Микардис



Код АТХ:

- C09CA07

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Телмисартан

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки белого или почти белого цвета, продолговатые, с гравировкой "51H" на одной стороне и символом фирмы - на другой стороне.

	1 таб.
телмисартан	40 мг

Вспомогательные вещества: натрия гидроксид - 3.36 мг, поливидон (коллидон 25) - 12 мг, меглюмин - 12 мг, сорбитол - 168.64 мг, магния стеарат - 4 мг.

7 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.

Таблетки белого или почти белого цвета, продолговатые, с гравировкой "52H" на одной стороне и символом фирмы - на другой стороне.

	1 таб.
телмисартан	80 мг

Вспомогательные вещества: натрия гидроксид - 6.72 мг, поливидон (коллидон 25) - 24 мг, меглюмин - 24 мг, сорбитол - 337.28 мг, магния стеарат - 8 мг.

7 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (4) - пачки картонные.
7 шт. - блистеры (8) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антигипертензивный препарат. Телмисартан - специфический антагонист рецепторов ангиотензина II. Обладает высоким сродством к подтипу AT_1-рецепторов ангиотензина II, через который реализуется действие ангиотензина II. Телмисартан вытесняет ангиотензин II из связи с рецептором, не обладая действием агониста в отношении этого рецептора. Образует связь только с подтипом AT_1-рецепторов ангиотензина II. Связывание носит длительный характер. Телмисартан не обладает сродством к другим рецепторам (в т.ч. к AT_2-рецепторам) и другим, менее изученным рецепторам ангиотензина. Функциональное значение этих рецепторов, а также эффект их возможной избыточной стимуляции ангиотензином II, концентрация которого увеличивается при назначении телмисартана, не изучены. Снижает концентрацию альдостерона в крови, не ингибирует ренин в плазме крови и не блокирует ионные каналы. Не ингибирует АПФ (кининазу II), фермент, который также разрушает брадикинин, поэтому усиление вызываемых брадикинином побочных эффектов не ожидается.

Телмисартан в дозе 80 мг полностью блокирует гипертензивное действие ангиотензина II. Начало гипотензивного действия отмечается в течение 3 ч после первого приема телмисартана. Действие препарата сохраняется в течение 24 ч и остается значимым до 48 ч. Выраженный гипотензивный эффект обычно развивается через 4-8 недель регулярного приема.

У пациентов с артериальной гипертензией телмисартан снижает систолическое и диастолическое АД, не оказывая влияния на ЧСС.

В случае резкой отмены телмисартана АД постепенно возвращается к исходному уровню без развития синдрома отмены.

Фармакокинетика

Всасывание

При приеме внутрь телмисартан быстро всасывается из ЖКТ. Биодоступность - 50%.

При приеме одновременно с пищей снижение значений AUC колеблется от 6% (при применении в дозе 40 мг) до 19% (при применении в дозе 160 мг). Спустя 3 ч после приема концентрация в плазме крови выравнивается независимо от времени приема пищи.

Распределение

Связывание с белками плазмы крови - более 99.5%, в основном с альбумином и α_1-гликопротеином. Среднее значение видимого V_d в равновесном состоянии - 500 л.

Метаболизм

Метаболизируется путем конъюгирования с глюкуроновой кислотой. Метаболиты фармакологически не активны.

Выведение

$T_{1/2}$ - более 20 ч. Выводится через кишечник в неизмененном виде, выведение почками - менее 2% от принятой дозы. Общий плазменный клиренс высокий (900 мл/мин) по сравнению с печеночным кровотоком (около 1500 мл/мин).

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Наблюдается разница в концентрациях у мужчин и женщин. У женщин C_{max} и AUC были приблизительно в 3 и 2 раза соответственно выше, чем у мужчин (без значимого влияния на эффективность).

Фармакокинетика телмисартана у пациентов пожилого возраста не отличается от фармакокинетики у молодых пациентов. Коррекции доз не требуется.

Изменение дозы у пациентов с почечной недостаточностью не требуется, включая пациентов, находящихся на гемодиализе. Телмисартан не удаляется с помощью гемодиализа.

У пациентов с нарушениями функции печени легкой и средней степени (класс А и В по шкале Чайлд-Пью) суточная доза препарата не должна превышать 40 мг.

Основные показатели фармакокинетики телмисартана у детей и подростков в возрасте от 6 до 18 лет после приема телмисартана в дозе 1 мг/кг или 2 мг/кг в течение 4 недель, в целом, сопоставимы с данными, полученными при лечении взрослых, и подтверждают нелинейность фармакокинетики телмисартана, особенно в отношении C_{max}.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия;

— снижение сердечно-сосудистой заболеваемости и смертности у пациентов в возрасте 55 лет и старше с высоким риском сердечно-сосудистых заболеваний.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия

Противопоказания:

— обструктивные заболевания желчевыводящих путей;

— выраженные нарушения функции печени (класс С по шкале Чайлд-Пью);

— первичный альдостеронизм;

— наследственная непереносимость фруктозы (содержит сорбитол);

— возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

— беременность;

— период лактации;

— повышенная чувствительность к телмисартану и другим компонентам препарата.

С *осторожностью*

— двусторонний стеноз почечных артерий или стеноз артерии единственной почки;

— нарушения функции печени и/или почек;

— снижение ОЦК вследствие предшествующей диуретической терапии, ограничения приема поваренной соли, диареи или рвоты;

— гипонатриемия;

— гиперкалиемия;

— состояния после трансплантации почки (опыт применения отсутствует);

— хроническая сердечная недостаточность;

— стеноз аортального и митрального клапана;

— идиопатический гипертрофический субаортальный стеноз;

— ИБС.

Способ применения и дозы:

Препарат назначают внутрь, независимо от приема пищи.

При *артериальной гипертензии* рекомендуемая начальная доза препарата Микардис составляет 1 таб. (40 мг) 1 раз/сут. В случаях, когда терапевтический эффект не достигается, доза препарата может быть увеличена до 80 мг 1 раз/сут. При решении вопроса об увеличении дозы следует принимать во внимание, что максимальный антигипертензивный эффект обычно достигается в течение 4-8 недель после начала лечения.

Для *снижения сердечно-сосудистой заболеваемости и смертности* рекомендованная доза - 1 таб. (80 мг) 1 раз/сут. В начальный период лечения может потребоваться дополнительная коррекция АД.

Пациентам с почечной недостаточностью (в т.ч. находящимся на гемодиализе) коррекции дозы препарата не требуется.

У **пациентов с нарушениями функции печени легкой и средней степени (класс А и В по шкале Чайлд-Пью)** суточная доза препарата не должна превышать 40 мг.

Режим дозирования у **пациентов пожилого возраста** не требует изменений.

Побочное действие:

Наблюдаемые случаи побочных эффектов не коррелировали с полом, возрастом или расовой принадлежностью пациентов.

Инфекции: сепсис, включая сепсис с летальным исходом, инфекции мочевыводящих путей (включая цистит), инфекции верхних дыхательных путей.

Со стороны системы кроветворения: анемия, эозинофилия, тромбоцитопения, снижение концентрации гемоглобина.

Со стороны ЦНС: бессонница, тревожность, депрессия, обморок, вертиго.

Со стороны органа зрения: зрительные расстройства.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: выраженное снижение АД, ортостатическая гипотензия, брадикардия, тахикардия.

Со стороны дыхательной системы: одышка.

Со стороны пищеварительной системы: боль в животе, диарея, сухость во рту, диспепсия, метеоризм, дискомфорт в области желудка, рвота, нарушения функции печени/заболевания печени* (*по результатам постмаркетинговых наблюдений, в большинстве случаев нарушения функции печени/заболевания печени были выявлены у пациентов Японии), повышение активности печеночных ферментов.

Аллергические реакции: анафилактические реакции, повышенная чувствительность (эритема, крапивница, ангионевротический отек), экзема, кожный зуд, сыпь (в т.ч. лекарственная), ангионевротический отек (со смертельным исходом), токсическая сыпь.

Со стороны кожи и подкожных тканей: гипергидроз.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, боль в спине, спазмы мышц (судороги икроножных мышц), боль в нижних конечностях, миалгия, боль в сухожилиях (симптомы, схожие с проявлением тендинита).

Со стороны мочевыделительной системы: нарушение функции почек (включая острую почечную недостаточность), повышение концентрации мочевой кислоты, креатинина в крови.

Лабораторные показатели: гиперкалиемия, повышение уровня КФК крови, гипогликемия (у пациентов с сахарным диабетом).

Прочие: боль в грудной клетке, гриппоподобный синдром, астения (слабость).

Передозировка:

Случаи передозировки не выявлены.

Симптомы: выраженное снижение АД, тахикардия, брадикардия.

Лечение: проведение симптоматической терапии. Гемодиализ неэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата Микардис противопоказано при беременности.

Использование антагонистов рецепторов ангиотензина II в I триместре беременности не рекомендуется, эти препараты не следует назначать при беременности. При диагностировании беременности применение препарата следует немедленно прекратить. При необходимости следует назначить альтернативную терапию (другие классы гипотензивных препаратов, разрешенных к применению при беременности).

Применение антагонистов рецепторов ангиотензина II во II и III триместрах беременности противопоказано. В

доклинических исследованиях телмисартана тератогенных влияний выявлено не было, но установлена фетотоксичность. Известно, что воздействие антагонистов рецепторов ангиотензина II во II и III триместрах беременности вызывает у человека фетотоксичность (снижение функции почек, олигогидрамнион, замедление оссификации черепа), а также неонатальную токсичность (почечная недостаточность, артериальная гипотензия, гиперкалиемия).

Пациенткам, планирующим беременность, следует назначать альтернативную терапию. Если лечение антагонистами рецепторов ангиотензина II проводилось во II триместре беременности, рекомендуется проведение УЗИ почек и костей черепа у плода.

Новорожденных, матери которых получали антагонисты рецепторов ангиотензина II , следует тщательно наблюдать в отношении артериальной гипотензии.

Терапия препаратом Микардис противопоказана в период грудного вскармливания.

Исследования влияния на фертильность человека не проводились.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Телмисартан может увеличивать гипотензивный эффект других антигипертензивных средств. Другие виды взаимодействия, имеющие клиническую значимость, не выявлены.

Сочетанное применение с дигоксином, варфарином, гидрохлоротиазидом, глибенкламидом, ибупрофеном, парацетамолом, симвастатином и амлодипином не приводит к клинически значимому взаимодействию. Отмечено увеличение средней концентрации дигоксина в плазме крови в среднем на 20% (в одном случае на 39%). При одновременном назначении телмисартана и дигоксина целесообразно периодическое определение концентрации дигоксина в крови.

При одновременном использовании телмисартана и рамиприла наблюдалось повышение AUC_{0-24} и C_{max} рамиприла и рамиприлата в 2.5 раза. Клиническая значимость этого явления не установлена.

При одновременном назначении ингибиторов АПФ и препаратов лития отмечалось обратимое увеличение концентрации лития в крови, сопровождающееся токсическим действием. В редких случаях подобные изменения зарегистрированы при назначении антагонистов рецепторов ангиотензина II. При одновременном назначении препаратов лития и антагонистов рецепторов ангиотензина II рекомендуется проводить определение концентрации лития в крови.

Лечение НПВС, включая ацетилсалициловую кислоту, ингибиторы ЦОГ-2 и неселективные НПВС, может вызвать развитие острой почечной недостаточности у пациентов с обезвоживанием. Препараты, действующие на РААС, могут обладать синергическим эффектом. У пациентов, получающих НПВС и телмисартан, в начале лечения следует компенсировать ОЦК и провести исследование функции почек.

Снижение эффекта антигипертензивных средств, таких как телмисартан, посредством ингибирования сосудорасширяющего эффекта простагландинов отмечалось при одновременной терапии с НПВС.

Особые указания и меры предосторожности:

У некоторых пациентов вследствие подавления РААС, особенно при использовании комбинации средств, действующих на эту систему, нарушается функция почек (включая острую почечную недостаточность). Поэтому терапия, сопровождающаяся подобной двойной блокадой РААС (например, при добавлении ингибиторов АПФ или прямого ингибитора ренина - алискирена к блокаторам антагонистов рецепторов ангиотензина II), должна проводиться строго индивидуально и при тщательном контроле функции почек (в т.ч. периодический мониторинг концентрации калия и креатинина в сыворотке).

В случаях зависимости сосудистого тонуса и функции почек преимущественно от активности РААС (например, у пациентов с хронической сердечной недостаточностью или заболеваниями почек, в т.ч. при стенозе почечных артерий или стенозе артерии единственной почки), назначение препаратов, влияющих на эту систему, может сопровождаться развитием острой артериальной гипотензии, гиперазотемии, олигурии, и, в редких случаях, острой почечной недостаточностью.

Основываясь на опыте применения других препаратов, влияющих на РААС, при одновременном назначении препарата Микардис и калийсберегающих диуретиков, калийсодержащих добавок, калийсодержащей пищевой соли, других средств, повышающих концентрацию калия в крови (например, гепарина), следует контролировать этот показатель у пациентов.

У пациентов с сахарным диабетом и дополнительным сердечно-сосудистым риском, например, у пациентов с сахарным диабетом и ИБС, в случае применения препаратов, снижающих АД, таких как антагонисты рецепторов ангиотензина II или ингибиторы АПФ, может повышаться риск фатального инфаркта миокарда и внезапной сердечно-сосудистой смерти. У пациентов с сахарным диабетом ИБС может протекать бессимптомно и поэтому может быть

недиагностированной. Перед началом применения препарата Микардис для выявления и лечения ИБС следует проводить соответствующие диагностические исследования, в т.ч. пробу с физической нагрузкой.

В качестве альтернативы препарат Микардис может использоваться в комбинации с тиазидными диуретиками, такими как гидрохлоротиазид, которые дополнительно оказывают гипотензивный эффект (например, препарат Микардис Плюс 40 мг/12.5 мг, 80 мг/12.5 мг).

У пациентов с тяжелой степенью артериальной гипертензии доза телмисартана 160 мг/сут в комбинации с гидрохлоротиазидом 12.5-25 мг была эффективна и хорошо переносилась.

Нарушения функции печени при назначении телмисартана в большинстве случаев наблюдались у жителей Японии.

Микардис менее эффективен у пациентов негроидной расы.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Специальных клинических исследований влияния препарата на способность управлять автомобилем и механизмами не проводилось. Однако при управлении автомобилем и работе с механизмами следует принимать во внимание возможность развития головокружения и сонливости, что требует соблюдения осторожности.

При нарушениях функции почек

Пациентам с почечной недостаточностью (в т.ч. находящимся на гемодиализе) коррекции дозы препарата не требуется.

С осторожностью следует применять препарат при двустороннем стенозе почечных артерий или стенозе артерии единственной почки, нарушении функции почек, состоянии после трансплантации почки.

При нарушениях функции печени

Противопоказано применение препарата при нарушениях проходимости желчевыводящих путей, выраженных нарушениях функции печени (класс С по шкале Чайлд-Пью).

У **пациентов с нарушениями функции печени легкой и средней степени (класс А и В по шкале Чайлд-Пью)** суточная доза препарата не должна превышать 40 мг.

Применение в пожилом возрасте

Режим дозирования у **пациентов пожилого возраста** не требует изменений.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан к применению у детей и подростков в возрасте до 18 лет, т.к. данные об эффективности и безопасности у этой категории пациентов отсутствуют.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, защищенном от влаги месте при температуре не выше 30°С.

Срок годности:

4 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Mikardis