні

Побічні реакції.

Побічні реакції у пацієнтів із серцевою недостатністю.

З боку ЦНС: головний біль, запаморочення, астенія (включаючи втомлюваність), синкопе.

З боку серцево-судинної системи: брадикардія, гіпотензія, постуральна гіпотензія, непритомність (включаючи переднепритомний стан), атріовентрикулярна блокада, серцева недостатність під час збільшення дози з метою підбору, периферичний набряк, підвищене серцевиття.

З боку шлунково-кишкового тракту: сухість у роті, нудота, блювання, діарея, мелена, запор, підвищення тону і моторики кишечника.

З боку обміну речовин: гіперглікемія, гіпоглікемія, погіршення підтримування рівня глюкози в крові у хворих з цукровим діабетом, збільшення маси тіла, гіперхолістеринемія, анорексія/зниження маси тіла.

З боку системи кровотворення: тромбоцитопенія, лейкопенія, анемія.

З боку системи сечовиділення: у пацієнтів з порушенням функцій нирок може розвиватись гостра ниркова недостатність, порушення сечовипускання (нетримання сечі, особливо у жінок).

З боку дихальної системи: посилення кашлю, хрипи.

З боку шкіри: дерматит.

З боку органів зору: порушення зору, сухість очей.

Загальні порушення: набряки (включаючи генералізовані та периферичні набряки, застійні набряки нижніх кінцівок, гіперволемію, затримку рідини в організмі), грипоподібний синдром, підвищення температури, анафілактичні реакції.

Інші: артралгія, збільшення вмісту азоту сечовини в крові, збільшення вмісту небілкового азоту, періодонтит, підвищення рівнів печінкових трансаміназ, лужної фосфатази, креатиніну, гамма-глутамілтрансферази, зниження вмісту протромбіну, гіперурикемія, гіпонатріємія, глюкозурія, гіперкаліємія, м'язові судоми, імпотенція, підвищене потовиділення, набряк статевих органів, втома, гіпестезія, можливі прояви латентного діабету, гостра атрофія м'язів, біль у кінцівках.

Побічні реакції у пацієнтів з гіпертензією або стенокардією.

З боку ЦНС: головний біль, запаморочення, втомлюваність, астенія, знепритомність, парестезії, синкопе.

З боку серцево-судинної системи: брадикардія, гіпотензія (зрідка з втратою свідомості), гіпотензія, порушення периферичного кровообігу (холодні кінцівки, патологія периферійних судин), загострення симптомів переміжної кульгавості та синдрому Рейно, порушення атріовентрикулярної провідності, стенокардія (включаючи біль за грудиною), симптоми серцевої недостатності.

З боку шлунково-кишкового тракту: сухість у роті, нудота, діарея, біль у животі, запор, блювання.

З боку системи кровотворення: тромбоцитопенія, лейкопенія, анемія.

З боку системи сечовиділення: порушення сечовипускання, погіршення функції нирок.

Психічні розлади: депресивні стани, порушення сну.

З боку дихальної системи: астма, задишка (в разі схильності до такої патології), закладеність носа, чхання, грипоподібні симптоми, бронхоспазм.

З боку шкіри: шкірні алергічні реакції (алергічна екзантема, дерматит, свербіж, кропив'янка), лишайоподібні реакції, посилене потовиділення, псоріатичні шкірні реакції, посилення існуючих уражень, гіперемія, шкірні висипання.

З боку органів зору: зменшення слъзовиділення, порушення зору, подразнення очей.

Загальні порушення: периферійні набряки, анафілактоїдні реакції.

Інші: біль в кінцівках, імпотенція, зміни активності трансаміназ в сироватці крові, алергічні реакції, підвищення рівня ліпідів у крові (гіперхолестеринемія), зниження рівня протромбіну, гіпоглікемія та погіршення контролю глюкози крові у хворих на цукровий діабет, глюкозурія, гіперкаліємія, гіпертригліцеридемія, гіпонатріємія, гіперурикемія, підвищення рівнів лужної фосфатази, креатиніну, сечовини, алопеція, анорексія, зменшення маси тіла, біль в суглобах, атрофія м'язів.

Оскільки препарат виявляє бета-блокуючі властивості, при його застосуванні можливий перехід прихованого цукрового діабету у явну форму та загострення цукрового діабету з погіршенням відповіді на препарати, що регулюють вміст глюкози в крові.

Побічні реакції за даними постмаркетингових досліджень.

З боку системи крові: апластична анемія.

З боку шкіри: синдром Стівенса–Джонсона, токсичний епідермальний некроліз, мультиформна еритема. Такі реакції спостерігались лише в тих випадках, коли карведилол застосовували одночасно з іншими препаратами, які можуть спричинювати зазначені реакції.

З боку системи сечовиділення: нетримання сечі у жінок.

З боку дихальної системи: інтерстиціальний пневмоніт.

Передозування.

Симптоми. Передозування може спричинити серйозну гіпотензію, брадикардію, серцеву недостатність, кардіогенний шок та зупинку серця. Також можуть виникнути проблеми з боку дихальних шляхів, бронхоспазм, блювання, пригніченість свідомості судом, посилення проявів інших побічних реакцій

Лікування. Додатково до звичайних лікувальних процедур необхідно проводити моніторинг основних показників життєдіяльності і, за необхідності, корегувати їх у відділенні інтенсивної терапії. Можна застосовувати такі підтримуючі засоби: атропін 0,5-2 мг внутрішньовенно (для лікування вираженої брадикардії); глюкагон– спочатку

1-10 мг внутрішньовенно, а потім, за необхідності, у вигляді повільної інфузії 2-5 мг/годину (для підтримки серцево-судинної функції).

Симпатоміметики (добутамін, ізопреналін або адреналін) застосовують відповідно до їх ефективності та маси тіла пацієнта. Якщо головним симптомом передозування є розширення периферичних судин, то необхідно призначити норадреналін або етилефрин. У таких пацієнтів необхідно постійно контролювати циркуляцію крові. У випадку виникнення брадикардії, що не реагує на фармакотерапію, необхідно запустити кардіостимулятор. Для лікування бронхоспазму необхідно призначити β -симпатоміметики або теофілін внутрішньовенно. При виникненні у пацієнта судом можна повільно внутрішньовенно ввести діазепам.

Карведилол активно зв'язується з білками, тому його не можна видалити за допомогою діалізу.

Важливо! У випадку важкого передозування, коли пацієнт знаходиться у шоківому стані, підтримуюча терапія повинна бути достатньо тривалою, оскільки, ймовірно, виведення та перерозподіл карведилолу буде відбуватися повільніше, ніж звичайно. Тривалість антидотного лікування залежить від тяжкості передозування; підтримуюче лікування необхідно проводити, поки стан пацієнта не стабілізується.

Застосування в період вагітності або годування груддю. Препарат протипоказаний у період вагітності та годування груддю. За необхідності застосування препарату годування груддю слід припинити.

Діти. Безпека та ефективність застосування карведилолу дітям (до 18 років) не досліджувались.

Особливості застосування. Терапія карведилолом повинна проводитись довготривало та не повинна різко припинятись. При різкому припиненні лікування карведилолом (так само, як і іншими бета-блокаторами) може виникати пітливість, тахікардія, задишка, посилення стенокардії і навіть інфаркт міокарда та шлуночкові аритмії. На найбільший ризик наражаються ті пацієнти зі стенокардією, у яких може виникнути серцевий напад. Дозу необхідно зменшувати поступово протягом 1-2 тижнів. Якщо необхідно, можна одночасно розпочати замісну терапію для запобігання загостренню захворювання. Якщо лікування було тимчасово припинено більш ніж на 2 тижні, то його поновлення слід проводити, починаючи з найнижчої дози.

У пацієнтів з хронічною серцевою недостатністю при збільшенні дози карведилолу з метою її підбору можливо наростання симптомів серцевої недостатності, поява набряків. При появі таких симптомів необхідно відкорегувати дозу сечогінного засобу, при цьому дозу карведилолу не слід збільшувати до стабілізації клінічного стану. Іноді може з'явитись необхідність знизити дозу карведилолу або тимчасово припинити його застосування.

Карведилол слід з обережністю призначати хворим на гіпертензію з хронічною серцевою недостатністю, які застосовують дигоксин, діуретики та/або інгібітори АПФ, оскільки дигоксин разом з карведилолом можуть уповільнювати атріовентрикулярне проведення.

З обережністю препарат призначають хворим на цукровий діабет, оскільки він може маскувати або зменшувати симптоми гіпоглікемії. У хворих з серцевою недостатністю і цукровим діабетом застосування карведилолу може супроводжуватись декомпенсацією вуглеводного обміну, в результаті чого хворий буде потребувати інтенсифікації гіпоглікемічної терапії. Рекомендовано на початку лікування при корекції дози і припиненні лікування карведилолом провести контроль рівня цукру в крові.

При призначенні карведилолу хворим з хронічною серцевою недостатністю та низьким артеріальним тиском (систоличний АТ < 100 мм рт. ст.), ішемічною хворобою серця та дифузними захворюваннями судин та/або нирковою недостатністю спостерігалось оборотне погіршення функції нирок. Зважаючи на це, при збільшенні дози карведилолу необхідно контролювати стан функції нирок. В разі погіршення функції нирок дозу карведилолу потрібно знизити або навіть тимчасово припинити його застосування. Бета-адреноблокатори можуть спричинювати або посилювати симптоми артеріальної недостатності у хворих з патологією периферичних судин. Хоча цей ефект препарату значною мірою врівноважується за рахунок його альфа-блокуючих властивостей, все ж карведилол слід з обережністю призначати таким хворим.

Карведилол, як і інші бета-адреноблокатори, може маскувати ознаки тиреотоксикозу. Різде припинення терапії карведилолом може супроводжуватись посиленням симптомів гіпертиреозу або прискорити настання тиреотоксичного кризу.

Карведилол може спричиняти брадикардію, тому при зменшенні частоти серцевих скорочень нижче 55 ударів на хвилину дозу карведилолу слід зменшити.

В разі гіпотензії, постуральної гіпотензії, знепритомності прийом карведилолу слід припинити. Ризик таких побічних реакцій є найвищим на початку лікування або при збільшенні дози з метою її підбору. Для того, щоб запобігти цим реакціям, лікування слід розпочинати з найменшої рекомендованої дози, а підвищення дози повинно бути поступовим.

При застосуванні карведилолу слід бути особливо уважними до пацієнтів, яким проводиться хірургічне втручання під загальною анестезією, в разі застосування таких анестетиків, як ефір, циклопропан, трихлоретилен, що пригнічують функцію міокарда.

Слід з обережністю призначати карведилол особам з тяжкими реакціями підвищеної чутливості в анамнезі або які проходять курс десенсибілізації, оскільки бета-адреноблокатори можуть підвищити чутливість до алергенів та ступінь тяжкості анафілактичних реакцій.

У хворих з порушеннями периферійного кровообігу, зокрема у хворих із синдромом Рейно, бета-адреноблокатори можуть посилювати симптоми артеріальної недостатності.

Препарати з неселективною β -блокуючою дією можуть спричиняти спазм коронарних судин та біль у грудяху пацієнтів із стенокардією Принцметала. Клінічного досвіду застосування карведилолу таким пацієнтам немає, хоча α -блокуюча дія препарату може запобігти виникненню зазначених симптомів.

Особам, які користуються контактними лінзами, слід повідомляти про можливе зменшення сльозовиділення.

Варто бути обережним при призначенні бета-блокаторів пацієнтам із псоріазом, тому що шкірні реакції можуть збільшуватися.

Пацієнти з поганим метаболізмом дебризохіну мають перебувати під пильним наглядом лікаря на початку лікування.

Слід з обережністю призначати карведилол хворим на лабільну і вторинну артеріальну гіпертензію, оскільки досвід його застосування цим категоріям пацієнтів недостатній.

Хворим на феохромоцитому до початку застосування будь-яких бета-блокаторів необхідно призначити альфа-адреноблокатор.

У зв'язку з негативною дромotropною дією карведилолу слід призначати з обережністю пацієнтам із AV-блокадою серця I ступеня.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами. Слід уникати керування автотранспортом і роботи з іншими механізмами, особливо на початку лікування та після прийому алкоголю.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Інгібітори CYP2D6. Взаємодію карведилолу з потужними інгібіторами CYP2D6 (хінідин, пропafenон, флуоксетин, пароксетин) не досліджували, однак зазначені препарати можуть підвищувати вміст в крові R(+) енантіомеру карведилолу, що може підвищувати ризик артеріальної гіпотензії.

Препарати, які знижують вміст катехоламінів. Препарати, які знижують вміст катехоламінів (резерпін, інгібітори моноамінооксидази), в разі одночасного застосування з бета-адреноблокаторами, збільшують ризик розвитку артеріальної гіпотензії та вираженої брадикардії.

Блокатори кальцієвих каналів. При призначенні карведилолу разом із блокаторами каналів кальцію (верапаміл або дилтіазем) або антиаритмічними препаратами I класу слід проводити моніторинг ЕКГ та артеріального тиску, зважаючи на окремі випадки порушення провідності, коли карведилол застосовувався разом з дилтіаземом. Хворим, які отримують карведилол, не слід одночасно призначати зазначені препарати внутрішньовенно.

Інсулін або пероральні гіпоглікемічні засоби. Препарати з бета-блокуючими властивостями можуть збільшувати цукрознижувальний ефект інсуліну або гіпоглікемічних препаратів, які приймають перорально.

Дигоксин. При одночасному прийомі карведилолу та дигоксину концентрація дигоксину збільшується. При одночасному застосуванні карведилолу та серцевих глікозидів може збільшуватися час атріовентрикулярної провідності. Тому на початку лікування карведилолом, при підборі його дози або відміні препарату рекомендується регулярний контроль концентрації дигоксину в плазмі крові.

Індуктори та інгібітори печінкового метаболізму. Індуктори та інгібітори мікросомальних печінкових оксидаз (рифампіцин та циметидин) змінюють фармакокінетику карведилолу. Індуктори мікросомальних печінкових оксидаз, наприклад рифампіцин, знижують концентрацію карведилолу в плазмі крові, а інгібітори цих ферментів (циметидин) збільшують концентрацію препарату в плазмі крові.

Клонідин. Одночасне призначення клонідину і карведилолу може потенціювати антигіпертензивний ефект карведилолу та спричинити брадикардію. При відміні одночасної терапії з клонідином слід спочатку припинити лікування карведилолом, потім через декілька днів поступово знижувати дозу клонідину.

Циклоспорин. Існує імовірність збільшення плазмової концентрації циклоспорину, якщо його приймають разом з карведилолом. Рекомендується проводити моніторинг концентрації циклоспорину після початку терапії карведилолом і, якщо необхідно, відповідним чином коригувати дозу циклоспорину.

Інші антигіпертензивні препарати. При одночасному застосуванні карведилол може підсилювати дію інших антигіпертензивних засобів (наприклад антагоністів альфа-рецепторів) та препаратів, які спричиняють побічні реакції антигіпертензивного характеру, таких як барбітурати, фенотіазини, трициклічні антидепресанти, вазодилататори і алкоголь.

Нітрати. Посилюють гіпотензивний ефект.

Інгаляційні анестетики. За необхідності інгаляційної анестезії потрібно пам'ятати про синергічний, негативний інотропний та гіпотензивний ефекти взаємодії карведилолу та деяких анестетиків.

НПЗП, естрогени та кортикостероїди. Антигіпертензивний ефект карведилолу послаблюється при супутньому застосуванні препаратів, які затримують воду і натрій в організмі.

Препарати, що стимулюють та інгібують цитохромні ензими P450. При супутньому застосуванні карведилолу та препаратів, що стимулюють ферменти системи цитохрому P450 (наприклад рифампіцин та барбітурати) або пригнічують їх (наприклад циметидин, кетоконазол, флуоксетин, галоперидол, верапаміл, еритроміцин), пацієнти повинні знаходитися під ретельним медичним наглядом, оскільки концентрація карведилолу в сироватці крові може знижуватися (при застосуванні стимуляторів) або підвищуватися (при застосуванні інгібіторів ферментів).

Дія симпатоміметиків, α -міметиків та β -міметиків. При одночасному застосуванні існує ризик розвитку гіпертензії та вираженої брадикардії.

Ерготамін. При одночасному застосуванні посилюється вазоконстрикція.

Міорелаксанти. При комбінації карведилолу з міорелаксантами посилюється нейром'язова блокада.

Фармакологічні властивості

Фармакодинаміка. Карведилол – неселективний блокатор β -адренорецепторів, що виявляє судинорозширювальну активність. Має антиоксидантні властивості. Вазодилатація опосередковується в основному через антагонізм із альфа-адренорецепторами. Карведилол являє собою рацемічну суміш двох стереоізомерів. Блокада бета-адренорецепторів притаманна енантіомеру S(-). Карведилол позбавлений власної симпатоміметичної активності.

Карведилол суттєво покращує функцію міокарда у хворих на хронічну серцеву недостатність, спричинену дисфункцією лівого шлуночка, зокрема зменшує постнавантаження без несприятливого впливу на кінцево-діастолічний об'єм лівого шлуночка. У хворих з есенціальною гіпертензією помірного ступеня в разі лікування карведилолом відзначається зменшення гіпертрофії лівого шлуночка.

Фармакокінетика. Після прийому внутрішньо швидко всмоктується. Абсолютна біодоступність карведилолу становить приблизно 25-35 % за рахунок метаболізму при первинному проходженні через печінку. Максимальна концентрація в плазмі крові досягається приблизно через 1 годину. Співвідношення між дозою та концентрацією в плазмі є лінійним. Одночасний прийом з їжею не впливає на біодоступність та максимальну концентрацію, хоча час досягнення максимальної концентрації зменшується.

Завдяки прийому препарату під час їжі зводиться до мінімуму ризик виникнення ортостатичної гіпотензії. Карведилол є високоліпофільною речовиною. Приблизно 98-99 % карведилолу зв'язується з білками плазми крові, переважно з альбуміном.

Карведилол метаболізується головним чином у печінці, в першу чергу шляхом утворення глюкуронідів. Деметилування і гідроксилювання фенольного кільця призводить до утворення трьох метаболітів з бета-блокуючою активністю. Середній період напіввиведення становить від 6 до 10 годин. Виводиться переважно з жовчю та калом у вигляді метаболітів. Незначна частина екскретується з сечею також у формі метаболітів.

Фармакокінетика карведилолу залежить від віку хворого. У осіб літнього віку рівень карведилолу в плазмі крові приблизно на 50 % вищий за такий у молодих осіб. У хворих з цирозом печінки біодоступність препарату в чотири рази більше, ніж у осіб із нормальною функцією печінки. Оскільки карведилол виводиться в основному з калом, накопичення препарату у хворих з порушенням функції нирок малоімовірно. У хворих з порушенням функції печінки біодоступність може підвищуватись на 80 % за рахунок зменшення пресистемної метаболізації при першому проходженні через печінку.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: білі круглі вкриті плівковою оболонкою таблетки з **R** з одного боку та, залежно від дози, з іншого боку мають: таблетки 6,25 мг – «253», таблетки 12,5 мг – «254», таблетки 25 мг – «255».

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання. Зберігати при температурі не вище 25°C в недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 10 таблеток у стрипі, по 2 стрипи в картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. Д-р Редді'с Лабораторіс Лтд», Індія Dr. Reddy's Laboratories Ltd, India

Місцезнаходження. Дільниця № 42, 45, 46, с. Бачупалі, Кутбулапур Мандал, округ Ранга Редді, Андхра Прадеш, Індія Survey № 42, 45, 46, Bachupally Village Quthbullapur Mandal, Ranga Reddy District Andhra Pradesh, India