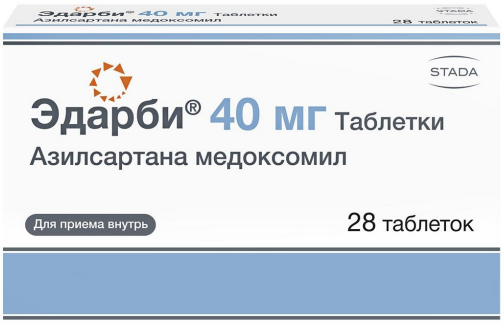
Инструкция по применению
Эдарби Таблетки 40 мг 28 шт

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: Хемофарм
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Азилсартана медоксомил
Количество в упаковке: 28
Дозировка действующего вещества: 40 мг

Действующее вещество

Азилсартана медоксомил

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

ВсасываниеРасчетная абсолютная биодоступность азилсартана медоксомила при приеме внутрь составляет примерно 60% по данным профиля концентраций в плазме крови. Cmax азилсартана в плазме крови в среднем достигается в течение 1.5-3 ч после приема препарата внутрь. Прием пищи не влияет на биодоступность азилсартана.РаспределениеФармакокинетика азилсартана медоксомила пропорциональна дозировке в диапазоне доз от 20 мг до 320 мг после однократного или многократного приема внутрь.Vd азилсартана составляет около 16 л. Азилсартан связывается с белками плазмы крови (более 99%), преимущественно с альбуминами. Связь с белками плазмы крови сохраняется постоянной при концентрации азилсартана в плазме крови, значительно превышающей диапазон, достигаемый при приеме в рекомендуемых дозах. Css азилсартана достигается в течение 5 дней, его кумуляции в плазме крови при ежедневном применении 1 раз/сут не происходит. Исследования на животных с радиоактивными метками показали, что количество азилсартана, проникающего через ГЭБ, минимально.МетаболизмПосле приема внутрь во время абсорбции из ЖКТ азилсартана медоксомил превращается в

фармакологически активный метаболит азилсартан под действием фермента карбоксиметиленбутенолидазы в кишечнике и печени. Азилсартан метаболизируется до двух первичных метаболитов преимущественно в печени. Основной метаболит в плазме крови формируется О-деалкилированием и обозначается как метаболит М-II, второстепенный метаболит образовывается декарбоксилированием и обозначается как метаболит М-I. Значения AUC для этих метаболитов у человека составляет соответственно 50% и менее 1% по сравнению с азилсартаном. М-I и М-II не влияют на фармакологическую активность препарата Эдарби. Основным ферментом, обеспечивающим метаболизм азилсартана, является изофермент CYP2C9. ВыведениеАзилсартан и его метаболиты выводятся из организма, как через кишечник, так и почками. Исследования показали, что после приема внутрь азилсартана медоксомила, около 55% (преимущественно в виде метаболита М-I) обнаруживается в кале и около 42% (15% - в виде азилсартана, 19% - в виде метаболита М-II) - в моче. T1/2 азилсартана составляет около 11 ч, почечный клиренс - около 2.3 мл/мин. Фармакокинетика у особых групп пациентовФармакокинетика азилсартана у детей и подростков в возрасте до 18 лет не изучалась.Фармакокинетика азилсартана у молодых пациентов (18-45 лет) и пациентов пожилого возраста (65-85 лет) значительно не отличается.У пациентов с почечной недостаточностью легкой, средней и тяжелой степени AUC была увеличена на 30%, 25% и 95% соответственно. Увеличения AUC (5%) у пациентов с терминальной стадией почечной недостаточности, находящихся на гемодиализе, не наблюдалось. Клинические данные о фармакокинетике у пациентов с тяжелой степенью или терминальной стадией почечной недостаточности отсутствуют. Азилсартан не выводится из системного кровотока посредством гемодиализа.Применение препарата Эдарби более 5 дней у пациентов с легкой (класс А по шкале Чайлд-Пью) или средней (класс В по шкале Чайлд-Пью) степенью тяжести печеночной недостаточности ведет к небольшому увеличению AUC (в 1.3-1.6 раз, соответственно). Фармакокинетика препарата Эдарби у пациентов с тяжелой (класс С по шкале Чайлд-Пью) степенью печеночной недостаточности не изучалась.Фармакокинетика азилсартана у мужчин и женщин значительно не отличается. Коррекции дозы в зависимости от пола не требуется. Фармакокинетика азилсартана в зависимости от расы пациентов значительно не отличается. Коррекции дозы в зависимости от расы не требуется.

Показания

Эссенциальная гипертензия.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к активному веществу и другим компонентам препарата; беременность; одновременный прием алискирена у пациентов с сахарным диабетом; возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены); тяжелые нарушения функции печени (более 9 баллов по шкале Чайлд-Пью) (отсутствует опыт применения). С осторожностью: Тяжелая хроническая сердечная недостаточность (IV функциональный класс по классификации NYHA); почечная недостаточность тяжелой степени (клиренс креатинина < 30 мл/мин); двусторонний стеноз почечных артерий и стеноз артерии единственной функционирующей почки; ишемическая кардиомиопатия; ишемические цереброваскулярные заболевания; состояние после трансплантации почки; состояния, сопровождающиеся снижением объема циркулирующей крови (ОЦК) (в том числе рвота, диарея), а также у пациентов, соблюдающих диету с ограничением поваренной соли; при одновременном применении с большими дозами диуретиков; - первичный гиперальдостеронизм; гиперкалиемия; стеноз аортального и митрального клапанов; гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия (ГОКМП); возраст старше 75 лет.

Применение при беременности и кормлении грудью

БеременностьВ исследованиях на животных выявлено, что азилсартан и М-II проникают через плацентарный барьер.У пациенток, планирующих беременность, следует начать терапию альтернативными антигипертензивными препаратами с установленным профилем безопасности для беременных. Сразу после подтверждения беременности следует прекратить прием препарата Эдарби и, если это необходимо, начать курс лечения препаратами, разрешенными для применения при беременности. У новорожденных, матери которых получали терапию препаратом Эдарби, может развиться артериальная гипотензия, в связи с чем, новорожденные должны находиться под тщательным медицинским наблюдением.Период лактацииОтсутствуют сведения о способности азилсартана и/или его метаболитов проникать в грудное молоко. В исследованиях на животных выявлено, что азилсартан и М-II выделяются с молоком актирующих крыс.По причине отсутствия опыта применения препарата Эдарби у женщин в период грудного вскармливания не рекомендуется его применение у данной категории пациентов. Предпочтительно применение препаратов с наиболее изученным профилем безопасности, особенно в период ухода за новорожденным или недоношенным ребенком.ФертильностьДанные о воздействии препарата Эдарби на фертильность у человека отсутствуют. Доклинические исследования показали отсутствие эффекта на мужскую или женскую фертильность у крыс.

Побочные действия

Со стороны нервной системы: часто - головокружение. Со стороны сосудов: нечасто - выраженное снижение АД. Со стороны желудочно-кишечного тракта: часто - диарея; нечасто - тошнота. Со стороны кожи и подкожных тканей: нечасто - сыпь, зуд; редко - ангионевротический отек. Со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани: нечасто - мышечные спазмы. Общие нарушения: нечасто - повышенная утомляемость, периферические отеки.

Передозировка

Опыт применения препарата Эдарби у взрослых в дозах до 320 мг/сут на протяжении 7 дней показывает, что препарат хорошо переносится.Симптомы: выраженное снижение АД, головокружение.Лечение: при выраженном снижении АД следует перевести пациента в горизонтальное положение с низким изголовьем; рекомендуется проведение мероприятий по увеличению ОЦК и симптоматической терапии. Гемодиализ неэффективен.

Взаимодействие с другими препаратами

Было отмечено обратимое повышение концентрации лития в сыворотке крови и проявление токсичности при одновременном применении препаратов лития и ингибиторов АПФ и препаратов лития с антагонистами рецепторов ангиотензина II. Поэтому одновременное применение азилсартана медоксомила в комбинации с препаратами лития не рекомендуется. При необходимости применения данной комбинации рекомендуется регулярный контроль содержания лития в сыворотке крови.При одновременном применении антагонистов ангиотензина II и НПВС (например, селективных ингибиторов ЦОГ-2, ацетилсалициловой кислоты (более 3 г /сут) и неселективных НПВС) возможно ослабление антигипертензивного эффекта. При одновременном применении антагонистов ангиотензина II и НПВС может возрастать риск нарушения функции почек и увеличения содержания калия в сыворотке крови. Поэтому в начале лечения пациентам рекомендуется регулярный прием достаточного количества жидкости и контроль функции почек.Одновременное применение калийсберегающих диуретиков, препаратов калия, заменителей солей, содержащих калий и других лекарственных средств (например, гепарина) с азилсартана медоксомилом может привести к увеличению содержания калия в сыворотке крови. Пациентам во время комбинированной терапии следует контролировать содержание калия в сыворотке крови.Двойная блокада РААС антагонистами рецепторов ангиотензина II, ингибиторами АПФ или алискиреном связана с повышенным риском развития артериальной гипотензии, гиперкалиемии, и нарушением функции почек (включая острую почечную недостаточность) по сравнению с монотерапией.Не наблюдалось фармакокинетических взаимодействий при одновременном применении азилсартана медоксомила или азилсартана с амлодипином, антацидными препаратами (магния и алюминия гидроксидом), хлорталидоном, дигоксином, флуконазолом, глибенкламидом, кетоконазолом, метформином и варфарином.Азилсартана медоксомил превращается в фармакологически активный метаболит азилсартан во время абсорбции из ЖКТ под действием фермента карбоксиметиленбутенолидазы в кишечнике и печени. Исследования in vitro показали, что взаимодействия, основанные на ингибировании ферментов, являются маловероятными.Антигипертензивный эффект от терапии азилсартана медоксомилом может быть усилен при комбинированном применении с другими антигипертензивными средствами, включая диуретики (хлорталидон и гидрохлоротиазид) и дигидропиридиновые блокаторы медленных кальциевых каналов (амлодипин).

Особые указания

Пациенты, у которых сосудистый тонус и функция почек зависят в большой степени от

активности РААС (например, у пациентов с тяжелой хронической сердечной недостаточностью (IV функциональный класс по классификации NYHA), тяжелой степенью почечной недостаточности или стенозом почечных артерий), лечение лекарственными средствами, действующими на РААС, такими как ингибиторы АПФ и антагонисты рецепторов ангиотензина II, связано с возможностью развития острой артериальной гипотензии, азотемии, олигурии или, редко, острой почечной недостаточности. Возможность развития перечисленных эффектов не может быть исключена и при применении Эдарби.Резкое снижение АД у пациентов с ишемической кардиомиопатией или ишемическими цереброваскулярными заболеваниями может приводить к развитию инфаркта миокарда или инсульта. Данные о применении препарата Эдарби у пациентов, недавно перенесших трансплантацию почки, отсутствуют.Данные о клиническом опыте применения препарата Эдарби у пациентов с тяжелой степенью нарушения функции печени отсутствуют, поэтому применение препарата у данной категории пациентов не рекомендуется.У пациентов со сниженным ОЦК и/или с гипонатриемией (в результате рвоты, диареи, приема диуретиков в высоких дозах или соблюдения диеты с ограничением приема поваренной соли) может развиваться клинически значимая артериальная гипотензия после начала терапии препаратом Эдарби. Гиповолемию следует скорректировать перед началом лечения препаратом Эдарби или начать лечение с дозировки 20 мг.Пациенты с первичным гиперальдостеронизмом обычно резистентны к терапии гипотензивными препаратами, влияющими на РААС. В связи с этим препарат Эдарби не рекомендуется назначать таким пациентам.Клинический опыт применения других препаратов, влияющих на РААС, показывает, что одновременное назначение препарата Эдарби с калийсберегающими диуретиками, препаратами калия или заменителями солей, содержащими калий, или другими препаратами, которые могут увеличить содержание калия в крови (например, гепарин), может привести к гиперкалиемии у пациентов с артериальной гипертензией. У пациентов пожилого возраста, пациентов с почечной недостаточностью, сахарным диабетом и/или у пациентов с другими сопутствующими заболеваниями увеличивается риск развития гиперкалиемии, которая может быть фатальной. У таких пациентов рекомендуется контролировать содержание калия в сыворотке крови.При применении препарата Эдарби у пациентов с аортальным или митральным стенозом или гипертрофической обструктивной кардиомиопатией необходимо соблюдать осторожность.Как и при применении других антагонистов рецепторов ангиотензина II, не рекомендуется одновременное применение препаратов лития и препарата Эдарби. Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмамиНа основании фармакодинамических свойств ожидается, что азилсартана медоксомил будет незначительно влиять на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами. Необходимо соблюдать осторожность, как и при

применении любых антигипертензивных препаратов (риск развития головокружения и повышенной утомляемости).