Навитен



Код АТХ:

- C09CA02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Эпросартан

Полезные ссылки:

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антигипертензивное средство, синтетический антагонист рецепторов ангиотензина II, небифениловое производное тетразола.

Эпросартан избирательно связывается с AT_1-рецепторами, расположенными в сосудах, сердце, почках и коре надпочечников, образует с ними прочную связь с последующей медленной диссоциацией.

Ангиотензин II связывается с AT_1-рецепторами во многих тканях (в т.ч. в гладкой мускулатуре сосудов, надпочечниках, почках, сердце) и вызывает вазоконстрикцию, задержку натрия и высвобождение альдостерона, поражение органов-мишеней - гипертрофию миокарда и сосудов.

Эпросартан предупреждает развитие или ослабляет эффекты ангиотензина II. Угнетает активность РААС. Оказывает вазодилатирующее, гипотензивное и опосредованно - диуретическое действие.

Уменьшает артериальную вазоконстрикцию, ОПСС, давление в малом круге кровообращения, реабсорбцию жидкости и ионов натрия в проксимальном сегменте почечных канальцев, секрецию альдостерона. При длительном применении подавляет пролиферативное влияние ангиотензина II на клетки гладких мышц сосудов и миокарда.

У пациентов с артериальной гипертензией эпросартан не влияет на концентрации ТГ, общего холестерина (Хс) или Хс-ЛПНП в крови, определяемых натощак. Кроме того, эпросартан не влияет на концентрацию глюкозы в крови натощак.

Увеличивает почечный кровоток и скорость клубочковой фильтрации, уменьшает выведение альбуминов (нефропротекторное действие), при сохранении почечной саморегуляции вне зависимости от степени выраженности почечной недостаточности.

Прекращение лечения эпросартаном не сопровождается синдромом отмены.

Эпросартан не угнетает изоферменты CYP1A, 2A6, 2C9/8, 2C19, 2D6, 2E и 3A in vitro.

Гипотензивное действие после приема однократной дозы сохраняется в течение 24 ч, стойкий терапевтический эффект проявляется при регулярном приеме - через 2-3 недели без изменения ЧСС.

Фармакокинетика

После приема внутрь разовой дозы 300 мг биодоступность составляет примерно 13%. При приеме эпросартана одновременно с пищей наблюдается клинически незначимое снижение абсорбции (менее 25%), C_{max} в плазме крови и значения AUC. C_{max} достигается через 1-2 ч. Связывание с белками плазмы составляет 98% и имеет постоянный характер в диапазоне терапевтических концентраций. Выделяется с грудным молоком. V_d – 13 л, общий клиренс – 130 мл/мин. Практически не кумулирует. $T_{1/2}$ составляет 5-9 ч. Выводится в основном в неизмененном виде - через кишечник (90%), почками (7%). Незначительная часть (менее 2%) выводится почками в виде глюкуронидов. 20% от концентрации в моче составляет ацилглюкуронид эпросартана, 80% - неизмененный эпросартан.

У лиц пожилого возраста значения C_{max} и AUC возрастают в среднем в 2 раза, что не требует коррекции режима дозирования. При хронической почечной недостаточности средней степени тяжести (КК от 30 до 59 мл/мин) величины AUC и C_{max} на 30%, а при тяжелой степени (КК от 5 до 29 мл/мин) - на 50% выше по сравнению со здоровыми людьми. При печеночной недостаточности после приема внутрь разовой дозы AUC (но не C_{max}) возрастает почти на 40% по сравнению со здоровыми людьми. Практически не выводится при гемодиализе (клиренс - менее 1 л/ч).

Показания к применению:

Лечение артериальной гипертензии.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия

Противопоказания:

Гемодинамически значимый двусторонний стеноз почечных артерий и стеноз артерии единственной почки; беременность; период лактации (грудного вскармливания); детский и подростковый возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены); повышенная чувствительность к эпросартану.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь независимо от приема пищи. Рекомендуемая доза составляет 600 мг 1 раз/сут утром. Максимальный антигипертензивый эффект развивается, как правило, через 2-3 недели лечения.

Эпросартан применяют как в виде монотерапии, так и в составе комбинированной терапии (в т.ч. с тиазидными диуретиками, блокаторами кальциевых каналов).

Для пациентов с почечной недостаточностью при КК менее 60 мл/мин суточная доза не должна превышать 600 мг.

Побочное действие:

Со стороны неврной системы: очень часто - головная боль; часто - головокружение, астения.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - выраженное снижение АД.

Со стороны дыхательной системы: ринит.

Со стороны кожных покровов и подкожно-жировой клетчатки: часто -

Со стороны пищеварительной системы: часто - неспецифические жалобы со стороны ЖКТ (например, тошнота, диарея, рвота).

Со стороны мочеполовой системы: нарушение функции почек, в т.ч. острая почечная недостаточность, особенно у пациентов группы риска (например, со стенозом почечной артерии).

Аллергические реакции: кожные проявления (в т.ч. кожная сыпь, зуд); нечасто - ангионевротический отек (в т.ч. лица, губ, языка, глотки).

Со стороны иммунной системы: нечасто - гиперчувствительность.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано применение при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Эпросартан можно применять в сочетании с тиазидными диуретиками (в т.ч. с гидрохлоротиазидом) и блокаторами медленных кальциевых каналов (в т.ч. нифедипином пролонгированного действия), не ожидая клинически значимого нежелательного взаимодействия, при этом происходит взаимное усиление гипотензивного эффекта.

При одновременном применении эпросаратана с калийсберегающими диуретиками, пищевыми добавками, содержащими калий, заменителями поваренной соли, содержащими калий и другими препаратами, повышающими уровень калия в сыворотке крови (например, гепарином) возможно повышение уровня калия в сыворотке крови. Во время лечения препаратами, воздействующими на РААС возможно развитие гиперкалиемии, особенно, у пациентов с почечной и/или печеночной недостаточностью.

Антигипертензивное действие эпросартана может быть потенцировано другими антигипертензивными средствами.

Известны случаи обратимого повышения концентрации лития в сыворотке крови и развития токсических реакций при одновременном приеме препаратов лития с ингибиторами АПФ. Нельзя исключать возможность развития подобного эффекта после приема эпросартана (при данной комбинации рекомендуется контроль концентрации лития в плазме крови).

При одновременном применении эпросартана с НПВС имеется вероятность ухудшения функции почек, включая риск развития острой почечной недостаточности, и повышения уровня калия в сыворотке крови, особенно у пациентов с уже имеющимся нарушением функции почек (данные комбинации следует применять с осторожностью, особенно у пациентов пожилого возраста; рекомендуется контроль функции почек).

Особые указания и меры предосторожности:

Не рекомендуется применять для лечения пациентов с первичным гиперальдостеронизмом.

С осторожностью применять при тяжелой хронической сердечной недостаточности (IV функционального класса по классификации NYHA); снижении ОЦК и/или избыточном выведении хлорида натрия из организма (в т.ч. в результате рвоты, диареи, приема диуретиков в высоких дозах); у пациентов, находящихся на гемодиализе или с КК менее 30 мл/мин; при стенозе аортального и митрального клапанов, а также при гипертрофической кардиомиопатии.

С особой осторожностью применять у пациентов с нарушением функции печени и ИБС, в связи с недостаточным клиническим опытом применения у данных категорий пациентов.

Не имеется данных о применении эпросартана у пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности и недавно выполненной трансплантацией почек.

При нарушениях функции почек

У пациентов, функция почек которых зависит от активности ренин-ангиотензин-альдостероновой системы (например, при тяжелой сердечной недостаточности, двустороннем стенозе почечных артерий или стенозе почечной артерии единственной почки), во время лечения ингибиторами АПФ развивается олигурия и/или прогрессирующая азотемия, а в редких случаях - острая почечная недостаточность.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском возрасте.

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