Валсартан



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]

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антигипертензивное средство. Является специфическим антагонистом рецепторов ангиотензина II. Оказывает избирательное антагонистическое действие на AT_1-рецепторы, которые ответственны за реализацию эффектов ангиотензина II.

Вследствие блокады AT_1-рецепторов повышается плазменная концентрация ангиотензина II, который может стимулировать незаблокированные AT_2-рецепторы. Не обладает агонистической активностью в отношении AT_1-рецепторов. Сродство вальзартана к AT_1-рецепторам примерно в 20 000 раз выше, чем к AT_2-рецепторам.

Не ингибирует АПФ. Не взаимодействует и не блокирует рецепторы других гормонов или ионные каналы, имеющие важное значение для регуляции функций сердечно-сосудистой системы. Не оказывает влияния на уровень общего холестерина, ТГ, глюкозы и мочевой кислоты в плазме крови.

Начало антигипертензивного действия валсартана после его применения внутрь в однократной дозе наблюдается в течение 2 ч после приема, максимальный эффект достигается в течение 4-6 ч.

Фармакокинетика

После приема внутрь валсартан быстро абсорбируется из ЖКТ, степень всасывания характеризуется индивидуальными различиями. Абсолютная биодоступность в среднем составляет 23%. Фармакокинетическая кривая валсартана имеет мультиэкспоненциальный характер ($T_{1/2}$ в α-фазе < 1 ч и $T_{1/2}$ в β-фазе - около 9 ч), кинетика линейная.

При курсовом применении изменений фармакокинетических параметров не отмечалось.

При приеме валсартана с пищей AUC уменьшается на 48%, при этом примерно через 8 ч после приема концентрации валсартана в плазме одинаковы у пациентов, принимавших его с пищей и натощак. Уменьшение AUC не сопровождается клинически значимым уменьшением терапевтического эффекта.

При приеме валсартана 1 раз/сут кумуляция выражена незначительно. Концентрации валсартана в плазме крови у женщин и мужчин были одинаковы.

Связывание с белками плазмы, преимущественно с альбуминами, составляет 94-97%. V_d в равновесном состоянии составляет около 17 л.

Плазменный клиренс валсартана составляет около 2 л/ч. Выводится с калом - 70% и с мочой - 30%, преимущественно в неизмененном виде.

При билиарном циррозе или обструкции желчевыводящих путей AUC валсартана увеличивается приблизительно в 2 раза.

Показания к применению:

Лечение артериальной гипертензии.

Лечение хронической сердечной недостаточности (II-IV функциональный класс по классификации NYHA) у пациентов, получающих традиционную терапию диуретиками, препаратами наперстянки, а также ингибиторами АПФ или бета-адреноблокаторами.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Сердечная недостаточность

Противопоказания:

Беременность, повышенная чувствительность к валсартану.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь в дозе 80 мг 1 раз/сут или по 40 мг 2 раза/сут, ежедневно. При отсутствии адекватного эффекта суточная доза может быть постепенно увеличена.

Максимальная суточная доза составляет 320 мг в 2 приема.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: артериальная гипотензия, постуральное головокружение, постуральная гипотензия.

Со стороны ЦНС: головокружение, головная боль.

Со стороны пищеварительной системы: диарея, тошнота, повышение уровня билирубина.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - нарушение функции почек, повышение уровня креатинина и азота мочевины (особенно при хронической сердечной недостаточности).

Со стороны обмена веществ: гиперкалиемия.

Со стороны системы кроветворения: нейтропения, уменьшение гемоглобина и гематокрита.

Аллергические реакции: редко - ангионевротический отек, сыпь, зуд, сывороточная болезнь, васкулит.

Прочие: утомляемость, общая слабость, кашель, фарингит, повышение риска развития вирусных инфекций.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Валсартан противопоказан к применению при беременности.

Неизвестно, выделяется ли валсартан с грудным молоком у человека. Применение в период лактации (грудного вскармливания) не рекомендуется.

В *экспериментальных исследованиях* показано, что валсартан выделяется с грудным молоком у крыс.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении диуретиков в высоких дозах возможно развитие артериальной гипотензии.

При одновременном применении калийсберегающих диуретиков, гепарина, биологически активных добавок или заменителей соли, содержащих калий, возможно развитие гиперкалиемии.

При одновременном применении с индометацином возможно уменьшение антигипертензивного действия валсартана.

При одновременном применении с лития карбонатом описан случай развития интоксикации литием.

Особые указания и меры предосторожности:

При гипонатриемии и/или уменьшении ОЦК, а также на фоне терапии высокими дозами диуретиков в редких случаях валсартан может вызвать выраженную артериальную гипотензию. Перед началом лечения следует провести коррекцию нарушений водно-солевого обмена.

У пациентов с реноваскулярной гипертензией, развившейся вторично вследствие стеноза почечной артерии, в период лечения следует регулярно контролировать уровень мочевины и креатинина в сыворотке. Данные о безопасности применения у пациентов с КК менее 10 мл/мин отсутствуют.

С особой осторожностью применяют у пациентов с нарушениями проходимости желчных путей.

Вследствие ингибирования РААС у предрасположенных пациентов возможны изменения функции почек. При применении ингибиторов АПФ и антагонистов ангиотензиновых рецепторов у пациентов с хронической сердечной недостаточностью тяжелого течения наблюдались олигурия и/или нарастание азотемии, редко развивалась острая почечная недостаточность с риском летального исхода.

Безопасность и эффективность применения валсартана у детей не установлена.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

При применении вальзартана рекомендуется соблюдать осторожность при вождении автомобиля и управлении механизмами.

При нарушениях функции почек

У пациентов с реноваскулярной гипертензией, развившейся вторично вследствие стеноза почечной артерии, в период лечения следует регулярно контролировать уровень мочевины и креатинина в сыворотке. Данные о безопасности применения у пациентов с КК менее 10 мл/мин отсутствуют.

Вследствие ингибирования РААС у предрасположенных пациентов возможны изменения функции почек.

Применение в детском возрасте

Безопасность и эффективность применения валсартана у детей не установлена.

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