Валсартан Зентива



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 темно-розового цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской с одной стороны; ядро на поперечном срезе белого или почти белого цвета.

	1 таб.
валсартан	80 мг

Вспомогательные вещества: просолв (смесь целлюлозы микрокристаллической 98% и кремния диоксида коллоидного 2%) - 33.5 мг, сорбитол - 9.25 мг, дестаб магния карбонат 90 (смесь магния карбоната 90%, крахмала прежелатинизированного 9% и воды 1%) - 9.25 мг, крахмал кукурузный прежелатинизированный - 3 мг, повидон K25 - 7.5 мг, натрия стеарилфумарат - 4 мг, натрия лаурилсульфат - 1 мг, кросповидон (тип A) - 13 мг, кремния диоксид коллоидный безводный - 2 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай OY-L-28900 (смесь лактозы моногидрата 36%, гипромеллозы 2910 - 28%, титана диоксида 26% и макрогола 10%) - 3 мг, краситель железа оксид красный - 0.2 мг.

14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой коричневато-желтого цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской с одной стороны; ядро на поперечном срезе белого или почти белого цвета.

	1 таб.
валсартан	160 мг

Вспомогательные вещества: просолв (смесь целлюлозы микрокристаллической 98% и кремния диоксида коллоидного 2%) - 67 мг, сорбитол - 18.5 мг, дестаб магния карбонат 90 (смесь магния карбоната 90%, крахмала прежелатинизированного 9% и воды 1%) - 18.5 мг, крахмал кукурузный прежелатинизированный - 6 мг, повидон K25 - 15 мг, натрия стеарилфумарат - 8 мг, натрия лаурилсульфат - 2 мг, кросповидон (тип A) - 26 мг, кремния диоксид коллоидный безводный - 4 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай OY-L-28900 (смесь лактозы моногидрата 36%, гипромеллозы 2910 - 28%, титана диоксида 26% и макрогола 10%) - 6 мг, краситель железа оксид желтый - 0.4 мг, краситель железа оксид коричневый - 0.1 мг.

14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Специфический антагонист рецепторов ангиотензина II. Избирательно блокирует рецепторы подтипа АТ1, которые ответственны за известные эффекты ангиотензина II. Следствием блокады АТ1-рецепторов является повышение плазменной концентрации ангиотензина II, который может стимулировать незаблокированные АТ2-рецепторы.

Валсартан не имеет сколько-нибудь выраженной агонистической активности в отношении АТ1-рецепторов. Сродство валсартана к рецепторам подтипа АТ1 примерно в 20 000 раз выше, чем к рецепторам подтипа АТ2.

Вероятность возникновения кашля при применении валсартана очень низкая, что связано с отсутствием влияния на АПФ, кининазу II, который отвечает за деградацию брадикинина.

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

После приема препарата внутрь в разовой дозе у большинства больных начало антигипертензивного действия отмечается в пределах 2 ч, а максимальное снижение АД достигается в пределах 4-6 ч. После приема препарата антигипертензивное действие сохраняется более 24 ч. При повторном приеме максимальное снижение АД, вне зависимости от принятой дозы, обычно достигается в пределах 2-4 недель и поддерживается на достигнутом уровне в ходе длительной терапии. В случае комбинации препарата с гидрохлоротиазидом достигается достоверное дополнительное снижение АД. Внезапное прекращение приема валсартана не сопровождается резким повышением АД или другими нежелательными клиническими последствиями.

Механизм действия валсартана при хронической сердечной недостаточности (ХСН) основан на его способности устранять отрицательные последствия хронической гиперактивации РААС и ее главного эффектора, ангиотензина II, а именно, вазоконстрикцию; задержку жидкости в организме; пролиферацию клеток, ведущую к ремоделированию органов-мишеней (сердце, почки, сосуды); стимуляцию избыточного синтеза гормонов, действующих синергично с РААС (катехоламинов, альдостерона, вазопрессина, эндотелина). На фоне применения валсартана при ХСН уменьшается преднагрузка, снижается давление заклинивания в легочных капиллярах (ДЗЛК) и диастолическое давление в легочной артерии, повышается сердечный выброс. Наряду с гемодинамическими эффектами валсартан, за счет опосредованной блокады синтеза альдостерона, уменьшает задержку натрия и воды в организме.

Установлено, что препарат не оказывал существенного влияния на концентрацию общего холестерина, мочевой кислоты, а также при исследовании натощак - на концентрацию триглицеридов и глюкозы в сыворотке крови.

Фармакокинетика

Всасывание

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

В диапазоне изученных доз кинетика валсартана имеет линейный характер. При повторном применении препарата изменений кинетических показателей не отмечалось. Пища снижает воздействие валсартана приблизительно на 40% и C_{ss} приблизительно на 50%, хотя примерно через 8 ч после приема дозы концентрация валсартана в плазме крови в группе, получавшей пищу, и группе, принимавшей дозу натощак, была одинаковой. Однако это снижение концентрации не сопровождается клинически значимым снижением терапевтического эффекта, поэтому валсартан можно назначать вне зависимости от приема пищи.

Распределение

V_d валсартана в равновесном состоянии после в/в введения составляет около 17 л, что свидетельствует о том, что валсартан распределяется в тканях не интенсивно. Связывание валсартана с белками плазмы значительное - 94-97%, в основном с альбумином.

Метаболизм

Валсартан метаболизируется незначительно. Только около 20% дозы обнаруживается в виде метаболитов. В плазме крови обнаруживается фармакологически неактивный гидроксиметаболит.

Выведение

По сравнению с печеночным кровотоком (около 30 л/ч) плазменный клиренс валсартана относительно небольшой (около 2 л/ч). $T_{1/2}$ составляет около 9 ч. Количество валсартана, выводящегося через кишечник, составляет 70%. Почками выводится около 30%, преимущественно в неизмененном виде.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У некоторых пациентов пожилого возраста системное действие валсартана было несколько более выраженным, чем у больных молодого возраста, однако не было показано, что это имеет какое-либо клиническое значение.

Не было выявлено корреляции между функцией почек и системным действием валсартана. У пациентов с нарушением функции почек (КК>10 мл/мин) коррекция дозы препарата не требуется. Опыт безопасного применения препарата у пациентов с КК <10 мл/мин и находящихся на гемодиализе отсутствует. Однако валсартан имеет высокую степень связывания с белками плазмы крови, поэтому его выведение при гемодиализе маловероятно.

Около 70% всосавшейся дозы валсартана выводится через кишечник, преимущественно в неизмененном виде. Валсартан не подвергается значительной биотрансформации, системное действие валсартана не коррелирует со степенью нарушений функции печени. Поэтому у пациентов с печеночной недостаточностью небилиарного происхождения и при отсутствии холестаза не требуется коррекции дозы валсартана. Применение валсартана у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени не изучалось.

Среднее время достижения C_{max} и $T_{1/2}$ валсартана у больных с ХСН сходны с таковыми у здоровых добровольцев. C_{max} в плазме крови и AUC увеличиваются линейно и практически пропорционально при увеличении дозы в интервале клинических доз (от 40 до 160 мг 2 раза/сут).

Показания к применению:

— артериальная гипертензия;

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

— для повышения выживаемости пациентов с острым инфарктом миокарда и после перенесенного острого инфаркта миокарда, осложненного левожелудочковой недостаточностью и/или систолической дисфункцией левого желудочка, при наличии стабильных показателей гемодинамики.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Миокардит
- Сердечная недостаточность

Противопоказания:

— тяжелые нарушения функции печени, билиарный цирроз и холестаз;

— возраст до 18 лет;

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— непереносимость лактозы, дефицит лактазы или синдром, глюкозо-галактозная мальабсорбция;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью:* при двустороннем стенозе почечных артерий; стенозе артерии единственной почки; при соблюдении диеты с ограничением потребления поваренной соли; при состояниях, сопровождающихся уменьшением ОЦК (в т.ч. диарея и рвота); у больных с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК<10 мл/мин), в т.ч. при проведении гемодиализа, при применении у пациентов после трансплантации почки; при первичном гиперальдостеронизме; легких и умеренных нарушениях функции печени небилиарного генеза без явлений холестаза; при митральном и аортальном стенозах; при гипертрофической обструктивной кардиомиопатии.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь, не разжевывая, независимо от приема пищи.

Артериальная гипертензия

Рекомендуемая начальная доза составляет 80 мг 1 раз/сут, независимо от расы, пола и возраста пациента. Начало антигипертензивного действия отмечается в пределах 2 ч, максимальное снижение АД достигается в пределах 4-6 ч. Антигипертензивный эффект сохраняется более 24 ч. Максимальная суточная доза - 320 мг. Возможно комбинирование с диуретиками.

Хроническая сердечная недостаточность

По 40 мг (1/2 таблетки по 80 мг) 2 раза/сут, с постепенным повышением до 80 мг 2 раза/сут, при хорошей переносимости - до 160 мг 2 раза/сут. Максимальная суточная доза - 320 мг в 2 приема.

Период после перенесенного инфаркта миокарда

Лечение начинают в течение 12 ч после перенесенного инфаркта миокарда с начальной дозы 20 мг 2 раза/сут, с последующим увеличением дозы (40 мг, 80 мг, 160 мг 2 раза/сут) в течение нескольких недель, до достижения целевой дозы 160 мг 2 раза/сут.

Достижение дозы 80 мг 2 раза в сутки рекомендуется к концу 2-й недели, 160 мг 2 раза/сут - к концу 3 месяца терапии. Максимальная суточная доза - 320 мг в 2 приема.

Достижение целевой дозы зависит от переносимости препарата в период титрования.

У **пациентов пожилого возраста** коррекция дозы не требуется.

У **пациентов с нарушением функции почек** при КК >10 мл/мин коррекция дозы не требуется.

У **пациентов с легкими и умеренными нарушениями функции печени** без развития холестаза максимальная суточная доза препарата не должна превышать 80 мг.

Побочное действие:

Частота побочных эффектов: очень часто (>10%); часто (>1% и <10%); нечасто (>0.1% и <1%); редко (>0.01% и <0.1%); очень редко (<0.01%), включая отдельные сообщения; неуточненной частоты - частоту установить невозможно.

Пациенты с артериальной гипертензией

Со стороны сердечно-сосудистой системы: неуточненной частоты - васкулит.

Со стороны дыхательной системы: нечасто - кашель.

Со стороны пищеварительной системы: нечасто - боли в животе; неуточненной частоты - нарушение функции печени, гипербилирубинемия, повышение активности "печеночных" трансаминаз.

Со стороны кожных покровов: очень редко - ангионевротический отек, кожная сыпь, зуд.

Со стороны костно-мышечной системы: неуточненной частоты - миалгия.

Со стороны мочевыделительной системы: неуточненной частоты - нарушение функции почек, повышение концентрации креатинина в сыворотке крови.

Со стороны системы кроветворения: неуточненной частоты - снижение гемоглобина и гематокрита, нейтропения, тромбоцитопения.

Аллергические реакции: неуточненной частоты - реакция повышенной чувствительности, сывороточная болезнь.

Со стороны органов чувств: нечасто - вертиго.

Прочие: нечасто - повышенная утомляемость.

Лабораторные показатели: неуточненной частоты - повышение концентрации калия в сыворотке крови

Пациенты после перенесенного инфаркта миокарда и/или с ХСН

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - ортостатическая гипотензия и выраженное снижение АД); нечасто - усиление симптомов ХСН; неуточненной частоты - васкулит.

Со стороны дыхательной системы: нечасто - кашель.

Со стороны пищеварительной системы: нечасто - диарея, тошнота; неуточненной частоты - нарушение функции печени.

Со стороны нервной системы: часто - головокружение, в т.ч. постуральное; нечасто - обморок, головная боль.

Со стороны органов чувств: нечасто - вертиго.

Со стороны органов кроветворения: неуточненной частоты - тромбоцитопения.

Аллергические реакции: очень редко - ангионевротический отек; неуточненной частоты - реакции повышенной чувствительности, сывороточная болезнь.

Со стороны костно-мышечной системы: редко - рабдомиолиз; неуточненной частоты - миалгия.

Со стороны кожных покровов: неуточненной частоты - кожная сыпь, зуд.

Со стороны мочевыделительной системы: часто - нарушение функции почек; нечасто - острая почечная недостаточность; неуточненной частоты - гиперкреатининемия, повышение концентрации азота мочевины в сыворотке крови.

Со стороны обмена веществ: нечасто - гиперкалиемия.

Прочие: нечасто - повышенная утомляемость, астения.

Передозировка:

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

Лечение: промывание желудка, прием достаточного количества активированного угля, в/в введение 0.9% раствора натрия хлорида. Валсартан не выводится при диализе в связи с выраженным связыванием с белками плазмы крови

Применение при беременности и кормлении грудью:

Учитывая механизм действия антагонистов рецепторов ангиотензина II, нельзя исключить риск для плода. Действие ингибиторов АПФ (препаратов, оказывающих влияние на РААС) на плод, в случае их назначения во втором и третьем триместрах беременности, приводит к его повреждению и гибели. По ретроспективным данным при применении ингибиторов АПФ в I триместре беременности повышается риск рождения детей с врожденными дефектами. Имеются сообщения о самопроизвольных абортах, олигогидрамнионе и нарушениях функции почек у новорожденных, матери которых в период беременности неумышленно получали валсартан. Валсартан Зентива, как и любой другой препарат, оказывающий непосредственное влияние на РААС, не следует применять при беременности. Если беременность выявлена в период лечения препаратом Валсартан Зентива, препарат следует отменить как можно скорее.

Данные о выделении валсартана с грудным молоком отсутствуют. Поэтому не следует назначать препарат в период грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении препаратов лития с ингибиторами АПФ сообщалось об обратимом повышении содержания лития в плазме крови и развитии токсических эффектов. Из-за отсутствия опыта одновременного применения валсартана и лития эта комбинация не рекомендована. В случае необходимости такой комбинации рекомендуется контроль содержания лития в плазме крови.

Калийсберегающие диуретики, препараты калия, соли, содержащие калий, препараты, повышающие содержание калия в плазме крови (такие как гепарин) усиливают развитие гиперкалиемии. При необходимости совместного применения с валсартаном рекомендуется контролировать содержание калия в плазме крови.

Антигипертензивный эффект препарата может быть ослаблен при совместном применении с нестероидными противовоспалительными препаратами (НПВП), в т.ч. селективными ингибиторами циклооксигеназы-2 (ЦОГ-2).

При лечении артериальной гипертензии валсартаном не было отмечено клинически значимого взаимодействия с другими одновременно применяемыми препаратами (например, циметидин, варфарин, дигоксин, атенолол, амлодипин, глибенкламид, фуросемид, индометацин, гидрохлоротиазид).

Другие гипотензивные средства и диуретики усиливают антигипертензивный эффект.

Особые указания и меры предосторожности:

Дефицит в организме натрия и/или ОЦК

У пациентов с выраженным дефицитом натрия и/или сниженным ОЦК, например, получающих высокие дозы диуретиков, в редких случаях после начала терапии препаратом Валсартан Зентива может возникать выраженная артериальная гипотензия. До начала лечения необходимо скорректировать дефицит натрия и/или ОЦК, например, снизив дозу диуретика.

Стеноз почечной артерии

Применение валсартана коротким курсом у 12 пациентов с реноваскулярной гипертензией, развившейся вторично вследствие одностороннего стеноза почечной артерии, не привело к значимым изменениям почечной гемодинамики, концентрации креатинина сыворотки крови или азота мочевины крови. Однако учитывая, что другие лекарственные средства, влияющие на РААС, могут вызывать повышение концентрации мочевины и креатинина в сыворотке крови у больных с двусторонним или односторонним стенозом почечной артерии, в качестве меры предосторожности рекомендуется контроль этих показателей.

Хроническая сердечная недостаточность/период после перенесенного инфаркта миокарда

У больных с ХСН или после перенесенного инфаркта миокарда, начинающих лечение валсартаном, часто отмечается некоторое снижение АД, в связи с чем, рекомендуется контролировать АД в начале терапии. При соблюдении рекомендаций по режиму дозирования отмены препарата обычно не возникает потребности отмены препарата по причине артериальной гипотензии.

Вследствие ингибирования РААС у чувствительных пациентов возможны изменения функции почек. У больных с тяжелой ХСН лечение ингибиторами АПФ и антагонистами ангиотензиновых рецепторов может сопровождаться олигурией и/или нарастанием азотемии и в отдельных случаях острой почечной недостаточностью и/или смертельным исходом. Поэтому необходима оценка степени нарушения функции почек у пациентов с сердечной недостаточностью и пациентов, перенесших острый инфаркт миокарда.

Нарушение функции почек

Опыт безопасного применения у пациентов с КК <10 мл/мин и у пациентов, находящихся на гемодиализе, отсутствует, поэтому применять Валсартан Зентива у таких пациентов необходимо с осторожностью. У пациентов с КК >10 мл/мин коррекция дозы не требуется.

Во время лечения валсартаном необходимо тщательно контролировать функцию почек и содержание калия в плазме крови.

Печеночная недостаточность

У пациентов с легкой или умеренной печеночной недостаточностью без явлений холестаза применять препарат Валсартан Зентива необходимо с осторожностью.

Комбинированная терапия

При ХСН валсартан может назначаться как для монотерапии, так и совместно с другими средствами - диуретиками, сердечными гликозидами, а также ингибиторами АПФ или бета-адреноблокаторами. У пациентов с ХСН следует соблюдать осторожность при применении комбинации ингибитора АПФ, бета-адреноблокатора и валсартана. При артериальной гипертензии Валсартан Зентива можно назначать как для монотерапии, так и совместно с другими антигипертензивными средствами, в частности, диуретиками. Возможно применение валсартана в комбинации с другими лекарственными препаратами, назначаемыми после перенесенного инфаркта миокарда: тромболитиками, ацетилсалициловой кислотой в качестве антиагрегатного средства, бета-адреноблокаторами и ингибиторами ГМГ-КоА-редуктазы (статинами).

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Пациентам, принимающим Валсартан Зентива, следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятиях, требующих повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций (во время терапии может возникать головокружение и обмороки).

При нарушениях функции почек

У пациентов с нарушением функции почек при КК >10 мл/мин коррекция дозы не требуется.

Применять с осторожностью у больных с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК<10 мл/мин), в т.ч. при проведении гемодиализа, при применении у пациентов после трансплантации почки.

При нарушениях функции печени

У пациентов с легкими и умеренными нарушениями функции печени без развития холестаза максимальная суточная доза препарата не должна превышать 80 мг.

Противопоказан при тяжелых нарушениях функции печени, билиарном циррозе и холестазе.

Применение в пожилом возрасте

У пациентов пожилого возраста коррекция дозы не требуется.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°C.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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