

TALLITON®

M. Gajdoš

Tabletky TALLITON®, produkt farmaceutickej spoločnosti EGIS Pharmaceuticals Plc, Budapešť v zastúpení EGIS Slovakia, spol. s r.o. predstavujú liek s účinnou látkou karvedilol, ktorá patrí podľa ATC klasifikácie do skupiny blokátorov α - a β -adrenergických receptorov. Karvedilol v prípravku TALLITON® je vyrábaný novou, Európskym patentom chránenou výrobnou technológiou [1], odlišnou od originálnej technológie používanej pri výrobe iných prípravkov s obsahom rovnakej účinnej látky. Táto technológia je zárukou hospodárnej výroby čistej, kvalitnej a vysoko stabilnej účinnej látky, čo potvrdili výsledky priameho porovnania farmaceutickej kvality generických prípravkov s obsahom karvedilolu, vyrábaných 20 farmaceutickými spoločnosťami, s originálnym Dilatrendom [2]. Za vývoj tejto technológie bola farmaceutická spoločnosť EGIS v roku 2003 ocenená Veľkou cenou Ministerstva hospodárstva a dopravy Maďarskej republiky za inováciu.

Základným mechanizmom účinku karvedilolu je súčasná neselektívna blokáda β -receptorov a selektívna blokáda α_1 -receptorov, ktorá vedie, na rozdiel od izolovanej blokady len β -receptorov (čisté β -blokátory) alebo len α -receptorov (čisté α -blokátory), k žiadúcej potenciácii výhodných, resp. potlačeniu niektorých, týmito receptormi sprostredkovaných, nevýhodných účinkov u cieľových pacientov. Selektívna blokáda α_1 -receptorov, s následným znížením celkovej periférnej

cievnej rezistencie, vedie k vazodilatácii, zníženiu preloadu a poklesu krvného tlaku bez významného ovplyvnenia srdcového výdaja. Blokáda kardiálnych β_1 -receptorov vedie k zníženiu srdcovej frekvencie (negatívne chronotropný účinok) a následnému zníženiu krvného tlaku. Kombinovaný účinok prináša aj ďalší benefit. Neselektívna blokáda β_1 - a β_2 -receptorov potláča nežiadúcu reflexnú tachykardiu spôsobenú blokádou α_1 -receptorov. Naopak, blokáda α_1 -receptorov vedie k vazodilatácii a bráni vazokonstrikcii vyvolanej blokádou β_2 -receptorov, i nadmernému nežiadúcemu zníženiu srdcovej frekvencie. Blokáda α_1 -receptorov zároveň účinne potláča nepriaznivé dôsledky blokady β_2 -receptorov na parametre glycidového a lipidového metabolizmu. Významné sú aj antioxidantné a antiproliferatívne účinky karvedilolu, ktoré s veľkou pravdepodobnosťou tiež významne prispievajú k jeho anti-sklerotickým a orgánovoprotektívnym účinkom [3-5]. Na základe farmakologických vlastností, potvrdených viacerými kontrolovanými klinicko-terapeutickými štúdiami, je podávanie karvedilolu indikované u pacientov s hypertenziou, chronickou angínou pectoris [6] a srdcovým zlyhávaním [7]. Vzhľadom na svoje výhodné vazodilatačné, antioxidantné a metabolické účinky prináša významný zdravotný benefit aj hypertonikom s rozvinutou aterosklerózou, diabetom [8,9], dyslipoproteínmiou [9] a obličkovými ochoreniami [10-11]. V prípade potreby je karvedilol

možné kombinovať prakticky so všetkými farmakologickými skupinami antihypertenzív (okrem α - a β -blokátorov).

Literatúra

1. European Patent Specification 0 918 055 B1. Bulletin 2003/17; printed by Jouve, Paris.
2. Smith JC, Tarocco G, Ferazzi F, Salzmann U. Are generic formulations of carvedilol of inferior pharmaceutical quality compared with the branded formulation? *Curr Med R* 2006; 2: 709-720.
3. Sporer G, Bartsch W, Strein K et al. Pharmacological profile of carvedilol as a beta-blocking agent with vasodilating and hypotensive properties. *J Cardiovasc Pharmacol* 1987; 9: 317-327.
4. Tanaka M, Masumura H, Tanaka S, Akashi A. Studies on the antihypertensive properties of carvedilol, a compound with beta-blocking and vasodilating effects. *J Cardiovasc Pharmacol* 1987; 10: 52-57.
5. Ruffolo RR, Gellai M, Hieble JP et al. The pharmacology of carvedilol. *Eur J Clin Pharmacol* 1990; 38: 82-88.
6. The CAPRICORN investigators. Effect of carvedilol on outcome after myocardial infarction in patients with left-ventricular dysfunction. The CAPRICORN randomised trial. *Lancet* 2001; 357: 1385-1390.
7. Keting MG, Jarvis B. Carvedilol. A review of its use in chronic heart failure. *Drugs* 2003; 63: 1697-1741.
8. Bakris GL, Fonseca V, Katholi RJ et al. Metabolic effects of carvedilol vs metoprolol in patients with type 2 diabetes mellitus and hypertension. *JAMA* 2004; 292: 2227-2236.
9. Gajdoš M, Spustová V, Šmíd J et al. Carvedilol does not impair either insulin sensitivity or dyslipoproteinemia in essential hypertension. *Cor Vasa* 1999; 41: 11-15.
10. Fassbinder W, Quarder O, Waltz A et al. Treatment with carvedilol is associated with significant reduction in microalbuminuria: A multicenter randomised study. *Intern J Cardiovasc Pharmacol* 1999; 53: 519-522.
11. Marchi F, Ciriello G. Efficacy of carvedilol in mild to moderate essential hypertension and effects on microalbuminuria: a multicentre, randomized, open-label, controlled study versus atenolol. *Adv Ther* 1995; 12: 212-221.

Doc. MUDr. Martin Gajdoš, Ph.D.

Oddelenie klinickej a experimentálnej farmakoterapie
Slovenská zdravotnícka univerzita, Bratislava

WWW.EGIS.SK