Инструкция по применению
Апровель таблетки 300 мг 14 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Франция
Производитель: Санофи
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Ирбесартан
Количество в упаковке: 14
Дозировка действующего вещества: 300 мг
Срок годности: 36.0



Описание

Двояковыпуклые овальные таблетки белого или почти белого цвета с гравировкой в виде сердца на одной стороне и числа 2773 - на другой.

Действующее вещество

Ирбесартан

Состав

Действующее вещество: ирбесартан - 300 мг.Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал кукурузный прежелатинизированный, кроскармеллоза натрия, полоксамер 188, кремния диоксид коллоидный водный, целлюлоза микрокристаллическая, магния стеарат.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

После приема внутрь ирбесартан хорошо всасывается, его абсолютная биодоступность составляет приблизительно 60-80%. Одновременный прием пищи существенно не влияет на биодоступность ирбесартана.Связь с белками плазмы крови составляет приблизительно 96%. Связывание с клеточными компонентами крови незначительно. Объем распределения составляет 53-93 литра.После приема внутрь

или внутривенного введения 14С-ирбесартана 80-85% радиоактивности циркулирующей плазмы приходится на неизмененный ирбесартан. Ирбесартан метаболизируется печенью путем окисления и конъюгации с глюкуроновой кислотой. Окисление ирбесартана осуществляется, главным образом, с помощью цитохрома Р450 CYP2C9, участие изоэнзима CYP3A4 в метаболизме ирбесартана является незначительным. Основным метаболитом, находящимся в системном кровотоке, является ирбесартана глюкуронид (приблизительно 6%).Ирбесартан обладает линейной и пропорциональной дозе фармакокинетикой в интервале доз от 10 до 600 мг, при дозах свыше 600 мг (доза, в два раза превышающая рекомендованную максимальную дозу препарата) кинетика ирбесартана становится нелинейной (уменьшение абсорбции). После приема внутрь максимальные концентрации в плазме крови достигаются через 1,5-2 часа. Общий клиренс и почечный клиренс составляют 157-176 и 3-3,5 мл/мин., соответственно. Конечный период полувыведения ирбесартана составляет 11-15 часов. При ежедневном однократном приеме препарата равновесная плазменная концентрация (Css) достигается через 3 дня. При ежедневном приеме ирбесартана 1 раз в сутки отмечается его ограниченное накопление в плазме крови (менее 20%). У женщин (по сравнению с мужчинами) отмечаются несколько более высокие плазменные концентрации ирбесартана. Однако связанных с полом различий в периоде полувыведения и накоплении ирбесартана не выявляется. Коррекции дозы ирбесартана у женщин не требуется. Значения AUC (площади под фармакокинетической кривой концентрация-время) и Стах (максимальной плазменной концентрации) ирбесартана у больных пожилого возраста (>65 лет) несколько выше, чем у пациентов более молодого возраста, однако конечные периоды полувыведения у них достоверно не различаются. Коррекции дозы у пожилых пациентов не требуется.Ирбесартан и его метаболиты выводятся из организма, как с желчью, так и с мочой. После приема внутрь или внутривенного введения 14С-ирбесартана около 20% радиоактивности обнаруживается в моче, а остальная часть - в кале. Менее 2% введенной дозы выделяется с мочой в виде неизмененного ирбесартана.Нарушение функции почек: У больных с нарушением функции почек или больных, которьм проводится гемодиализ, показатели фармакокинетики ирбесартана существенным образом не изменяются. Ирбесартан не удаляется из организма при проведении гемодиализа.Нарушение функции печени: У больных с циррозом печени легкого или средне-тяжелого течения фармакокинетические параметры ирбесартана существенно не изменяются. Фармакокинетических исследований у пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью не проводились.

Показания

Эссенциальная гипертензияНефропатия при артериальной гипертензии и сахарном диабете 2 типа (в составекомбинированной гипотензивной терапии).

Способ применения и дозы

Внутрь, таблетку проглатывают целиком, запивая водой.Обычно принимаемая первоначально и поддерживающая доза составляет 150 мг 1 раз в сутки вне зависимости от приема пищи. Апровель в дозе 150 мг 1 раз в сутки в целом обеспечивает лучший 24-часовой контроль АД, чем в дозе 75 мг. Однако у некоторых пациентов, особенно у пациентов, находящихся на гемодиализе, или у пациентов старше 75 лет, принимаемая первоначально доза должна составлять 75 мг (возможно применение препарата Апровель в таблетках по 75 мг).У пациентов, у которых терапевтический эффект при приёме Апровеля в дозе 150 мг 1 раз в сутки недостаточен, доза Апровеля может быть увеличена до 300 мг, или возможно назначение другого антигипертензивного средства. В частности было показано, что назначение диуретика, такого как гидрохлоротиазид, усиливало действие Апровеля (см. "Взаимодействие с другими лекарственными средствами").У пациентов с артериальной гипертензией и сахарным диабетом 2 типа лечение должно начинаться с дозы 150 мг! раз в сутки, которая должна постепенно увеличиваться до 300 мг - дозы, являющейся предпочтительной поддерживающей дозой для лечения нефропатии.Доказательства благоприятного воздействия Апровеля на почки у пациентов с артериальной гипертензией и сахарным диабетом 2 типа получены в исследованиях, в которых он использовался в сочетании с другими гипотензивными препаратами, необходимыми для достижения целевого уровня артериального давления.Нарушение функции почек. У больных с нарушенной функцией почек коррекции режима дозирования не требуется. Для пациентов, находящихся на гемодиализе, первоначально принимаемая доза должна составлять 75 мг (возможно применение препарата Апровель в таблетках по 75 мг).Нарушение водно-электролитного баланса. До начала приема Апровеля следует восстановить объем циркулирующей крови и/или устранить гипонатриемию.Нарушение функции печени. Не требуется коррекции режима дозирования Апровеля у больных с нарушениями функции печени легкой или средней степени тяжести. Нет клинического опыта применения препарата у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени. Пациенты пожилого возраста. Хотя рекомендуется лечение пациентов в возрасте старше 75 лет начинать с дозы 75 мг (возможно применение препарата Апровель в таблетках по 75 мг), обычно пациентам пожилого возраста коррекции режима дозирования не требуется.Использование в педиатрии. Безопасность и эффективность применения препарата Апровель у больных детского и юношеского возраста не установлена.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата.Беременность. Период лактации.Возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены). Наследственная непереносимость галактозы, недостаточность лактазы илинарушения всасывания глюкозы и галактозы.

Применение при беременности и кормлении грудью

БеременностьКак и любой другой препарат, который воздействует непосредственно на ренин-ангиотензин-альдостероновую систему, ирбесартан нельзя применять при беременности (I, II, Ш триместры).Переход на соответствующую альтернативную терапию должен быть произведен до начала планирования беременности.При наступлении беременности во время лечения ирбесартаном, его следует отменить как можно быстрее.Период лактацииВо время кормления грудью прием ирбесартана противопоказан. Неизвестно, экскретируется ли ирбесартан в материнское молоко.

Побочные действия

Указанные ниже побочные эффекты даются в сооветствии со следующими градациями частоты ихвозникновения:: очень часто(>1/10), часто (>1/100, 1/1000, 1/10000, Артериальная гипертензияВ плацебо-контролируемых исследованиях частота возникновения побочных эффектов при приеме ирбесартана была такой же, как и при приеме плацебо, и не зависела от дозы (в рекомендованном интервале доз), пола, возраста и расы или от продолжительности терапии.В плацебо-контролированных исследованиях у больных с артериальной гапертензией, в которых 1965 больных получали ирбесартан, наблюдались перечисленные ниже побочные реакции.Со стороны центральной нервной системыЧасто: головокружение.Со стороны сердечно-сосудистой системыИногда: тахикардия.Сосудистые расстройстваИногда: гиперемия кожных покровов.Со стороны дыхательной системыИногда: кашель.Со стороны желудочно-кишечного трактаЧасто: тошнота/рвота.Иногда: диарея, диспепсия/изжога. Со стороны репродуктивной системыИногда: половая дисфункция.ОбщиеЧасто: утомляемость.Иногда: боль в грудной клетке.Со стороны лабораторных показателейЧасто (1,7%): достоверное увеличение креатинфосфокиназы плазмы крови у больных, получавших ирбесартан, ни одно из этих увеличений не сопровождалось клиническими проявлениями со стороны опорно-двигательного аппарата.Артериальная гипертензия и сахарный диабет 2 типа с поражением почекКроме побочных реакций, указанных у пациентов с артериальной гипертензией, у больных артериальной гипертензией, сахарным диабетом 2 типа с микроальбуминурией без нарушения функции почек при приеме ирбесартана ортостатическое головокружение и ортостатическая гипотензия наблюдались у 0,5%

больных (по сравнению с частотой возникновения этих побочных реакций при приеме плацебо).У больных с артериальной гипертензией, сахарным диабетом 2 типа с выраженной протеинурией и хронической почечной недостаточностью перечисленные ниже побочные реакции наблюдались у >2% больных (по сравнению с частотой их возникновения при приеме плацебо).Со стороны нервной системыЧасто: ортостатическое головокружение.Сосудистые расстройстваЧасто: ортостатическая гипотензия.Со стороны опорно-двигательного аппаратаЧасто: боли в мышцах и костях. Со стороны лабораторных показателейГиперкалиемия при приеме ирбесартана больными сахарным диабетом встречалась чаще, чем при приеме плацебо. У больных сахарным диабетом с повышенным АД и микроальбуминурией с нормальной функцией почек гиперкалиемия(>5,5% ммоль/л) при приеме 300 мг ирбесартана наблюдалась у 29,4% больных (очень часто), а в группе плацебо - у 22% больных. У больных сахарным диабетом с повышенным АД, хронической почечной недостаточностью и выраженной протеинурией, гиперкалиемия(>5,5% ммоль/л) при приеме ирбесартана встречалась у 46,3% больных (очень часто), а в группе плацебо - у 26,3% больных. У пациентов с повышенным артериальным давлением и диабетической нефропатией, получавших ирбесартан, у 1,7% больных наблюдалось клинически незначимое снижение концентрации гемоглобина (часто).Кроме того, с момента появления ирбесартана на рынке, были также выявлены следующие побочные реакции:Со стороны иммунной системыРедко: как и у всех антагонистов рецепторов ангиотензина-П, отмечалисьредкие случаи аллергических реакций, таких как сыпь, крапивница, ангионевротический отек.Со стороны метаболизма и питания Очень редко: гиперкалиемия.Со стороны нервной системыОчень редко: головная боль. Со стороны органа слуха и вестибулярного аппаратаОчень редко: звон в ушах.Со стороны желудочно-кишечного traktaОчень редко: дисгевзия (извращение вкуса).Со стороны гепато-билиарной системыОчень редко: нарушения функции печени, гепатит. Со стороны опорно-двигательного аппаратаОчень редко: миалгия, артралгия (иногда в сочетании с повышением уровня креатинкиназы), судороги.Со стороны почек и мочевыводящей системыОчень редко: нарушение функции почек, в том числе отдельные случаи развития почечной недостаточности у больных группы риска (смотри раздел "Особые указания").

Передозировка

Опыт применения препарата у взрослых людей в дозах до 900 мг/сутки на протяжении 8 недель не выявил какой-либо токсичности. Наиболее вероятными проявлениями передозировки являются выраженное снижение артериального давления и тахикардия, проявлением передозировки также может быть брадикардия. Отсутствует какая-либо специфическая информация в отношении лечения передозировки препарата Апровель. Следует установить постоянное наблюдение за состоянием больного и при необходимости проводить симптоматическую и поддерживающую терапию. При передозировке рекомендуется вызвать рвоту и/или провести промывание желудка. Для уменьшения передозировки может быть полезен активированный уголь. Гемодиализ неэффективен.

Взаимодействие с другими препаратами

Диуретики и другие гипотензивные средства. При сочетании ирбесартана с другими гипотензивными средствами возможно усиление гипотензивного действия, ирбесартан без каких-либо проблем использовали в сочетании с другими гипотензивными препаратами, такими как бета-адреноблокаторы, блокаторы "медленных" кальциевых каналов длительного действия и тиазидные диуретики. Гипотензивные эффекты ирбесартана и тиазидных диуретиков носят аддитивный характер. У больных, у которых не удается контролировать АД при монотерапии ирбесартаном, назначение небольших доз гидрохлоротиазида (12,5 мг) приводит к дополнительному снижению (по сравнению с эффектом плацебо) артериального давления на 7-10/3-6 мм рт. ст. (систолическое/диастолическое артериальное давление в конце междозового периода). При приеме ирбесартана с небольшими дозами гидрохлоротиазида (12,5 мг в сутки) гипотензивное действие этой комбинации у пациентов негроидной расы приближается в таковому у пациентов европейской расы. Предшествующее лечение диуретиками в высоких дозах может приводить к обезвоживанию организма и повышению риска возникновения артериальной гипотензии в начале лечения препаратом Апровель.Препараты калия и калийсберегающие диуретики, гепарин. На основании опыта, полученного при использовании других лекарственных средств, влияющих на ренин-ангиотензин-альдостероновую систему, при одновременном использовании препаратов калия, содержащих калий электролитных растворов, калийсберегающих диуретиков или других способных повышать уровень калия в крови препаратов (гепарин), возможно повышение уровня калия в сыворотке крови.Литий. Обратимое повышение концентраций лития в сыворотке крови или его токсичности было отмечено при одновременном использовании лития с ингибиторами ангиотензин-превращающего фермента. К настоящему моменту при приеме ирбесартана подобные эффекты

наблюдались крайне редко. Если имеется необходимость в использовании этой комбинации, то во время лечения следует тщательно мониторировать концентрацию лития в сыворотке крови.Нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП). При одновременном применении антагонистов ангиотензина II и НПВП (например, селективных ингибиторов ЦОГ-2, ацетилсалициловой кислоты (более 3 г/сутки) и неселективных НПВП) возможно ослабление гипотензивного эффекта. Как и при совместном применении ингибиторов ангиотензин-превращающего фермента и НПВП, при совместном применении антагонистов ангиотензина II и НПВП может увеличиваться риск нарушения функции почек, включая возможность развития острой почечной недостаточности, и увеличения сывороточного уровня калия, особенно, у больных с уже нарушенной функцией почек. Следует с осторожностью применять эту комбинацию, особенно у пациентов пожилого возраста. Больным необходимо восстановить объем циркулирующей крови и в течение всей комбинированной терапии и периодически после ее окончания контролировать функцию почек. Дополнительная информация по взаимодействию ирбесартана. При совместном применении ирбесартана с гидрохлоротиазидом фармакокинетика ирбесартана не изменяется. Ирбесартан в основном метаболизируется за счет CYP2C9 и в меньшей степени подвергается глюкуронированию. Не наблюдалось значительных фармакокинетических или фармакодинамических взаимодействий при сочетании ирбесартана с варфарином, препаратом, метаболизирующимся с помощью CYP2C9. Изучения влияния индукторов активности CYP2C9, таких как рифампицин, на фармакокинетику ирбесартана не проводилось, Ирбесартан не изменяет фармакрокинетику дигоксина.

Особые указания

Нарушение водно-электролитного баланса. У больных с обезвоживанием и/или с гипонатриемией (в результате интенсивной диуретической терапии, диареи или рвоты, соблюдения диеты с ограничением приема поваренной соли, приема диуретиков), а также у больных, находящихся на гемодиализе, может развиваться клинически значимая артериальная гипотензия, особенно после приема первой дозы препарата. Перед началом применения препарата Апровель необходимо скорректировать все нарушения водно-электролитного баланса.Реноваскулярная гипертензия. Больные с двусторонним стенозом почечных артерий или стенозом артерии единственной функционирующей почки, при приеме препаратов, влияющих на ренин-ангиотензин-альдостероновую систему, относятся к группе повышенного риска в отношении развития тяжелой артериальной гипотензии или почечной недостаточности. Хотя документальное подтверждение возникновения таких эффектов при приеме препарата Апровель отсутствует, следует все-таки принимать во

внимание возможность их возникновения при использовании блокаторов рецепторов ангиотензина II (типа ATI) у этих больных.Почечная недостаточность и пересадка почек. При применении Апровеля у пациентов с почечной недостаточностью рекомендован периодический контроль уровня калия и креатинина сыворотки крови. Нет клинических данных относительно применения Апровеля у пациентов, недавно перенесших пересадку почек.Больные с артериальной гипертензией и сахарным диабетом типа 2 с поражением почек. Отмеченое у Апровеля благоприятное действие в отношении замедления прогрессирования почечных и сердечно-сосудистых поражений имело разную степень выраженности у разных групп больных: менее выражено оно было у женщин и у лиц, не относящихся к европейской расе. Гиперкалиемия. Как и при применении других средств, влияющих на ренин-ангиотензин-альдостероновую систему, при лечении Апровелем может развиваться гиперкалиемия, особенно при наличии почечной недостаточности и/или заболеваний сердца. У таких пациентов рекомендуется контролировать уровень калия в сыворотке крови.Стеноз аортального или митрального клапана, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия. Как и при применении других вазодилататоров, при назначении Апровеля пациентам с аортальным или митральным стенозом или гипертрофической обструктивной кардиомиопатией необходимо соблюдать осторожность.Первичный алъдостеронизм. Пациенты с первичным альдостеронизмом обычно не реагируют на антигипертензивные препараты, действующие через ингибирование ренин-ангиотензиновой системы. Поэтому применение Апровеля в таких случаях не целесообразно.Прочее. В группе больных, у которых сосудистый тонус и функция почек в преобладающей степени зависят от активности ренин-ангиотензин-альдостероновой системы (больные с хронической сердечной недостаточностью Ш и IV стадии [по классификации NYHA] или с сопутствующими заболеваниями почек, включая стеноз почечной артерии), лечение ингибиторами ангиотензин-превращающего фермента ассоциировалось с артериальной гипотензией, азотемией, олигурией и, в редких случаях, с острой почечной недостаточностью. Как и при применении других гипотензивных препаратов, значительное снижение артериального давления у пациентов с ишемической болезнью сердца и/или атеросклеротическим поражением сосудов головного мозга может привести к развитию инфаркта миокарда или инсульта. Лечение таких пациентов должно осуществляться под строгим контролем артериального давления.Влияние на способность управлять транспортомВлияние Апровеля на способность управлять автомобилем и выполнять работу, требующую повышенного внимания, не изучалось, однако, исхода из его фармакодинамических свойств, Апровель не должен влиять на эту способность. При управлении автотранспортом необходимо учитывать, что во время лечения возможно головокружение и повышенная усталость.

Условия хранения

В сухом месте