



CARBALINE®

Betabloqueador y bloqueador
alfa1 de múltiple acción cardiovascular

COMPRIMIDO

Composición:
Carboline 6.25
Carvedilol.....6.25 mg
Excipientes, c.s.p.....1 comprimido

Carboline 12.5
Carvedilol.....12.5 mg
Excipientes, c.s.p.....1 comprimido

Carboline 25
Carvedilol.....25 mg
Excipientes, c.s.p.....1 comprimido

ACCIÓN FARMACOLÓGICA: El carvedilol es un agente de múltiple acción cardiovascular, que interviene en forma positiva con la regulación de la presión arterial al bloquear los receptores simpáticos beta 1 y beta 2, actuando como vasodilatador al bloquear los receptores simpáticos alfa 1. Muestra efectos cardíaco y vaso protectores, los cuales son independientes del bloqueo beta o alfa. Posee importantes propiedades antioxidantes y antiproliferativas. Es la mezcla racémica de 2 estereoisómeros, ambos con capacidad de bloqueo de los receptores alfa-adrenérgicos. El bloqueo beta-adrenérgico no selectivo, se asocia al anantímero levonotatorio. Su doble mecanismo de acción contenido en una sola molécula le permite una reducción de la presión arterial a través de acciones farmacológicas complementarias.

El bloqueo beta protege al miocardio de las acciones dañinas de las catecolaminas que incluyen muerte del miocito y arritmias.

Por su acción betabloqueadora no selectiva disminuye la actividad de la renina plasmática con las consecuencias que esto trae para la formación de angiotensina, niveles de aldosterona y la no retención de líquido.

Reduce la resistencia vascular periférica por su acción vasodilatadora mediada principalmente por bloqueo de los receptores alfa-adrenérgicos. A dosis mayores a las utilizadas regularmente se ha demostrado, en estudios pre-clínicos, bloqueo de los canales de calcio.

FARMACOCINÉTICA: Absorción y distribución: tras administración oral, Carvedilol se absorbe rápidamente, alcanzando la C_{máx} dentro de 1 hora. Alrededor de un 98% de la dosis se fija a las proteínas plasmáticas. La alimentación no afecta la biodisponibilidad, aunque alarga el tiempo de alcanzar la C_{máx}. Carvedilol es un compuesto lipofílico con un volumen de distribución de 2 l/kg, el que aumenta en pacientes con cirrosis hepática. Usado siguiendo las recomendaciones de empleo, es bastante improbable que Carvedilol se acumule durante el tratamiento a largo plazo. La biodisponibilidad absoluta del Carvedilol es de un 25-35% y es estereoselectiva, siendo de un 30% para la forma R y de 15% para la forma S. En pacientes con deterioro de la función hepática, la biodisponibilidad está aumentada hasta en un 80%, debido a una disminución del efecto de primer paso. El metabolismo en los animales y en humanos el

Carvedilol es metabolizado en una variedad de metabolitos que se eliminan por la biliar. El efecto de primer paso tras la administración oral es de un 60-75%. La desmetilación y la hidroxilación en el anillo fenólico producen 3 metabolitos con actividad beta-bloqueante.

La vida media de eliminación del Carvedilol, tras la administración oral, es de 6-7 horas. El clearance plasmático es de 590 ml/min. La eliminación es principalmente biliar y una pequeña fracción se elimina vía renal.

INDICACIONES: Hipertensión Esencial: Está indicado en el manejo de la hipertensión arterial. Puede ser utilizado como monoterapia o en combinación con otros agentes antihipertensivos, especialmente diuréticos del tipo tiazídico.

Cardiopatía isquémica: Ha demostrado ser eficaz para el tratamiento de la angina crónica estable, la isquemia miocárdica silente, angina inestable y disfunción ventricular izquierda por isquemia.

Insuficiencia Cardíaca: Esta indicado en paciente con insuficiencia cardíaca clases funcionales II - III (de la New York Heart Association) sometidos a tratamiento estándar con diurético, inhibidores de la enzima convertidora de angiotensina, digoxina y/o vasodilatadores, para reducir la mortalidad y las hospitalizaciones por causa cardiovascular incrementar el bienestar del enfermo y retrasar la progresión de la enfermedad. Puede utilizarse como complemento del manejo farmacológico estándar de la insuficiencia cardíaca aún en aquellos pacientes que por cualquier causa no estuvieran recibiendo digital, inhibidor de la enzima convertidora de la angiotensina, hidralazina o nitratos.

CONTRAINDICACIONES: El carvedilol está contraindicado en: Insuficiencia cardíaca descompensada clase funcional IV (de la New York Heart Association) que requiere tratamiento inotrópico intravenoso, asma, enfermedad pulmonar obstructiva crónica que cause con componente broncoespástico en pacientes que estén recibiendo tratamiento oral o inhalado, disfunción hepática clínicamente manifiesta, bloqueo A-V de 2do o 3er grados, bradicardia severa (< 50 latidos/min.), choque cardiogénico, Enfermedad sinusal (incluyendo bloqueo A-V), hipotensión severa (presión arterial sistólica < 85 mmHg), feocromocitoma (a menos que se encuentre bajo control adecuado con bloqueo alfa) hipersensibilidad al medicamento.

REACCIONES ADVERSAS: El carvedilol puede causar hiperglucemia (alto nivel de azúcar en sangre). Llame a su doctor de inmediato si usted tiene cualquier de los siguientes síntomas de esta condición:

- * Cansancio extremo
- * Necesidad de orinar con frecuencia
- * Hambre extrema
- * Debilidad
- * Visión borrosa

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS: Cuando se administra Carvedilol junto con otros fármacos, deberán tenerse en cuenta los siguientes posibles efectos: Puede potenciarse el efecto de otros agentes antihipertensivos; la nifampicina reduce la disponibilidad sistémica del Carvedilol, disminuyendo potencialmente su acción hipotensora; la clonidina debe suprimirse en forma gradual después de haber suspendido con algunos días de anterioridad el tratamiento con Carvedilol; la administración conjunta de nifedipina y Carvedilol puede condicionar un descenso brusco de la presión arterial; cuando se administran conjuntamente agentes bloqueadores de los canales de calcio –tipo verapamil o diltiazem– u otros fármacos antiarrítmicos, se aconseja el monitoreo cuidadoso de la presión arterial y el ECG. Debe evitarse la administración intravenosa de calcioantagonistas y fármacos antiarrítmicos durante la terapéutica con Carvedilol; Carvedilol puede causar elevación clínicamente significativa de las concentraciones plasmáticas de la digoxina; pueden potenciarse los efectos de la insulina o los fármacos hipoglucemiantes orales; determinados tranquilizantes (barbitúricos, fenotiazinas) y medicamentos destinados a la terapéutica de las depresiones (antidepresivos tricíclicos), así como vasodilatadores y alcohol pueden potenciar la acción hipotensora del Carvedilol; cuando Carvedilol se administra junto con anestésicos debe prestarse atención a los efectos cardíacos (inotropismo negativo) de los fármacos. Ante la necesidad de someterse a la anestesia será preciso informar al facultativo sobre la medicación con Carvedilol.

VÍA DE ADMINISTRACIÓN: oral

DOSIFICACIÓN:

Hipertensión Esencial:

Se recomienda la administración de la dosis diaria de Carbaline en una sola toma al día. En adultos debe iniciarse con un comprimido de 12.5 mg diario durante los primeros dos días, continuando con un comprimido de 25 mg diariamente. En caso necesario, deberá ajustarse la dosis con incrementos a intervalos no menores de dos semanas hasta la dosis máxima recomendada de dos comprimidos de 25 mg al día en una sola toma o dividida cada 12 horas. En los ancianos, la dosis inicial de un comprimido de 12.5 mg puede ser suficiente para el control satisfactorio de algunos pacientes de este grupo de edad. Si no se logra el adecuado control de la presión podrá incrementarse la dosis a intervalos de por lo menos dos semanas hasta alcanzar en caso necesario, la dosis máxima estipulada.

CARDIOPATÍA ISQUÉMICA: La dosis recomendada para el inicio del tratamiento es de un comprimido de 12.5 mg cada 12 horas durante los primeros dos días continuando con un comprimido de 25 mg cada 12 horas. En caso necesario, se podrá incrementar la dosis a intervalos de por lo menos 2 semanas hasta la dosis máxima recomendada en adultos de 100 mg al día, dividida en 2 tomas diarias. En ancianos la dosis máxima recomendada es de dos comprimidos de 25 mg al día, dividida en dos tomas diarias.

INSUFICIENCIA CARDÍACA: La dosis debe ser individualizada y estrechamente supervisada por el médico durante la fase de aumento progresivo de dosis. En aquellos pacientes que se encuentren en tratamiento con diurético, digital y/o inhibidor de la enzima convertidora de la angiotensina, deberán estabilizarse las dosis de estos medicamentos antes de iniciar con este producto. La dosis recomendada para el inicio del tratamiento es de 3.125 mg cada 12 horas durante 2 semanas. Si la dosis es tolerada, puede incrementarse a intervalos no menores de 2 semanas a un comprimido de 6.25 mg cada 12 horas, posteriormente a un comprimido de 12.5 mg cada 12 horas y finalmente a un comprimido de 25 mg cada 12 horas. La dosis deberá incrementarse hasta el nivel máximo tolerado. La dosis máxima recomendada es de 25 mg cada 12 horas en pacientes de hasta 85 kg de peso y de 50 mg cada 12 horas si el paciente pesa más de 85 kg.

Antes de cada aumento en la dosis del paciente, el médico deberá evaluar si existen síntomas de progresión de la insuficiencia cardíaca o de vasodilatación excesiva.

En caso de progresión incipiente de la insuficiencia cardíaca o de retención de líquidos, deberá tratarse aumentando o iniciando la dosis de diuréticos, aunque en algunas ocasiones pudiera ser necesario disminuir la dosis o suspenderlo temporalmente. Si la suspensión es por más de dos semanas, el tratamiento deberá reiniciarse de nuevo con 3.125 mg cada 12 horas y aumentar progresivamente la dosis de la forma descrita anteriormente. Los síntomas de vasodilatación pueden ser inicialmente manejados reduciendo la dosis del diurético. Si persisten los síntomas, pueden reducirse la dosis del inhibidor de la enzima convertidora de angiotensina seguida de la administración de la dosis del producto si fuera necesario. Bajo las circunstancias anteriores la dosis del producto no deberá incrementarse hasta haberse estabilizado los síntomas de progresión de la insuficiencia cardíaca de vasodilatación.

ADVERTENCIA:

Usar por prescripción médica

Mantener fuera del alcance de los niños

Conservar en lugar fresco y seco entre 25 – 30 °C

PRESENTACIÓN:

Carbaline 6.25 mg caja por 30 comprimidos

Carbaline 12.5 mg caja por 30 comprimidos

Carbaline 25 mg caja por 25 comprimidos

REG. SAN. REP. DOM.:

Carbaline 6.25 mg: 2010-0246

Carbaline 12.5 mg: 2012-0858

Carbaline 25 mg: 2012-0969

Actualizado: OCTUBRE / 2015
NM



Fabricado por:

Laboratorios ALFA, SRL

República Dominicana

www.laboratoriosalfa.com

Reg. Industrial: 13880