Теветен

Код АТХ:

- C09CA02

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Эпросартан

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, овальные, двояковыпуклые, с гравировкой "5046" на одной стороне; на поперечном разрезе таблетки белого цвета.

	1 таб.
эпросартана мезилат	735.8 мг,
что соответствует содержанию эпросартана	600 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 43.3 мг, лактозы моногидрат - 43.3 мг, крахмал прежелатинизированный - 43.3 мг, кросповидон - 38.5 мг, магния стеарат - 7.2 мг, вода очищенная - 50.9 мг.

Состав оболочки: опадрай белый (OY-S-9603) - 38.5 мг (гипромеллоза - 23 мг, макрогол - 3.08 мг, полисорбат 80 - 0.39 мг, краситель титана диоксид (E171) - 12.03 мг).

14 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антигипертензивный препарат, антагонист рецепторов ангиотензина II.

Эпросартан избирательно действует на AT_1-рецепторы, расположенные 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 ренин-ангиотензин-альдостероновой системы (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.

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.

Не вызывает развитие ортостатической гипотензии в ответ на прием первой дозы препарата.

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.

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

Не влияет на пуриновый обмен, не оказывает значимого влияния на выведение мочевой кислоты почками.

Реже, чем ингибиторы АПФ, вызывает возникновение эффектов, связанных с брадикинином (в т.ч. сухого упорного кашля).

Частота случаев сухого, упорного кашля у пациентов, получающих эпросартан, - 1.5%. При замене ингибитора АПФ эпросартаном у пациентов с кашлем, частота сухого упорного кашля соответствует плацебо.

Прекращение лечения эпросартаном не сопровождается синдромом отмены.

Во время клинических исследований применение препарата в суточной дозе до 1200 мг в течение 8 недель было эффективным без видимой зависимости между дозой и частотой зарегистрированных побочных явлений.

Эпросартан не угнетает изоферменты CYP1A, 2A6, 2C9/8, 2C19, 2D6, 2E и 3A системы цитохрома P450 in vitro.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь в разовой дозе 300 мг биодоступность препарата составляет 13%. C_{max} эпросартана в плазме крови достигается через 1-2 ч.

При приеме эпросартана одновременно с пищей наблюдается клинически незначимое снижение абсорбции (менее 25%), C_{max} в плазме крови и значения AUC.

Распределение

Связывание с белками плазмы составляет 98% и имеет постоянный характер в диапазоне терапевтических концентраций.

V_d - 13 л. Практически не кумулирует.

Выведение

$T_{1/2}$ составляет 5-9 ч. Общий клиренс - 130 мл/мин.

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.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Степень связывания с белками плазмы не зависит от пола, возраста, наличия нарушений функции печени и не изменяется при незначительно выраженной или умеренной почечной недостаточности, но может снижаться при тяжелой почечной недостаточности.

У лиц моложе 18 лет фармакокинетика не изучена.

При применении эпросартана у пациентов с хронической почечной недостаточностью средней степени тяжести (КК от 30 до 59 мл/мин) значения AUC и C_{max} на 30% выше, а с тяжелой степенью (КК от 5 до 29 мл/мин) - на 50% выше по сравнению со здоровыми людьми.

При печеночной недостаточности значение AUC (но не C_{max}) возрастает, в среднем, на 40%, что не требует коррекции режима дозирования.

У лиц пожилого возраста значения C_{max} и AUC возрастают в среднем в 2 раза, что не требует коррекции режима дозирования.

Масса тела, половые и расовые различия не оказывают влияния на фармакокинетику эпросартрана.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия

Противопоказания:

— гемодинамически значимый двусторонний стеноз почечных артерий и стеноз артерии единственной почки;

— непереносимость лактозы, дефицит лактазы или синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции (препарат содержит лактозы моногидрат);

— беременность;

— период лактации;

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

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат 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.

Компания не располагает данными о безопасности применения препарата Теветен у пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности и недавно выполненной трансплантацией почек.

Теветен не рекомендуется применять для лечения пациентов с первичным гиперальдостеронизмом.

Следует соблюдать особую осторожность при назначении препарата Теветен для лечения пациентов с нарушением функции печени и ИБС, в связи с недостаточным опытом применения у данных категорий пациентов.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь, независимо от приема пищи.

Рекомендуемая доза составляет 1 таб. 1 раз/сут. Эпросартан можно применять как отдельно, так и в комбинации с другими антигипертензивными препаратами. Максимальное снижение АД у большинства пациентов достигается через 2-3 недели лечения.

Коррекции дозы не требуется для **больных пожилого возраста и пациентов с почечной недостаточностью легкой и умеренной степени тяжести (КК ≥ 30 мл/мин)**.

Для **пациентов с умеренной и тяжелой почечной недостаточностью (КК менее 60 мл/мин)** суточная доза не должна превышать 600 мг.

Побочное действие:

Чаще всего у пациентов, получавших эпросартан, сообщалось о таких побочных реакциях на препарат, как головная боль и неспецифичные жалобы на состояние со стороны пищеварительной системы, возникавших приблизительно у 11% и 8% пациентов, соответственно.

Частота побочных реакций, приведенных ниже, определялась соответственно следующему: очень часто (≥1/10); часто (>1/100, <1/10); нечасто (>1/1000, <1/100); редко (>1/10 000, <1/1000); очень редко (<1/10 000), включая отдельные сообщения.

Со стороны ЦНС: 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 - аллергические кожные реакции (например, кожная сыпь, зуд); нечасто - ангионевротический отек (в т.ч. лица, губ, языка, глотки).

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

Со стороны иммунной системы: нечасто - гиперчувствительность.

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

Передозировка:

Имеются лишь ограниченные данные о передозировке. Препарат хорошо переносится при приеме внутрь.

Симптомы: выраженное снижение АД.

Лечение: проведение симптоматической терапии.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Беременность

Препарат Теветен противопоказан к применению при беременности.

Пациентки, планирующие беременность, должны перейти на прием альтернативных антигипертензивных средств, обладающих установленными характеристиками безопасности для применения при беременности. Терапия препаратом Теветен должна быть прекращена немедленно после установления беременности, и в случае необходимости должна быть начата альтернативная терапия.

Известно, что терапия антагонистами рецепторов ангиотензина II во II и III триместрах беременности токсична для плода (ухудшение функции почек, маловодие, задержка оссификации костей черепа) и новорожденного (почечная недостаточность, артериальная гипотензия, гиперкалиемия). Если все же эпросартан применялся в период со II триместра беременности, рекомендуется проводить ультразвуковой контроль функции почек и состояния черепа плода.

Новорожденные, матери которых принимали эпросартан, должны тщательно наблюдаться на предмет выявления артериальной гипотензии.

Период лактации

По причине недостаточного количества данных о применении препарата Теветен в период кормления грудью, по возможности данный препарат следует заменить другими антигипертензивными лекарственными средствами, обладающими установленными профилями безопасности, особенно при вскармливании новорожденного или недоношенного ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Эпросартан не влияет на фармакокинетику дигоксина и фармакодинамику варфарина или глибенкламида.

Ранитидин, кетоконазол, флуконазол не влияют на фармакокинетику эпросартана.

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 значимых нежелательных взаимодействий, при этом происходит взаимное усиление гипотензивного эффекта.

Сочетанное применение Теветена с калийсберегающими диуретиками, пищевыми добавками, содержащими калий, заменителями поваренной соли, содержащими калий и другими препаратами, повышающими уровень калия в сыворотке крови (например, гепарином) может вызывать повышение уровня калия в сыворотке крови. Во время лечения препаратами, воздействующими на ренин-ангиотензин-альдостероновую систему возможно развитие гиперкалиемии, особенно, у пациентов с почечной и/или печеночной недостаточностью.

Антигипертензивное действие Теветена может быть потенцировано другими антигипертензивными препаратами.

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, в связи с этим рекомендуется контроль концентрации лития в плазме крови при одновременном приеме с эпросартаном.

Совместное применение с НПВС может привести к повышенному риску ухудшения функции почек, включая возможность развития острой почечной недостаточности, и повышению уровня калия в сыворотке крови, особенно у пациентов с уже имеющимся нарушением функции почек. Такие комбинации следует применять с осторожностью, особенно у пожилых пациентов. Пациентам рекомендовано проводить объемзаместительную терапию и контролировать функцию почек.

Особые указания и меры предосторожности:

Симптоматическая артериальная гипотензия

У пациентов со сниженным ОЦК (в результате терапии диуретиками), при ограничении потребления поваренной соли, при длительной и многократной рвоте прием препарата Теветен может вызывать развитие симптоматической артериальной гипотензии. Перед началом лечения препаратом Теветен необходимо провести коррекцию ОЦК.

Почечная недостаточность, тяжелая хроническая сердечная недостаточность

У пациентов, почечная функция которых зависит от активности РААС (например, при тяжелой хронической сердечной недостаточности IV функционального класса по классификации NYHA) во время лечения ингибиторами АПФ может развиться олигурия и/или прогрессирующая азотемия, и, в редких случаях, тяжелая почечная недостаточность.

В связи с недостаточным опытом применения антагонистов рецепторов ангиотензина II у пациентов с тяжелой хронической сердечной недостаточностью или стенозом почечной артерии единственной почки, нельзя исключить нарушения почечной функции на фоне применения препарата Теветен, вследствие подавления РААС.

Перед назначением препарата Теветен пациентам с почечной недостаточностью и, периодически, в процессе курса терапии следует контролировать функцию почек. Если в этот период наблюдается ухудшение почечной функции, следует пересмотреть целесообразность продолжения лечения препаратом Теветен.

Антагонисты ангиотензина снижают давление менее эффективно у пациентов негроидной расы, страдающих артериальной гипертензией, по причине более высокой распространенности состояний, характеризующихся низким уровнем ренина.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Влияние эпросартана на способность к управлению транспортным средством и работе с механизмами не изучалось, но на основании фармакодинамических свойств, можно говорить, что подобных влияний он не оказывает.

В период лечения препаратом Теветен необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, в связи с возможностью возникновения головокружения и слабости.

При нарушениях функции почек

Для пациентов с почечной недостаточностью тяжелой или средней степени тяжести (КК менее 60 мл/мин) суточная доза не должна превышать 600 мг.

Компания не располагает данными о безопасности применения препарата Теветен у пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности и недавно выполненной трансплантацией почек.

При нарушениях функции печени

Следует соблюдать особую осторожность при назначении препарата Теветен для лечения пациентов с нарушением функции печени, в связи с недостаточным опытом применения у данных категорий пациентов

Применение в пожилом возрасте

Коррекции дозы не требуется для больных пожилого возраста

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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