Валсартан-СЗ



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 пленочной оболочкой, 40 мг, 80 мг, 160 мг.

По 10, 14 или 30 табл. в контурной ячейковой упаковке. По 30 табл. в банке полимерной с крышкой или во флаконе полимерном с крышкой.

Каждую банку или флакон, 3, 6 контурных ячейковых упаковок по 10 табл., 2, 4, 6 контурных ячейковых упаковок по 14 табл. или 1, 2, 3 контурных ячейковых упаковок по 30 табл. помещают в картонную пачку.

Состав:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой	1 табл.
активное вещество:	
валсартан	40/80/160 мг
вспомогательные вещества	
ядро (40 мг): МКЦ — 47,5 мг; кросповидон (Коллидон CL) — 9 мг; кремния диоксид коллоидный (аэросил) — 1 мг; магния стеарат — 2,5 мг	
ядро (80 мг): МКЦ — 95 мг; кросповидон (Коллидон CL) — 18 мг; кремния диоксид коллоидный (аэросил) — 2 мг; магния стеарат — 5 мг	
ядро (160 мг): МКЦ — 190 мг; кросповидон (Коллидон CL) — 36 мг; кремния диоксид коллоидный (аэросил) — 4 мг; магния стеарат — 10 мг	

оболочка пленочная (40 мг): Opadry II (спирт поливиниловый, частично гидролизованный — 1,2 мг, титана диоксид Е171 — 0,6561 мг, тальк — 0,444 мг, макрогол (полиэтиленгликоль 3350) — 0,606 мг, краситель железа оксид желтый Е172 — 0,0009 мг, алюминиевый лак на основе красителя хинолиновый желтый — 0,0903 мг, алюминиевый лак на основе красителя «Солнечный закат» желтый — 0,0021 мг, алюминиевый лак на основе красителя индигокармин — 0,0006 мг) — 3 мг	
оболочка пленочная (80 мг): Opadry II (спирт поливиниловый, частично гидролизованный — 2,4 мг, титана диоксид Е171 — 1,4268 мг, тальк — 0,888 мг, макрогол (полиэтиленгликоль 3350) — 1,212 мг, алюминиевый лак на основе красителя индигокармин — 0,0042 мг, алюминиевый лак на основе красителя азорубин — 0,0384 мг, алюминиевый лак на основе красителя пунцового (Понсо 4R) — 0,0306 мг) — 6 мг	
оболочка пленочная (160 мг): Opadry II (спирт поливиниловый, частично гидролизованный — 4,8 мг, титана диоксид Е171 — 2,6832 мг, тальк — 1,776 мг, макрогол (полиэтиленгликоль 3350) — 2,424 мг, краситель железа оксид желтый Е172 — 0,1716 мг, краситель железа оксид красный Е172 — 0,1452 мг) — 12 мг	

Описание:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 40 мг: желтого цвета, круглые, двояковыпуклые с риской.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 80 мг: розового цвета, круглые, двояковыпуклые с риской.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, 160 мг: розово-оранжевого цвета, круглые, двояковыпуклые.

На поперечном разрезе — ядро таблетки белого или почти белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты

Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — гипотензивное, блокирующее AT_1-рецепторы ангиотензина II.

Фармакодинамика

Валсартан — активный специфический АРА II, предназначенный для приема внутрь. Избирательно блокирует рецепторы подтипа AT_1, которые ответственны за эффекты ангиотензина II. Следствием блокады AT_1-рецепторов является повышение плазменной концентрации ангиотензина II, который может стимулировать незаблокированные AT_2-рецепторы. Валсартан не имеет сколько-нибудь выраженной агонистической активности в отношении AT_1-рецепторов. Сродство валсартана к рецепторам подтипа AT_1 примерно в 20000 раз выше, чем к рецепторам подтипа AT_2. Валсартан не вступает во взаимодействие и не блокирует рецепторы других гормонов или ионные каналы, имеющие важное значение в регуляции функций ССС.

Вероятность возникновения кашля при применении валсартана очень низкая, что связано с отсутствием влияния на АПФ, который отвечает за деградацию брадикинина. Сравнение валсартана с ингибитором АПФ демонстрирует, что частота развития сухого кашля достоверно ($p<0,05$) ниже у пациентов, принимающих препарат, чем у пациентов, принимающих ингибитор АПФ (2,6 против 7,9% соответственно). В группе пациентов, у которых ранее при лечении ингибитором АПФ развивался сухой кашель, при лечении валсартаном это нежелательное явление (НЯ) отмечается в 19,5% случаев, а при лечении тиазидным диуретиком — в 19% случаев, в то время как в группе пациентов, получавших лечение ингибитором АПФ, кашель наблюдается в 68,5% случаев ($p<0,05$).

Применение при артериальной гипертензии у пациентов старше 18 лет

При лечении валсартаном пациентов с артериальной гипертензией отмечается снижение АД, не сопровождающееся изменением ЧСС.

После применения внутрь разовой дозы препарата у большинства пациентов антигипертензивное действие начинается в течение 2 ч, а максимальное снижение АД достигается в пределах 4–6 ч и сохраняется более 24 ч. При повторном применении препарата максимальное снижение АД, вне зависимости от принятой дозы, обычно достигается в пределах 2–4 нед и поддерживается на достигнутом уровне в ходе длительной терапии. В случае одновременного применения препарата с гидрохлоротиазидом достигается достоверное дополнительное снижение АД.

Резкое прекращение применения валсартана не сопровождается значительным повышением АД или другими НЯ. У пациентов с артериальной гипертензией, сахарным диабетом типа 2 и нефропатией, принимающих валсартан в дозе 160–320 мг, отмечается значительное снижение протеинурии (36–44%).

Применение после острого инфаркта миокарда у пациентов старше 18 лет

При применении препарата в течение 2 лет у пациентов, которые начали прием в период от 12 ч до 10 дней после перенесенного острого инфаркта миокарда (осложненного левожелудочковой недостаточностью и/или систолической дисфункцией левого желудочка (ЛЖ), снижаются показатели общей и сердечно-сосудистой смертности и увеличивается время до первой госпитализации по поводу обострения течения ХСН, повторного инфаркта миокарда, внезапной остановки сердца и инсульта (без летального исхода). Профиль безопасности валсартана у пациентов с острым инфарктом миокарда сходен с таковым при других состояниях.

ХСН у пациентов старше 18 лет

При применении валсартана (в средней суточной дозе 254 мг) в течение 2 лет у пациентов с ХСН II (62%), III (36%) и IV (2%) функционального класса по классификации *NYHA* с ФВЛЖ менее 40% и внутренним диастолическим диаметром ЛЖ более 2,9 см/м^2, получающих стандартную терапию, включая ингибиторы АПФ (93%), диуретики (86%), дигоксин (67%) и бета-адреноблокаторы (36%) отмечается достоверное снижение (на 27,5%) риска госпитализации по поводу обострения течения ХСН.

У пациентов, не получавших ингибиторы АПФ, отмечается значительное снижение показателя общей смертности (на 33%), сердечно-сосудистой смертности и заболеваемости, связанной с ХСН (время до наступления первого сердечно-сосудистого события), которые оцениваются по следующим показателям: смерть, внезапная смерть с проведением реанимации, госпитализация по поводу обострения течения ХСН, в/в введение инотропных или сосудорасширяющих препаратов в течение 4 или более часов без госпитализации (на 44%). В группе пациентов, получающих ингибиторы АПФ (без бета-адреноблокаторов), на фоне лечения валсартаном не наблюдается снижение показателя общей смертности, однако уменьшаются показатели сердечно-сосудистой смертности и заболеваемости, связанной с ХСН, на 18,3%.

В целом применение валсартана приводит к уменьшению числа госпитализаций по поводу ХСН, замедлению прогрессирования ХСН, улучшению функционального класса ХСН по классификации *NYHA*, увеличению ФВЛЖ, а также уменьшению выраженности признаков и симптомов сердечной недостаточности и улучшению качества жизни по сравнению с плацебо.

Применение у пациентов старше 18 лет с артериальной гипертензией и нарушением толерантности к глюкозе

При применении валсартана и изменении образа жизни отмечалось статистически достоверное снижение риска развития сахарного диабета у данной категории пациентов. Валсартан не оказывал влияние на частоту летальных исходов в результате сердечно-сосудистых событий, инфаркта миокарда и ишемических атак без летального исхода, госпитализации по причине сердечной недостаточности или нестабильной стенокардии, артериальной реваскуляризации, у пациентов с нарушением толерантности к глюкозе и артериальной гипертензией, отличающихся по возрасту, полу и расовой принадлежности.

У пациентов, получающих валсартан, риск развития микроальбуминурии был достоверно ниже, чем у пациентов, не получающих данную терапию. Рекомендуемая начальная доза препарата Валсартан-СЗ у пациентов с артериальной гипертензией и нарушением толерантности к глюкозе 80 мг 1 раз в сутки. При необходимости доза может быть увеличена до 160 мг.

Применение у детей и подростков от 6 до 18 лет при артериальной гипертензии

У детей и подростков от 6 до 18 лет валсартан обеспечивает дозозависимое, плавное снижение АД. При применении валсартана максимальное снижение АД, вне зависимости от принятой дозы, обычно достигается в течение 2 нед, и поддерживается на достигнутом уровне в ходе длительной терапии.

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.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД, которое может привести к угнетению сознания, коллапсу и/или шоку.

Лечение: симптоматическое, характер которого зависит от времени, прошедшего с момента приема препарата, и от степени тяжести симптомов. При случайной передозировке следует индуцировать рвоту (если препарат был принят недавно) или провести промывание желудка. В случае возникновения выраженного снижения АД в качестве терапии необходимо в/в введение 0,9% раствора натрия хлорида, пациента следует уложить, приподняв ноги, на необходимый для терапии период времени, принять активные меры по поддержанию деятельности ССС, включая регулярный контроль деятельности сердца и дыхательной системы, ОЦК и количества выделяемой мочи.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Диагнозы

- Адреногенитальный синдром
- Акромегалия
- Гестационный сахарный диабет
- Гинекомастия у мужчин

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 валсартана рекомендуется соблюдать осторожность при вождении автомобиля и управлении механизмами.

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