

FOLLETO DE INFORMACION AL PROFESIONAL
CARVEDILOL COMPRIMIDOS RECUBIERTOS 6,25 mg

FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL

1. Nombre del producto farmacéutico

CARVEDILOL

comprimidos recubiertos 6,25 mg / 12,5 mg / 25 mg.

2. Composición cualitativa y cuantitativa

Cada comprimido recubierto contiene: Carvedilol 6,25 mg/12,5 mg/ 25 mg

Excipientes (c.s.): ver sección 6.

3. Forma farmacéutica

Comprimido recubierto.

4. Particulares clínicos

4.1.Indicaciones Terapéuticas

~~Carvedilol es un bloqueador alfa y beta utilizado para tratar la presión sanguínea alta (Hipertensión) y la insuficiencia cardíaca.~~

~~Así mismo, es utilizado después del infarto agudo de miocardio con el fin de mejorar la sobrevivencia. Dilata los vasos sanguíneos (vasodilatador) y disminuye la presión sanguínea alta, lo cual ayuda a prevenir accidentes cerebrovasculares, ataques cardíacos y problemas renales. Este medicamento trabaja bloqueando la acción de ciertos químicos naturales presentes en el cuerpo (tales como la epinefrina), que afectan al corazón y los vasos sanguíneos. Como resultado, se produce una disminución, tanto en el ritmo cardíaco como la presión sanguínea y la tensión en el corazón.~~

~~Carvedilol es también utilizado para prevenir el empeoramiento futuro de la insuficiencia cardíaca congestiva. La disfunción ventricular izquierda ocurre cuando el ventrículo izquierdo (la principal cámara de bombeo del corazón) se endurece y se agranda, y puede causar que los pulmones se llenen de sangre.~~

~~Carvedilol está indicado en el tratamiento de insuficiencia cardíaca estable, leve, moderada y severa junto con terapias estándar ej: diuréticos, digoxina, inhibidores de la ECA en pacientes con euvolemia.~~

~~Carvedilol está indicado para el tratamiento profiláctico de la angina estable.~~

Tratamiento de la hipertensión esencial..

Cardiopatía coronaria. Tratamiento de la angina estable.

El Carvedilol ha demostrado tener eficacia clínica en la cardiopatía coronaria. Datos preliminares muestran su eficacia y seguridad en pacientes con angina inestable e isquemia miocárdica asintomática.

FOLLETO DE INFORMACION AL PROFESIONAL
CARVEDILOL COMPRIMIDOS RECUBIERTOS 6,25 mg

Insuficiencia cardiaca crónica

A menos que exista una contraindicación, se indica Carvedilol para el tratamiento de todos los pacientes que presentan insuficiencia cardiaca crónica estable y sintomática de carácter grave, leve, moderada o aguda de etiología isquémica o no isquémica, combinado con una terapia estándar (que incluya inhibidores de ECA y diuréticos, con o sin digitálicos).

Disfunción ventricular izquierda posterior al infarto agudo de miocardio: Tratamiento a largo plazo después del infarto de miocardio complicado con una disfunción ventricular izquierda (fracción de eyección del ventrículo izquierdo [FEVI] <40% o índice de movilidad parietal 1,3), en asociación con IECA y otros fármacos recomendados para el tratamiento de los pacientes después del infarto de miocardio

4.2.Posología y Método de Administración**Posología y forma de administración**

La dosis de Carvedilol varía acorde a cada paciente.

Los comprimidos deben tomarse con suficiente líquido.

La cantidad de comprimidos a administrar depende de la potencia del medicamento. Asimismo, la cantidad de dosis diaria, el tiempo permitido entre dosis y el tiempo de duración del medicamento depende de los problemas de salud del paciente.

La dosis de Carvedilol no deberá ser incrementada en pacientes con insuficiencia cardíaca que hayan empeorado desde la última visita o, en pacientes con signos de insuficiencia cardíaca crónica descompensada o inestable.

Cardiopatía coronaria

La dosis recomendada para iniciar la terapia es de 12,5 mg dos veces al día durante los dos primeros días. Luego, la dosis recomendada es de 25 mg dos veces al día. Si es necesario, posteriormente puede aumentarse la dosis a intervalos de al menos dos semanas hasta alcanzar la dosis diaria máxima recomendada de 100 mg, administrada en dosis separadas de 50 mg dos veces al día.

Insuficiencia Cardíaca Crónica (ICC)**Adultos**

La dosis inicial recomendada es de 3.125 mg dos veces al día por dos semanas. Si la dosis es tolerada, la dosificación se deberá incrementar con posterioridad en intervalos no menores a dos semanas, a 6.25 mg dos veces al día, luego 12.5mg dos veces al día y de ahí en más 25mg dos veces al día. La dosis se incrementará al nivel de tolerancia máximo del paciente.

La dosis diaria máxima recomendada para pacientes con ICC severa es de 25mg, suministrada dos veces al día y la dosis máxima para pacientes con ICC leve a moderada que pesen más de 85 kg es de 50 mg dos veces al día.

FOLLETO DE INFORMACION AL PROFESIONAL
CARVEDILOL COMPRIMIDOS RECUBIERTOS 6,25 mg

Durante el ajuste de la dosis en pacientes con presión sanguínea sistólica < 100 mmHg, se puede presentar deterioro de las funciones renales y/o funciones cardíacas. Por lo tanto, antes de incrementar la dosis, estos pacientes deberán ser evaluados por el médico tanto en sus funciones renales como en los síntomas de empeoramiento de sus funciones cardíacas o vasodilatación.

El empeoramiento transitorio de la insuficiencia cardíaca, vasodilatación o retención de líquidos puede ser tratado mediante el ajuste de la dosis de diuréticos o inhibidores de la ECA, o modificando o discontinuando el tratamiento con Carvedilol.

Bajo estas circunstancias, la dosis de Carvedilol no debe ser incrementada hasta que los síntomas de empeoramiento de insuficiencia cardíaca o vasodilatación hayan sido estabilizados.

En caso de discontinuar el tratamiento con Carvedilol por más de dos semanas, se debe recomenzar el tratamiento con 3.125 mg dos veces al día y luego ajustar la dosis acorde con la dosificación arriba recomendada.

Ancianos

Ver adultos.

Hipertensión

Se recomienda una dosis diaria.

Adultos

La dosis de tratamiento inicial recomendada es de 12.5mg una vez al día por los primeros dos días. Después de eso, la dosis recomendada es de 25mg una vez al día. A pesar de que ésta es una dosis adecuada para la mayoría de los pacientes, en caso de ser necesario, la dosis se puede ajustar a un máximo de 50mg ya sea en una única dosis o dosificada varias veces al día. El ajuste de la dosis debe darse en intervalos de al menos dos semanas.

Ancianos

Se recomienda una dosis inicial de 12,5mg diarios. Si la respuesta no es suficiente, la dosis se puede ajustar un máximo recomendado de 50mg ya sea en una única dosis o dosificada varias veces al día.

Angina

Adultos

La dosis inicial recomendada es de 12,5mg dos veces al día durante los dos primeros días. Luego, la dosis recomendada es de 25mg dos veces al día.

FOLLETO DE INFORMACION AL PROFESIONAL
CARVEDILOL COMPRIMIDOS RECUBIERTOS 6,25 mg

Ancianos

La dosis máxima recomendada es de 50mg diarios divididos en dosis.

Disfunción ventricular izquierda posterior al Infarto Agudo de Miocardio

La dosis debe ajustarse a cada paciente bajo el estrecho seguimiento del médico durante la fase de aumento de la dosis. El tratamiento pueden iniciarse en el hospital o ambulatoriamente cuando el paciente se encuentre estable desde el punto de vista hemodinámico y cuando se haya reducido al mínimo la retención de líquidos.

Primera dosis de Carvedilol:

La dosis inicial es de 3,125 mg dos veces al día. Los pacientes deben permanecer bajo observación médica estrecha durante al menos 3 horas después de administrar la dosis inicial.

Siguientes dosis de Carvedilol:

Si el paciente tolera la primera dosis (es decir, frecuencia cardíaca > 50 latidos/minuto, tensión arterial sistólica > 80 mm Hg y ausencia de signos clínicos de intolerancia), la dosis se aumentará hasta 6,25 mg 2 veces al día y se mantendrá durante 3-10 días.

Si en este período aparecieran signos de intolerancia –en particular bradicardia (<50 latidos/min), tensión arterial sistólica <80 mm Hg o retención de líquidos- la dosis se reducirá hasta 3,125 mg 2 veces al día. Si el paciente no tolera esta dosis, se debe interrumpir el tratamiento. Si se tolera bien, debe volver a aumentarse a 6,25 mg dos veces al día después de 3 a 10 días.

Aumento posterior de la dosis:

Si la dosis de 6,25 mg 2 veces al día se tolera bien, se aumentará la dosis a intervalos de 3-10 días, hasta 12,5 mg 2 veces al día y luego hasta 25 mg 2 veces al día. La dosis de mantenimiento es la dosis máxima que tolere el paciente.

La dosis máxima recomendada es de 25 mg 2 veces al día, independientemente del peso del paciente.

4.3. Contraindicaciones

- Carvedilol está contraindicado en pacientes con marcada retención de líquidos o sobrecarga que requieran apoyo inotrópico intravenoso.
- Pacientes con enfermedades obstructivas de las vías respiratorias, disfunción hepática, hipersensibilidad al Carvedilol o a alguno de los excipientes.
- La presencia de otros problemas de salud puede afectar el uso de Carvedilol.
- Reacciones alérgicas severas que impliquen inflamación facial y/o dificultad para respirar.
- Asma u otras condiciones broncoespásticas: Carvedilol puede causar una mayor capacidad de reacción a sustancias que agravan este tipo de condiciones o una menor respuesta al tratamiento de este tipo de reacciones.

FOLLETO DE INFORMACION AL PROFESIONAL
CARVEDILOL COMPRIMIDOS RECUBIERTOS 6,25 mg

- Angina (fuerte dolor torácico): Carvedilol puede provocar dolor torácico.
- Carvedilol puede agravar las condiciones bronquiales, no alérgico o bronquitis, crónico o enfisema.
- Bradicardia (latido cardíaco lento inusual) u otros problemas de ritmo cardíaco, o enfermedades cardíacas o de vasos sanguíneos: Carvedilol puede generar problemas como resultado del empeoramiento de estas condiciones.
- Diabetes mellitus (la diabetes del azúcar) o baja azúcar en sangre (Hipoglucemia): Carvedilol puede agravar el bajo nivel de azúcar en sangre (Hipoglucemia) ocasionados por la insulina y puede retrasar la recuperación de los niveles de azúcar en sangre; en pacientes con diabetes o insuficiencia cardíaca, Carvedilol puede fomentar el incremento de los niveles de azúcar en sangre; además, si el medicamento para la diabetes provoca que el azúcar en sangre sea demasiado baja, el betabloqueante puede encubrir algunos de los síntomas (latidos cardíacos acelerados).
- Enfermedades renales o enfermedades hepáticas: Los efectos de Carvedilol pueden incrementar debido a que el cuerpo lo elimina de forma más lenta.
- Tiroides hiperactiva: Carvedilol puede encubrir los síntomas de esta condición, tales como latidos cardíacos acelerados; la abrupta discontinuación de Carvedilol puede provocar síntomas de esta afección.
- **Hipersensibilidad a Carvedilol o a cualquier componente de la formulación de este medicamento.**
- **Disfunción hepática clínicamente manifiesta**
- **Al igual que ocurre con los bloqueadores beta, no se debe administrar Carvedilol a pacientes que presenten bloqueo aurículo-ventricular de 2° y 3er. Grado, a menos que esté implantado un marcapasos; bradicardia severa (<50 lpm); síndrome del seno enfermo (incluso bloqueo seno-auricular); hipotensión severa (TA< 85 mm Hg), shock cardiogénico e historial de broncoespasmos o asma.**

4.4. Advertencias especiales y precauciones de uso

En pacientes con insuficiencia cardíaca crónica, puede ocurrir un empeoramiento de la insuficiencia cardíaca o retención de líquidos durante el ajuste de dosis de Carvedilol. Si se presentan tales síntomas, la dosis de diurético debe ser modificada y la dosis de Carvedilol no debe ser potenciada hasta que la estabilidad clínica sea reanudada.

A veces puede ser necesario disminuir la dosis de Carvedilol o discontinuar su uso temporalmente. Tales episodios no impiden el subsiguiente ajuste de dosis de Carvedilol de manera exitosa.

Carvedilol debe ser administrado con precaución en pacientes hipertensos que sufren de insuficiencia cardíaca crónica controlada con digoxina, diuréticos y/o inhibidores de la ECA, ya que tanto la digoxina como el Carvedilol pueden reducir la conducción atrioventricular.

Como con otras drogas con actividad betabloqueante, Carvedilol puede encubrir los signos tempranos de hipoglucemia aguda en pacientes con diabetes mellitus. Generalmente, es preferible otro tipo de alternativas a agentes betabloqueantes en pacientes insulino dependientes. En pacientes con diabetes,

FOLLETO DE INFORMACION AL PROFESIONAL
CARVEDILOL COMPRIMIDOS RECUBIERTOS 6,25 mg

el uso de Carvedilol puede estar asociado al empeoramiento del control de glucosa en sangre. Por lo tanto, se requiere un monitoreo regular de glucosa en sangre en diabéticos cuando se inicia el tratamiento con Carvedilol o se ajusta la dosis, así como también un tratamiento hipoglucemiante acorde.

Existe un deterioro reversible de la función renal en pacientes con insuficiencia cardíaca crónica con baja presión sanguínea (sistólica BP < 100mmHg), enfermedad cardíaca isquémica y enfermedad vascular periférica, y/o insuficiencia renal subyacente. En pacientes con ICC con estos factores de riesgo, se debe monitorear la función renal durante el período de ajuste de dosis de Carvedilol y discontinuar su uso o reducir la dosis de la droga en caso que exista un empeoramiento de la insuficiencia renal.

Las personas que usan lentes de contacto deben ser informadas sobre la posibilidad de la disminución de secreción de lágrimas.

La discontinuación de Carvedilol debe ser gradual (1-2 semanas), especialmente en pacientes con enfermedad cardíaca isquémica ya que Carvedilol posee actividad betabloqueante. Carvedilol puede ser utilizado en pacientes con enfermedad vascular periférica. Los betabloqueantes puros pueden precipitar o agravar los síntomas de insuficiencia arterial. Sin embargo, como Carvedilol también contiene alfabloqueantes, este efecto es en gran parte compensado.

Carvedilol, como otros agentes con actividad betabloqueante, puede encubrir los síntomas de tirotoxicosis.

Si Carvedilol induce bradicardia, con una disminución de la frecuencia del pulso menor a 55 latidos por minuto, la dosis de Carvedilol debe ser reducida.

Carvedilol se debe administrar con cuidado en pacientes con historia de reacciones de hipersensibilidad seria y en aquellos que se someten a terapias de desensibilización ya que los betabloqueantes pueden incrementar tanto la sensibilidad a los alérgenos como la gravedad de las reacciones anafilácticas.

Aquellos pacientes que sufren del trastorno circulatorio periférico del fenómeno de Raynaud pueden presentar exacerbación de los síntomas.

Se debe administrar Carvedilol en aquellos pacientes con historia de psoriasis asociada a la terapia betabloqueante, sólo después de considerar la relación riesgo-beneficio.

En pacientes con feocromocitoma se debe iniciar un agente alfabloqueante previo al uso de cualquier agente betabloqueante. Por lo tanto, se debe tener precaución al administrar Carvedilol en aquellos pacientes que pueden llegar a tener feocromocitoma.

Los agentes con actividad betabloqueante no selectiva, pueden provocar dolor de pecho en los pacientes con angina variante de Prinzmetal. Sin embargo, se debe tener precaución en la administración de Carvedilol a los pacientes que se sospecha que sufren de angina variante de Prinzmetal.

Aquellos pacientes con tendencia a reacciones de broncoespasmo, pueden presentar dificultad respiratoria como resultado de un posible incremento de la resistencia de las vías respiratorias. Por lo tanto, evitar prescribir Carvedilol a pacientes con sibilancias debido al asma u otras enfermedades respiratorias.

FOLLETO DE INFORMACION AL PROFESIONAL
CARVEDILOL COMPRIMIDOS RECUBIERTOS 6,25 mg

4.5. Interacción con otros productos farmacéuticos y otras formas de interacción

Junto con otros agentes de actividad betabloqueante, Carvedilol puede potenciar el efecto de otros fármacos de acción antihipertensiva administrados de forma concomitante (ej: receptor antagonista alfa 1) o que poseen hipotensión en su perfil de efectos adversos.

Los pacientes que consumen un agente con propiedades betabloqueantes y medicamentos que agotan catecolaminas (ej: inhibidores de la monoaminoxidasa y reserpina) deben ser observados de cerca ya que pueden presentar signos de hipotensión y/o bradicardia grave.

Se pueden presentar casos aislados de trastornos de la conducción (raramente con alteración hemodinámica) cuando Carvedilol y diltiazem se prescriben concomitantemente. Por lo tanto, como con otras drogas con actividad betabloqueante, cuando se coadministran bloqueadores de canal de calcio del tipo de verapamil o diltiazem, o drogas antiarrítmicas clase I, se debe monitorear minuciosamente mediante ECG y presión sanguínea. Este tipo de drogas no se deben coadministrar de manera intravenosa en pacientes tratados con Carvedilol.

Los efectos de la insulina o hipoglucemiantes orales se pueden intensificar. Es por este motivo que se recomienda un monitoreo regular de la glucosa en sangre.

En pacientes hipertensos, a quienes se les coadministra Carvedilol y dioxina, los niveles de digoxina se pueden incrementar en un 16% aproximadamente a través del plasma. Se recomienda un incremento de los niveles de digoxina cuando se inicia, se ajusta o discontinúa el uso de Carvedilol. La administración concomitante de Carvedilol y glucósidos cardíacos puede prolongar el tiempo de conducción AV.

Cuando el tratamiento conjunto de Carvedilol con clonidina concluye, se debe retirar primero el Carvedilol varios días antes de comenzar a reducir gradualmente la dosis de clonidina.

Se debe tener especial cuidado en aquellos que reciben inductores de oxidasas de función mixta ej: Rifampicina ya que los niveles séricos de Carvedilol pueden reducir o inhibir las oxidasas de función mixta ej: cimetidina debido a que se pueden incrementar los niveles séricos.

Durante la anestesia general, se le debe prestar atención a los posibles efectos sinérgicos inotrópicos negativos de Carvedilol y drogas anestésicas.

4.6. Embarazo y lactancia

Carvedilol no debe ser utilizado durante el embarazo o la lactancia, a no ser que los beneficios anticipados superen los riesgos potenciales. Los betabloqueantes reducen la perfusión de placenta, lo cual puede resultar en muerte fetal intrauterina, y partos inmaduros y prematuros.

No se recomienda administrar Carvedilol durante la lactancia.

4.7. Efectos en la capacidad de conducir y operar otras maquinarias automatizadas

Al igual que otras drogas que producen cambios en la presión sanguínea, los pacientes que consumen Carvedilol no deben conducir u operar maquinaria si experimentan mareos o síntomas similares, especialmente al comenzar o cambiar el tratamiento y en asociación con el alcohol.

FOLLETO DE INFORMACION AL PROFESIONAL
CARVEDILOL COMPRIMIDOS RECUBIERTOS 6,25 mg

4.8. Efectos no deseados

En insuficiencia cardíaca crónica

Hematológico

Poco común, trombocitopenia.

Puede ocurrir leucopenia.

Metabólico

Comunes:

Aumento de peso e hipercolesterolemia. En pacientes con diabetes mellitus preexistente es también común la hiperglucemia, la hipoglucemia, y el empeoramiento del control de glucosa en sangre.

Sistema nervioso central

Muy comunes: Mareos, dolor de cabeza generalmente leve especialmente al comienzo del tratamiento. Astenia (incluso cansancio).

Sistema Cardiovascular

Comunes: Bradicardia, hipotensión postural, hipotensión, edema (incluyendo edema generalizado, periférico, dependiente y genital, edema de piernas, hipervolemia y sobrecarga de líquidos).

Raros: Síncope (incluyendo presíncope), Bloqueo AV e insuficiencia cardíaca durante el ajuste de dosis.

Sistema gastrointestinal

Comunes: Náusea, diarrea y vómitos.

Piel y tejido subcutáneo

Dermatitis, y aumento de la sudoración.

Otros

Comunes: anomalías en la visión.

Raro: Insuficiencia renal aguda y anomalías en la función renal en pacientes con enfermedad vascular periférica y/o insuficiencia renal.

La frecuencia de las experiencias adversas no depende de la dosis, con excepción de los mareos, la visión anormal y la bradicardia.

En hipertensión y Angina

El perfil es similar a aquel que se observa en la insuficiencia cardíaca crónica, a pesar de la incidencia de eventos es generalmente menor en pacientes con hipertensión y angina tratados con Carvedilol.

Trastornos sanguíneos y del sistema linfático

Pueden ocurrir cambios en las transaminasas séricas, trombocitopenia y leucopenia.

FOLLETO DE INFORMACION AL PROFESIONAL
CARVEDILOL COMPRIMIDOS RECUBIERTOS 6,25 mg

Sistema nervioso central

Común: Mareos, dolor de cabeza y cansancio, los cuales generalmente son leves y pueden ocurrir especialmente al comienzo del tratamiento.

Poco comunes: Ánimo deprimido, alteraciones del sueño, parestesia, y astenia.

Metabólicas

Debido a las propiedades betabloqueantes, es también posible que se manifieste la diabetes mellitus latente, la diabetes manifiesta se agrave, y se inhiba la contrarregulación de la glucosa en sangre.

Sistema Cardiovascular

Común: Bradicardia, hipotensión postural, especialmente al inicio del tratamiento.

Poco comunes: Síncope, hipotensión, mala circulación periférica (extremidades frías, PVD, exacerbación de claudicación intermitente y fenómeno de Raynaud)

Bloqueo AV, angina pectoris (incluyendo dolor torácico), síntomas de insuficiencia cardíaca y edema periférico.

Sistema respiratorio

Común: Asma y disnea en pacientes con predisposición.

Raros: Nariz tapada. Sibilancias y síntomas similares a la gripe.

Sistema gastrointestinal

Común: Trastorno gastrointestinal (con síntomas tales como náuseas, dolor abdominal y diarrea).

Poco comunes: vómitos y constipación.

Piel y tejido subcutáneo

Poco comunes: Reacciones de piel (ej: exantema alérgico, dermatitis, urticaria, prurito, y reacciones similares al liquen plano), pueden presentarse lesiones psoriásicas de piel o exacerbarse lesiones preexistentes.

Otros

Común: Dolor en las extremidades, disminución en la secreción de lágrimas.

Poco común: Casos de impotencia sexual y alteraciones visuales.

Raro: sequedad en la boca y trastornos de la micción e irritación ocular.

4.9.**Sobredosis****Síntomas y signos**

Pueden esperarse efectos cardiovasculares severos como hipotensión y bradicardia después de una sobredosis masiva. Después de esto pueden presentarse insuficiencia cardíaca, choque cardiogénico y paro cardíaco.

También pueden presentarse problemas respiratorios, broncoespasmos, vómitos, alteración de la conciencia y convulsiones generalizadas.

FOLLETO DE INFORMACION AL PROFESIONAL
CARVEDILOL COMPRIMIDOS RECUBIERTOS 6,25 mg

Tratamiento

Lavado gástrico o emesis inducida pueden ser útiles en las primeras horas después de la ingesta.

Además de los procedimientos generales, deben monitorearse y corregirse los signos vitales, si es necesario, bajo condiciones de cuidado intensivo.

Los pacientes deben ser situados en la posición supina. Atropina, 0.5 mg a 2 mg i.v. y/o

Glucagon 1 a 10 mg i.v. (seguido por una infusión i.v. lenta de 2 a 5 mg/hora si es necesario) puede ser suministrado cuando se presenta bradicardia. Puede ser necesario un tratamiento con marcapasos. En caso de excesiva hipotensión, se pueden administrar fuidos intravenosos. Además se puede suministrar norepinefrina de 5 a 10 microgramos i.v. Repetir acorde a la respuesta de presión sanguínea o 5 microgramos de infusión por minuto determinado por la presión sanguínea. El broncoespasmo se puede tratar con salbutamol o cualquier otro beta2-antagonista ya sea en aerosol o, en caso de ser necesario, por vía intravenosa. En el caso de convulsiones, se recomienda suministrar una inyección lenta intravenosa de diazepam o clonazepam.

En casos de sobredosis severa con síntoma de shock debe continuarse el tratamiento de apoyo durante un período de tiempo suficiente, ej: hasta que el paciente se estabilice, ya que puede esperarse una vida media de eliminación prolongada y redistribución de Carvedilol desde los compartimientos profundos.

5. Propiedades farmacológicas**5.1. Propiedades farmacodinámicas**

Carvedilol es un agente beta-bloqueador no selectivo vasodilatador con propiedades antioxidantes.

La vasodilatación está mediada principalmente a través del antagonismo de receptores alfa1.

Carvedilol reduce la resistencia vascular periférica a través de la vasodilatación y reprime el sistema renina-angiotensina-aldosterona a través del betabloqueante. La actividad de la renina plasmática es reducida y la retención de líquidos es rara.

Carvedilol no posee actividad intrínseca simpaticomimética, y como el propanodol, posee propiedades de estabilización de membrana.

Carvedilol es una mezcla racémica de dos estereoisómeros. Betabloqueante es atribuido al S (-) enantiómero, en contraste, ambos enantiómeros muestran la misma actividad α_1 bloqueante.

Carvedilol es un potente antioxidante, un limpiador de radicales de oxígeno reactivo y un agente antiproliferativo. En pacientes hipertensos, una disminución en la presión sanguínea no está asociado al aumento concomitante en la resistencia periférica total, como con los agentes betabloqueantes puros. El ritmo cardíaco decrece levemente. El flujo de sangre renal y la función renal se mantienen. El flujo de sangre periférico se mantiene con drogas que posean actividad betabloqueante.

Carvedilol reduce la pre y post carga ventricular.

En pacientes con angina estable, Carvedilol posee propiedades anti-isquémicas y antianginosas.

En pacientes con disfunción ventricular izquierda e insuficiencia cardíaca crónica, Carvedilol posee efectos favorables en hemodinámica y mejoras en la eyección de la fracción ventricular izquierda y dimensiones.

FOLLETO DE INFORMACION AL PROFESIONAL
CARVEDILOL COMPRIMIDOS RECUBIERTOS 6,25 mg

5.2. Propiedades farmacocinéticas

Bioequivalencia: Este medicamento ha demostrado equivalencia terapéutica.

La biodisponibilidad absoluta de Carvedilol es de aproximadamente 25% en humanos. La biodisponibilidad es estereoselectiva, 30% para la forma R y 15% para la forma S. El pico de los niveles séricos es de aproximadamente 1 hora luego de la dosis oral. Existe una relación lineal entre la dosis y la concentración de serum. La comida no afecta la biodisponibilidad o la concentración sérica máxima a pesar que se retrasa el tiempo en alcanzar la concentración sérica máxima. Carvedilol es altamente lipofílico, aproximadamente 98% a 99% se une a las proteínas plasmáticas. El volumen de distribución es aproximadamente 2 l/kg y es incrementada en pacientes con cirrosis hepática. Carvedilol exhibe un efecto considerable de primer paso. El patrón metabolito revela intenso metabolismo con glucuronidación como uno de los principales pasos. La desmetilación y la hidroxilación del anillo fenol producen 3 metabolitos con actividad bloqueadora de receptores beta.

El promedio de vida media de eliminación varía de 6 a 10 horas. La depuración plasmática es de 590 ml/min. La eliminación es principalmente biliar. La principal ruta de excreción es vía las heces. Una porción pequeña se elimina a través del riñón en forma de varios metabolitos.

En pacientes con insuficiencia hepática, la biodisponibilidad se eleva al 80% debido a la reducción del efecto de primer paso.

6. Particularidades farmacéuticas

6.1. Lista de Excipientes

Lactosa Monohidrato, ~~Sílice~~ **Dióxido de silicio** Coloidal Anhidro, Crospovidona (Tipo A), Povidona **K30**, Sacarosa, Crospovidona (Tipo B), Estearato de Magnesio, ~~Polietilenglicol~~ **Macrogol** 400, Polisorbato 80, dióxido de titanio e hipromelosa.

6.2. Incompatibilidades

Desconocidas.

6.3. Precauciones especiales de almacenamiento

Almacenar a no más de 30 ° C, protegido de la luz, calor y humedad.

6.4. Duración (Período de eficacia del medicamento)

~~36~~ **24** meses.