Валсафорс



Код АТХ:

- C09CA03

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Валсартан

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые оболочкой желтого цвета, круглые, двояковыпуклой формы.

	1 таб.
валсартан	80 мг
-"-	160 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, поливинилпирролидон низкомолекулярный (повидон), сахар молочный (лактоза), крахмал картофельный, аэросил (кремния диоксид коллоидный), тальк, магния стеарат, оксипропилметилцеллюлоза (гипромеллоза), титана диоксид, полиэтиленгликоль 4000 (макрогол), тропеолин О.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (1) - пачки картонные.
14 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
28 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
28 шт. - банки стеклянные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антагонист рецепторов ангиотензина II. Активным гормоном ренин-ангиотензин-альдостероновой системы (РААС) является ангиотензин II, который образуется из ангиотензина I при участии АПФ. Ангиотензин II связывается со специфическими рецепторами, расположенными на клеточных мембранах в различных тканях. Он имеет широкий спектр физиологических эффектов, включающих в первую очередь как непосредственное, так и опосредованное участие в регуляции АД. Являясь мощным сосудосуживающим веществом, ангиотензин II вызывает прямой

прессорный ответ. Кроме того, он способствует задержке натрия и стимулирует секрецию альдостерона.

Валсартан - специфический антагонист рецепторов ангиотензина II, предназначенный для приема внутрь. Оказывает антагонистическое действие избирательно на рецепторы подтипа AT_1, которые ответственны за известные эффекты ангиотензина II. Следствием блокады AT_1-рецепторов является повышение плазменной концентрации ангиотензина II, который может стимулировать незаблокированные AT_2-рецепторы. Не имеет сколько-нибудь выраженной агонистической активности в отношении AT_1-рецепторов. Сродство валсартана к рецепторам подтипа AT_1 примерно в 20 000 раз выше, чем к рецепторам подтипа AT_2.

При лечении валсартаном больных с артериальной гипертензией отмечается снижение АД, не сопровождающееся изменением частоты пульса. После назначения внутрь разовой дозы препарата у большинства больных начало антигипертензивного действия отмечается в пределах 2 ч, а максимум снижения АД достигается в пределах 4-6 ч. После приема препарата антигипертензивное действие сохраняется более 24 ч. При повторных назначениях препарата максимальное снижение АД, вне зависимости от принятой дозы, обычно достигается в пределах 2-4 недель и поддерживается на достигнутом уровне в ходе длительной терапии.

Внезапное прекращение приема валсартана не сопровождается резким повышением АД или другими нежелательными клиническими последствиями.

Фармакокинетика

После приема препарата внутрь всасывание валсартана происходит быстро, однако степень всасывания варьирует в широких пределах. Средняя величина абсолютной биодоступности валсартана составляет 23%.

Фармакокинетическая кривая имеет нисходящий мультиэкспоненциальный характер ($T_{1/2\alpha}$ - < 1 ч и $T_{1/2\beta}$ - около 9 ч).

В диапазоне изученных доз кинетика валсартана имеет линейный характер. При повторном применении препарата изменений кинетических показателей не отмечалось. При приеме препарата 1 раз/сут кумуляция незначительная. Концентрации препарата в плазме крови у женщин и мужчин были одинаковы.

Валсартан в значительной степени (на 94-97%) связывается с белками сыворотки крови, преимущественно с альбумином. V_d в период равновесного состояния низкий (около 17 л). По сравнению с печеночным кровотоком (около 30 л/ч), плазменный клиренс валсартана происходит относительно медленно (около 2 л/ч).

Количество валсартана, который выводится с калом, составляет 70% (от величины принятой внутрь дозы). С мочой выводится около 30%, преимущественно в неизмененном виде.

Фармакокинетика у отдельных групп больных

Больные пожилого возраста

У некоторых больных пожилого возраста системное воздействие валсартана было несколько более выраженным, чем у больных молодого возраста, однако, не было показано какой-либо клинической значимости этого.

Больные с нарушением функции почек

Не было выявлено корреляции между функцией почек и системным воздействием валсартана, что и следовало ожидать, учитывая, что для данного вещества почечный клиренс составляет только 30% от величины общего клиренса. Поэтому у больных с нарушением функции почек коррекции дозы препарата не требуется. Однако валсартан имеет высокую степень связывания с белками плазмы крови, поэтому его выведение при гемодиализе маловероятно.

Больные с нарушением функции печени

Около 70% от величины всосавшейся дозы препарата выводится с желчью, преимущественно в неизмененном виде. Валсартан не подвергается значительной биотрансформации, и, как можно ожидать, системное воздействие валсартана не коррелирует со степенью нарушений функции печени. Поэтому у больных с печеночной недостаточностью небилиарного происхождения и при отсутствии холестаза не требуется корректировки дозы препарата.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия;

— хроническая сердечная недостаточность (II-IV функциональный класс по классификации NYHA) у больных, получающих стандартную терапию, в т.ч. диуретиками, препаратами наперстянки, а также ингибиторами АПФ или бета-адреноблокаторами (не одновременно). Применение каждого из перечисленных препаратов не является обязательным.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Сердечная недостаточность

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата;

— беременность;

— период лактации;

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

С *осторожностью:* двусторонний стеноз почечных артерий, стеноз артерии единственной почки, при соблюдении диеты с ограничением натрия, при состояниях, сопровождающихся снижением ОЦК (в т.ч. диарея, рвота), печеночная недостаточность на фоне обструкции желчевыводящих путей, почечная недостаточность (КК менее 10 мл/мин), гемодиализ, хроническая сердечная недостаточность.

Способ применения и дозы:

Принимать таблетки внутрь, не разжевывая, независимо от приема пищи.

При *артериальной гипертензии*

Рекомендуемая доза составляет 80 мг 1 раз/сут. Антигипертензивный эффект развивается в течение 2 недель лечения; максимальный эффект отмечается через 4 недели. Тем больным, у которых не удается достичь адекватного снижения АД, суточная доза может быть увеличена до 160 мг или дополнительно назначены диуретические средства. Максимальная суточная доза составляет 320 мг.

Больным с нарушением функции почек или **больным с печеночной недостаточностью, не сопровождающейся холестазом**, изменений дозы препарата не требуется.

Валсафорс может назначаться также совместно с другими антигипертензивными средствами.

При *хронической сердечной недостаточности*

Рекомендуемая начальная доза составляет 40 мг 2 раза/сут. Возможно постепенное увеличение дозы до 80 мг 2 раза/сут, при хорошей переносимости - до 160 мг 2 раза/сут. Максимальная суточная доза - 320 мг, разделенная на 2 приема.

У пациентов, одновременно получающих диуретики, а также у пациентов с хронической сердечной недостаточностью необходим регулярный контроль функции почек, АД. При появлении клинических признаков артериальной гипотензии, необходимо уменьшить дозы.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: часто - головная боль, головокружение, в т.ч. постуральное, вертиго; нечасто - бессонница; иногда - обморок (при применении после перенесенного инфаркта миокарда).

Со стороны дыхательной системы: часто - кашель, инфекции верхних отделов дыхательных путей, фарингит, ринит, синусит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - выраженное снижение АД и ортостатическая гипотензия; иногда (при применении после перенесенного инфаркта миокарда) - сердечная недостаточность.

Со стороны ЖКТ: часто - тошнота, диарея, боль в животе.

Со стороны кожных покровов и подкожно-жировой клетчатки: редко - кожная сыпь.

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

Со стороны мочеполовой системы: нечасто - снижение либидо; очень редко - нарушение функции почек.

Аллергические реакции: очень редко - ангионевротический отек, кожная сыпь, зуд, реакции повышенной чувствительности, включая сывороточную болезнь и васкулит.

Со стороны лабораторных параметров: редко - снижение концентрации гемоглобина и гематокрита, нейтропения, тромбоцитопения, гиперкреатининемия, гипербилирубинемия, повышение активности печеночных трансаминаз, повышение сывороточного азота мочевины; часто - гиперкалиемия.

Прочие: часто - общая слабость; нечасто - отеки, астения, повышенная утомляемость.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД.

Лечение: если препарат был принят недавно, следует вызвать рвоту. При выраженном снижении АД - в/в введение физиологического раствора. Маловероятно, что валсартан можно вывести из организма при помощи гемодиализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан к применению при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Клинически значимого взаимодействия с такими лекарственными средствами, как циметидин, варфарин, фуросемид, дигоксин, атенолол, индометацин, гидрохлоротиазид, амлодипин и глибенкламид не выявлено.

Поскольку валсартан не подвергается сколько-нибудь существенному метаболизму, для него маловероятны клинически значимые взаимодействия с другими лекарственными средствами на уровне метаболизма, которые являются следствием индукции или ингибирования системы цитохрома P450.

Несмотря на то, что валсартан в значительной степени связывается с белками плазмы крови, не выявлено какого-либо значимого взаимодействия с диклофенаком, фуросемидом и варфарином.

Одновременное применение с калийсберегающими диуретиками (например, спиронолактон, триамтерен, амилорид), препаратами калия или солей, содержащих калий, может привести к увеличению концентрации калия в сыворотке крови. Если такое комбинированное лечение признано необходимым, следует соблюдать осторожность.

Особые указания и меры предосторожности:

Дефицит в организме натрия и/или сниженный ОЦК

У больных с выраженным дефицитом в организме натрия и/или сниженным ОЦК, например, получающих высокие дозы диуретиков, в редких случаях в начале лечения Валсафорсом может возникать клинически выраженная артериальная гипотензия.

Перед началом лечения следует провести коррекцию содержания в организме натрия и/или ОЦК, например, путем уменьшения дозы диуретика. В случае развития артериальной гипотензии, пациента следует уложить на спину, и, при необходимости, провести в/в инфузию физиологического раствора. После того, как АД стабилизируется, лечение можно продолжать.

Стеноз почечной артерии

Учитывая, что другие лекарственные средства, влияющие на РААС, могут вызывать повышение уровня мочевины и креатинина в сыворотке крови у больных с двусторонним или односторонним стенозом почечной артерии, в качестве меры предосторожности рекомендуется систематический контроль этих показателей.

Нарушения функции почек

Больным с нарушением функции почек не требуется корректировки дозы препарата. Однако, при выраженных нарушениях (КК менее 10 мл/мин) рекомендуется соблюдать осторожность.

Нарушения функции печени

У больных с печеночной недостаточностью не требуется корректировки дозы препарата. Валсартан выводится главным образом в неизмененном виде с желчью, однако у больных с обструкцией желчевыводящих путей клиренс валсартана снижен. При назначении препарата этим больным следует соблюдать особую осторожность.

Хроническая сердечная недостаточность

Вследствие угнетения РААС у чувствительных пациентов возможны изменения функции почек. У больных с тяжелой хронической сердечной недостаточностью лечение ингибиторами АПФ и антагонистами ангиотензиновых рецепторов может сопровождаться олигурией и/или нарастанием азотемии и (редко) острой почечной недостаточностью и/или смертельным исходом. Поэтому необходима оценка степени нарушения функции почек у пациентов с сердечной недостаточностью.

Влияние на способность водить автомашину и работать с механизмами

При назначении Валсафорса, также как и других антигипертензивных средств, рекомендуется соблюдать осторожность при вождении автомобиля и управлении механизмами, требующими повышенного внимания и скорости психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Больным с нарушением функции почек не требуется коррекции дозы препарата. Однако, при выраженных нарушениях (КК менее 10 мл/мин) рекомендуется соблюдать осторожность.

При нарушениях функции печени

У больных с печеночной недостаточностью не требуется коррекции дозы препарата. Валсартан выводится главным образом в неизмененном виде с желчью, однако у больных с обструкцией желчевыводящих путей клиренс валсартана снижен. При назначении препарата этим больным следует соблюдать особую осторожность .

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Список Б. Хранить в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С. Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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