Телсартан



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

Форма выпуска:

Таблетки 40 мг, 80 мг.

По 7 табл. в блистере из ПВХ/алюминиевой/полиамидной фольги/алюминиевой фольги. По 2 или 4 бл. в пачке картонной.

По 10 табл. в блистере из ПВХ/алюминиевой/полиамидной фольги/алюминиевой фольги. По 3 бл. в пачке картонной.

Состав:

Таблетки	1 табл.
активное вещество:	
телмисартан	40/80 мг
вспомогательные вещества: меглюмин — 12/24 мг; натрия гидроксид — 3,35/6,7 мг; повидон К30 — 12/24 мг; полисорбат 80 — 1,5/3 мг; маннитол — 216,05/432,1 мг; магния стеарат — 5,1/10,2 мг	

Описание:

Таблетки, 40 мг: капсуловидной формы, двояковыпуклые, белого или почти белого цвета, на одной стороне разделительная риска и тиснение «Т» и «L» по разные стороны от нее, на другой стороне тиснение «40».

Таблетки, 80 мг: капсуловидной формы, двояковыпуклые, белого или почти белого цвета, на одной стороне

разделительная риска и тиснение «T» и «L» по разные стороны от нее, на другой стороне тиснение «80».

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты

Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — гипотензивное, блокирующее AT_1-рецепторы.

Фармакодинамика

Телмисартан — специфический АРА II, эффективный при приеме внутрь. Обладает высоким сродством к подтипу AT_1-рецепторов ангиотензина II через которые реализуется действие ангиотензина II. Вытесняет ангиотензин II из связи с рецептором, не проявляя свойств агониста в отношении этого рецептора. Телмисартан связывается только с подтипом AT_1-рецепторов ангиотензина II. Связь носит длительный характер. 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. Телмисартан снижает концентрацию альдостерона в плазме крови, не ингибирует ренин в плазме крови и не блокирует ионные каналы. Телмисартан не ингибирует АПФ (кининаза II), который также катализирует деградацию брадикинина. Поэтому усиление вызываемых брадикинином побочных эффектов не ожидается.

У пациентов с артериальной гипертензией телмисартан в дозе 80 мг полностью блокирует гипертензивное действие ангиотензина II. Начало антигипертензивного действия отмечается в течение 3 ч после первого приема телмисартана внутрь. Действие препарата сохраняется в течение 24 ч и остается значимым до 48 ч. Выраженный антигипертензивный эффект обычно развивается через 4 нед после регулярного приема препарата.

У пациентов, страдающих артериальной гипертензией, телмисартан снижает сАД и дАД, не оказывая влияния на ЧСС.

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

В исследовании с телмисартаном проводилась оценка случаев сердечно-сосудистой смертности, нефатального инфаркта миокарда, нефатального инсульта или госпитализации по причине застойной сердечной недостаточности. Было доказано снижение сердечно-сосудистой заболеваемости и смертности у пациентов высокого сердечно-сосудистого риска (заболевания коронарных артерий, инсульт, заболевания периферических артерий или сахарный диабет с сопутствующим поражением органов-мишеней, таких как ретинопатия, гипертрофия левого желудочка, макро- или микроальбуминурия в анамнезе) старше 55 лет.

Фармакокинетика

При приеме внутрь быстро всасывается из ЖКТ. Биодоступность составляет 50%. При приеме одновременно с пищей снижение AUC колеблется от 6% (при дозе 40 мг) до 19% (при дозе 160 мг). Спустя 3 ч после приема концентрация в плазме выравнивается, независимо, принят ли он с пищей или натощак. Связь с белками плазмы составляет 99.5%. Средние значения кажущегося V_d в равновесной стадии – 500 л. Метаболизируется путем конъюгирования с глюкуроновой кислотой. Метаболиты фармакологически неактивны.

$T_{1/2}$ – более 20 ч. Выводится через кишечник в неизмененном виде. Кумулятивное выведение почками составляет менее 1%. Общий плазменный клиренс – 1000 мл/мин (почечный кровоток – 1500 мл/мин).

Показания к применению:

Артериальная гипертензия.

Относится к болезням:

- Гипертензия

Противопоказания:

Обструкция желчевыводящих путей, тяжелые нарушения функции печени и почек, беременность, период лактации (грудное вскармливание), повышенная чувствительность к телмисартану.

Способ применения и дозы:

Для взрослых суточная доза составляет 20-40 мг (1 раз/сут). У некоторых пациентов гипотензивный эффект может быть достигнут при дозе 20 мг/сут. При необходимости дозу можно увеличить до 80 мг/сут.

Пациентам с нарушением функции почек, а также пациентам пожилого возраста коррекции дозы не требуется.

Для пациентов с нарушениями функции печени суточная доза составляет 40 мг.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: головная боль, головокружение, утомляемость, бессонница, тревожность, депрессия, судороги.

Со стороны пищеварительной системы: боли в животе, диспепсия, тошнота, диарея, повышение активности печеночных трансаминаз.

Со стороны дыхательной системы: кашель, фарингит, инфекции верхних дыхательных путей.

Со стороны системы кроветворения: снижение уровня гемоглобина.

Аллергические реакции: сыпь; в единичном случае - ангионевротический отек.

Со стороны мочевыделительной системы: периферические отеки, инфекции мочевыводящих путей, повышение уровня мочевой кислоты, гиперкреатининемия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: выраженное снижение АД, сердцебиение, боль в груди.

Со стороны костно-мышечной системы: боль в пояснице, миалгия, артралгия.

Со стороны лабораторных показателей: гиперкалиемия, анемия, гиперурикемия.

Прочие: гриппоподобный синдром.

Передозировка:

Случаи передозировки не выявлены.

Симптомы: выраженное снижение АД, тахикардия, брадикардия.

Лечение: симптоматическая терапия; гемодиализ неэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Телмисартан противопоказан к применению при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с антигипертензивными препаратами возможно усиление антигипертензивного действия.

При одновременном применении с калийсберегающими диуретиками, гепарином, биологически активными добавками, заменителями соли, содержащими калий, возможно развитие гиперкалиемии.

При одновременном применении с препаратами лития возможно повышение концентрации лития в плазме крови.

При одновременном применении возможно повышение концентрации дигоксина в плазме крови.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют телмисартан при нарушениях функции печени, язвенной болезни желудка и

двенадцатиперстной кишки в стадии обострения, других заболеваниях ЖКТ, стенозе аорты и митрального клапана, обструктивной гипертрофической кардиомиопатии, ИБС, сердечной недостаточности.

У больных с двусторонним стенозом почечных артерий или стенозом почечной артерии единственной функционирующей почки применение телмисартана увеличивает риск развития тяжелой артериальной гипотензии и почечной недостаточности. Поэтому следует с осторожностью применяют телмисартан у данной категории пациентов.

В период применения телмисартана у больных с нарушениями функции почек необходимо контролировать содержание калия и креатинина в плазме крови.

В настоящее время отсутствуют данные о применении телмисартана у больных с недавно осуществленной пересадкой почек.

У пациентов с уменьшенным ОЦК и/или гипонатриемией может возникать симптоматическая артериальная гипотензия, особенно после приема первой дозы телмисартана. Поэтому перед проведением терапии необходима коррекция таких состояний.

Не рекомендуется применять телмисартан у пациентов с первичным альдостеронизмом, т.к. такие пациенты нечувствительны к препаратам, оказывающим действие на ренин-ангиотензиновую систему.

Применение телмисартана возможно в комбинации с тиазидными диуретиками, т.к. подобная комбинация обеспечивает дополнительное снижение АД.

При рассмотрении возможности увеличения дозы телмисартана следует помнить, что максимальный гипотензивный эффект обычно достигается через 4-8 недель после начала лечения.

Использование в педиатрии

Данные о безопасности и эффективности применения телмисартана у детей и подростков отсутствуют.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Вопрос о возможности занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстрых психомоторных реакций, следует решать только после оценки индивидуальной реакции на телмисартан.

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