

# ІНСТРУКЦІЯ ДЛЯ МЕДИЧНОГО ЗАСТОСУВАННЯ ПРЕПАРАТУ

## КАРВЕДИЛОЛ-КВ

### Склад.

**Діюча речовина:** карведилол;

1 таблетка містить 12,5 мг або 25 мг карведилолу;

допоміжні речовини: сахароза, лактози моногідрат, повідон, кросповідон, кремнію діоксид колоїдний безводний, магнію стеарат.

**Лікарська форма.** Таблетки.

**Фармакотерапевтична група.** Засоби, що впливають на серцево-судинну систему. Сполучні блокатори альфа- і бета-адренорецепторів. Код АТС С07А G02.

### Клінічні характеристики.

#### Показання.

Артеріальна гіпертензія (у вигляді монотерапії та в комбінації з іншими антигіпертензивними засобами), стабільна стенокардія, хронічна серцева недостатність (I–III стадії по NYHA) у комбінації з діуретиками, дигоксином та інгібіторами ангіотензинперетворювального ферменту.

**Протипоказання.** Підвищена індивідуальна чутливість до компонентів препарату, артеріальна гіпотензія, декомпенсована серцева недостатність, виражена брадикардія (менше 50 уд/хв), атріовентрикулярна блокада II та III ступеня (за винятком пацієнтів зі штучним водієм ритму), синдром слабкості синусового вузла, кардіогенний шок, хронічні обструктивні захворювання легенів, бронхіальна астма, виражені порушення функції печінки, метаболічний ацидоз. Вагітність, період годування груддю, дитячий вік (до 18 років).

**Спосіб застосування та дози.** Призначають дорослим незалежно від прийому їжі. Доза і тривалість лікування визначаються індивідуально лікарем залежно від нозології, переносимості та ефективності терапії. При недостатності кровообігу краще приймати під час їжі всмоктування та зменшити ризик ортостатичних реакцій. Таблетку ковтають, не розжовуючи, запиваючи достатньою кількістю рідини.

*Артеріальна гіпертензія.* Початкова доза звичайно становить 12,5 мг 1 раз на добу протягом перших 2 днів (дозу можна розділити на два прийоми по 6,25 мг), що вже може забезпечити необхідний ефект. При необхідності дозу можна збільшити через 2 дні до 25 мг 1 раз на добу, потім з або у 2 прийоми (вранці й увечері по 25 мг). Максимальна добова доза — 50 мг.

*Стенокардія.* Початкова доза звичайно становить по 12,5 мг 2 рази на добу протягом перших 2 днів, потім по 25 мг 2 рази на добу (вранці інтервалами не менше двох тижнів до максимальної добової дози 100 мг, поділеної на 2 прийоми. Для хворих літнього віку максимальна добова доза становить 50 мг, поділена на 2 прийоми.

*Хронічна серцева недостатність.* Дозу підбирають від стану пацієнта. Пацієнт повинен бути

під постійним наглядом у перші 2-3 години після першого прийому препарату та після прийому збільшеної дози. Дози дигоксину, діуретиків та інгібіторів ангіотензинперетворювального ферменту повинні бути зафіксовані до призначення препарату. Рекомендована початкова доза звичайно становить 6,25 мг 1 раз на добу. При добрій переносимості та необхідності у підвищенні дози, її збільшують з інтервалами не менше двох тижнів до 6,25 мг двічі на добу, потім — до 12,5 мг двічі на добу, після чого — до 25 мг двічі на добу. Для пацієнтів з масою тіла менше 85 кг максимальна добова доза становить 50 мг за два прийоми, для пацієнтів з масою тіла більше 85 кг — 100 мг за два прийоми.

**Передозування.** Симптоми: різка артеріальна гіпотензія (систолический тиск 80 мм рт.ст. та нижче), брадикардія (менше 50 уд/хв), кардіогенний шок, порушення функції дихання (bronхоспазм), недостатність кровообігу, судоми, зупинка серця. Лікування: протягом перших годин — індукція блювання та промивання шлунка, далі контроль та корекція життєво важливих показників у відділенні інтенсивної терапії. Підтримуюча терапія: при вираженій брадикардії — атропін 0,5-2 мг внутрішньовенно; для підтримки серцевої діяльності — глюкагон 1-5 мг (максимальна доза — 10 мг) внутрішньовенно струминно, потім 2-5 мг/год у вигляді інфузій та/або адреноміметики (орципреналін, ізопреналін) 0,5-1 мг внутрішньовенно. При переважанні периферичної судинорозширювальної дії призначають норадреналін у повторних дозах по 5-10 мкг або у вигляді інфузії 5 мкг/хв. Для купірування бронхоспазму застосовують бета2-адреноміметики у вигляді аерозолу, при неефективності — внутрішньовенно або амінофілін внутрішньовенно. При судомомах — діазепам або клоназепам внутрішньовенно повільно. У тяжких випадках інтоксикації при кардіогенному шоку підтримуючу терапію продовжують досить довго, поки не стабілізується стан хворого та з урахуванням періоду напіввиведення карведилолу.

**Застосування у період вагітності або годування груддю.** Препарат протипоказаний при вагітності. При необхідності застосування в період лактації годування груддю слід припинити.

**Діти.** Препарат протипоказаний дітям віком до 18 років.

**Особливості застосування.** З обережністю та під контролем лікаря (особливо на початку лікування та при кожному підвищенні дози) препарат слід застосовувати у осіб літнього віку, при цукровому діабеті (маскує клінічні прояви гіперглікемії) та гіпоглікемії, тиреотоксикозі, оклюзійних захворюваннях периферичних судин, атріовентрикулярній блокаді I ступеня, хронічній обструктивній хворобі легенів, вазоспастичній стенокардії Принцметала (може провокувати напади), псоріазі, порушеннях функцій нирок, депресії, міастенії, у хворих на феохромоцитому (тільки у поєднанні з альфа-адреноблокаторами), при великих хірургічних втручаннях та загальній анестезії, а також на тлі лікування альфа-адреноблокаторами, альфа-адреноміметиками, засобами наперстянки, діуретиками та/або інгібіторами моноаміноксидази. У цих випадках лікування слід починати з низьких доз з подальшим повільним підвищенням до ефективних. На початку лікування або при підвищенні дози препарату у пацієнтів, особливо у літніх, може відзначатися надмірне зниження артеріального тиску, особливо при вставанні, що вимагає корекції дози.

Пацієнтам із серцевою недостатністю рекомендується приймати препарат під час прийому їжі з метою запобігання ортостатичній гіпотензії. При появі у цих пацієнтів набряків та/або наростанні симптомів серцевої недостатності слід підвищити дозу діуретиків та, при необхідності, зменшити дозу карведилолу аж до стабілізації стану хворого. У разі зниження частоти серцевих скорочень до 55 уд/хв препарат слід відмінити.

При призначенні пацієнтам з недостатністю кровообігу, низьким артеріальним тиском (систолический артеріальний тиск менше 100 мм рт. ст.), ішемічною хворобою серця та/або

нирковою недостатністю необхідно контролювати функцію нирок, при її погіршенні — зменшити дозу або відмінити препарат та збільшити дозу діуретиків.

Пацієнтам з хронічними обструктивними захворюваннями легенів з бронхоспастичним компонентом, які не одержують протиастматичні засоби, карведилол слід призначати тільки в тому випадку, якщо користь від його застосування перевищує потенційний ризик. У осіб з тяжкою алергією або у тих, що проходять курс десенсибілізації, карведилол може підсилити алергічні реакції. Хворим, у яких раніше на тлі лікування бета-блокаторами виникав або загострювався псоріаз, препарат можна призначати тільки після ретельної оцінки можливої користі та ризику. Як і інші бета-блокатори, карведилол може зменшувати вираженість тиреотоксикозу. У разі проведення хірургічних втручань з використанням загальної анестезії слід попередити анестезіолога про попередню терапію карведилолом. Пацієнтам з феохромоцитомою до початку терапії слід призначити альфа-адреноблокатори. Особи, які користуються контактними лінзами, повинні бути попереджені про можливість зменшення сльозовиділення. В період лікування слід уникати вживання етанолу.

При необхідності одночасного призначення блокаторів «повільних» кальцієвих каналів — похідних фенілалкіламіну (верапаміл) та бензотіазепіну (дилтіазем), а також антиаритмічних засобів I класу (аміодарон) рекомендується постійне моніторування ЕКГ та артеріального тиску.

При відміні одночасної терапії клонідином слід спочатку припинити лікування карведилолом, потім через декілька днів відмінити клонідин. Карведилол не впливає на концентрацію глюкози у крові та не спричиняє змін показників тесту толерантності до глюкози у хворих на інсулінонезалежний цукровий діабет.

Терапія повинна проводитися тривало і не повинна різко припинятися, особливо у хворих на ішемічну хворобу серця, через можливість погіршення перебігу основного захворювання. Рекомендується протягом 1-2 тижнів знижувати дозу наполовину кожні 3 дні. При перериванні лікування на 2 тижні та більше відновлювати лікування слід з мінімальних доз.

Карведилол не можна приймати разом з алкоголем.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами. В період лікування слід утримуватися від керування автотранспортом та занять потенційно небезпечними видами діяльності, що вимагають підвищеної концентрації уваги і швидкості психомоторних реакцій.

**Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.** Карведилол не можна приймати, якщо пацієнту роблять внутрішньовенні введення, дилтіазему, антиаритмічних засобів (особливо I класу). Потенціювання ефекту спостерігається при одночасному прийомі з антигіпертензивними засобами, нітратами та антиаритмічними препаратами. Препарати, що знижують вміст катехоламінів (резерпін, інгібітори моноаміноксидази), та клонідин підвищують ризик розвитку артеріальної гіпотензії та брадикардії. Інгібітори мікросомального окиснення (циметидин) підсилюють, а індуктори (фенобарбітал, рифампіцин) — послаблюють ефекти карведилолу. Одночасне застосування з алкалоїдами ріжків погіршує периферичний кровообіг. При застосуванні з серцевими глікозидами (дигоксином), верапамілом та дилтіаземом можливе порушення атріовентрикулярної провідності, рідко з гемодинамічними порушеннями. Карведилол підвищує вміст дигоксину та циклоспорину в крові, що вимагає корекції їхніх доз. Загальні анестетики посилюють негативний інотропний та гіпотензивний ефекти карведилолу. Карведилол може потенціювати дію інсуліну та пероральних гіпоглікемічних засобів, маскуючи

симптоми гіпоглікемії (особливо тахікардію), що вимагає регулярного контролю рівня глюкози в крові.

### **Фармакологічні властивості.**

*Фармакодинаміка.* Антигіпертензивний, судинорозширювальний, антиангінальний засіб. Неселективний альфа1-, бета1- та бета2-адреноблокатор, без внутрішньої симпатоміметичної активності. Судинорозширювальна дія обумовлена, головним чином, блокуванням альфа1-адренорецепторів. Блокуючи бета-адренорецептори, знижує активність ренін-ангіотензин-альдостеронової системи, активність реніну плазми при цьому знижується без затримки виведення рідини. Знижує артеріальний тиск, загальний периферичний опір судин, перед- та постнавантаження на серце, помірно зменшує частоту серцевих скорочень, не впливаючи на нирковий кровообіг та функцію нирок. Поєднання судинорозширювальної дії та бета-адреноблокуючих властивостей сприяє тому, що у хворих на артеріальну гіпертензію зниження артеріального тиску не супроводжується одночасним підвищенням периферичного опору судин, як при прийомі інших бета-адреноблокаторів. Має мембраностабілізуючі властивості.

Є потужним антиоксидантом, що усуває вільні радикали кисню. Не впливає на ліпідний обмін, зокрема на співвідношення ліпопротеїдів високої/низької щільності, та на вміст у крові іонів калію, натрію і магнію.

Антигіпертензивний ефект розвивається через 2-3 години після прийому та зберігається протягом 24 години. При тривалому лікуванні максимальний ефект розвивається через 3-4 тижні. У хворих на ішемічну хворобу серця чинить протиішемічну та антиангінальну дію. У хворих з порушеннями функції лівого шлуночка та/або недостатністю кровообігу сприятливо впливає на гемодинамічні показники, підвищуючи фракцію викиду лівого шлуночка та зменшуючи його розміри, знижує кінцевий систолічний об'єм та кінцевий діастолічний об'єм, а також периферичний та легеневий опір, збільшує толерантність до фізичного навантаження. Фракція викиду та серцевий індекс при нормальній функції серця не змінюються. Дія карведилолу більш виражена у пацієнтів з тахікардією (частота серцевих скорочень більше 82 уд/хв) і низькою фракцією викиду (менше 23%).

*Фармакокінетика.* Швидко і майже повністю всмоктується зі шлунково-кишкового тракту. Максимальна концентрація у крові досягається приблизно через 1 годину. Біодоступність становить 25% за рахунок ефекту «першого проходження через печінку» (60-75%). Прийом їжі не впливає на біодоступність та рівень максимальної концентрації, але подовжує час її досягнення. Зв'язується з білками плазми на 98-99%. Інтенсивно метаболізується переважно у печінці за рахунок з'єднання з глюкуроною кислотою. Внаслідок деметилування та гідроксилювання утворюються три метаболіти з вираженою бета-блокуючою та антиоксидантною дією. Об'єм розподілу становить майже 2 л/кг та збільшується при порушенні функції печінки. Проходить через плацентарний бар'єр, виділяється в грудне молоко. Період напіввиведення карведилолу — 6-10 годин, плазмовий кліренс — приблизно 590 мл/хв. Екскретується, в основному, з жовчю, невелика частина дози виводиться у вигляді метаболітів нирками.

При порушенні функції печінки об'єм розподілу збільшується на 80%. При цирозі печінки біодоступність підвищується у 4 рази, а максимальна концентрація у плазмі крові — у 5 разів. У літніх хворих концентрація карведилолу в плазмі крові на 50% вище, ніж у молодих. Порушення функції нирок не супроводжується кумуляцією карведилолу. Практично не виводиться при гемодіалізі.

### **Фармацевтичні характеристики.**

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки круглої форми з двоопуклою поверхнею з рискою, білого або майже білого кольору.

**Термін придатності.** 2 роки.

**Умови зберігання.** Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Зберігати в недоступному для дітей місці!

**Упаковка.** По 10 таблеток у блістері; по 3 блістери в пачці.

**Категорія відпуску.** За рецептом.

