Инструкция по применению
Гипосарт Таблетки 16 мг 28 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: Акрихин
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Кандесартан
Количество в упаковке: 28
Срок годности: 24.0



16 мг | 28 таблеток

Описание

Для таблеток 8 мг: Круглые, двояковыпуклые таблетки с делительной риской с одной стороны и гравировкой 8 с другой стороны, светло-розового цвета, допускаются небольшие вкрапления. Для таблеток 16 мг: Круглые, двояковыпуклые таблетки с делительной риской с одной стороны, белого цвета. Для таблеток 32 мг: Круглые, плоские таблетки с фаской с двух сторон, с делительной риской с одной стороны и гравировкой 32 с другой стороны, белого цвета.

Действующее вещество

Кандесартан

Состав

1 таблетка (8 мг) содержит: Действующее вещество: кандесартана цилексетил – 8,00 мг. Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат – 197,90 мг, крахмал кукурузный – 40,00 мг, гипролоза* – 4,00 мг, гипролоза** – 4,00 мг, макрогол 6000 – 5,20 мг, магния стеарат – 0,80 мг, краситель железа оксид красный Е 172 – 0,10 мг. 1 таблетка (16 мг) содержит: Действующее вещество: кандесартана цилексетил – 16,00 мг. Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат – 87,00 мг, крахмал кукурузный – 20,00 мг, гипролоза* – 2,00 мг, гипролоза** – 2,00 мг, макрогол 6000 – 2,60 мг, магния стеарат – 0,40 мг. 1 таблетка (32 мг) содержит: Действующее вещество: кандесартана цилексетил – 32,00 мг. Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат – 174,00 мг, крахмал кукурузный – 40,00 мг, гипролоза* – 4,00 мг, гипролоза** – 4,00 мг, макрогол 6000 – 5,20 мг, магния стеарат – 0,80 мг. *- Вязкость, вода, 25 °C (5 %) 75 – 150 спз ** - Вязкость, вода, 25 °C (5 %) 1500 – 3000 спз

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Кандесартана цилексетил является пролекарством. Кандесартана цилексетил после приема внутрь быстро превращается в активное вещество – кандесартан, посредствомэфирного гидролиза. При всасывании из пищеварительного тракта прочно связывается с АТ1-рецепторами и медленно диссоциирует, не имеет свойств агониста. Всасывание и распределение Абсолютная биодоступность кандесартана составляет примерно 40% после приема внутрь. Относительная биодоступность составляет примерно 34%. Максимальная концентрация (Cmax) в сыворотке крови достигается через 3-4 часа после приема внутрь. Концентрация в плазме крови возрастает линейно при увеличении дозы в терапевтическом интервале (до 32 мг). Связь с белками плазмы крови высокая (более 99%). Объем распределения кандесартана составляет 0,13 л/кг. Фармакокинетические параметры кандесартана не зависят от возраста, пола пациента и от времени приема пищи. Метаболизм и выведение Кандесартан в основном выводится из организма почками и через кишечник в неизмененном виде. Незначительно метаболизируется в печени (20-30%) при участии изофермента CYP2C9 с образованием неактивного производного. Период полувыведения (T1/2) кандесартана составляет примерно 9 часов. Не кумулирует. Общий клиренс – около 0,37 мл/мин/кг, при этом почечный клиренс препарата – 0,19 мл/мин/кг. После приема внутрь 14^C-меченного кандесартана цилексетила 26% дозы выводилось почками в форме кандесартана и 7% – в форме неактивного метаболита, в то же время 56% дозы выводится через кишечник с желчью в форме кандесартана и 10% – в форме неактивного метаболита. После однократного приема внутрь в течение 72 ч выводится более 90% дозы.

Показания

Артериальная гипертензия. Хроническая сердечная недостаточность и нарушение систолической функции левого желудочка (ФВЛЖ ⩽ 40%) – в качестве дополнительной терапии к ингибиторам АПФ или при непереносимости ингибиторов АПФ.

Способ применения и дозы

Внутрь, 1 раз в сутки, вне зависимости от времени приема пищи. Артериальная гипертензия Рекомендуемая начальная и поддерживающая доза препарата Гипосарт составляет 8 мг 1 раз/сут. При необходимости дозу можно увеличить до 16 мг 1 раз /сут. Максимальный антигипертензивный эффект достигается в течение 4 недель терапии. Максимальная суточная доза – 32 мг 1 раз/сут. Если на фоне максимальной суточной дозы не достигается адекватный контроль АД, рекомендуется добавить к терапии тиазидный диуретик. Пациенты со сниженным ОЦК У пациентов с риском развития артериальной гипотензии терапию рекомендуется начинать с начальной дозы 4 мг. Пациенты с нарушением функции почек У пациентов с легким или умеренным нарушением функции почек (КК 30-80 мл/мин/1,73 м 2 площади поверхности тела), включая пациентов, находящихся на гемодиализе, начальная доза препарата составляет 4 мг. Дозу титровать в зависимости от терапевтического эффекта. Клинический опыт применения препарата у пациентов с тяжелыми нарушениями функции почек или терминальной стадией почечной недостаточности (КК менее 15 мл/мин) ограничен (см. раздел Особые указания.)   Пациенты с нарушением функции печени Начальная суточная доза препарата у пациентов с заболеваниями печени легкой и средней степени тяжести составляет 4 мг. Возможно увеличение дозы при необходимости. Клинический опыт применения препарата у пациентов с тяжелыми нарушениями функции печени и /или холестазом отсутствует (см. раздел Противопоказания). Сопутствующая терапия Применение препарата Гипосарт одновременно с тиазидными диуретиками (например, гидрохлоротиазид) может усилить антигипертензивный эффект препарата. Хроническая сердечная недостаточность Рекомендуемая начальная доза препарата Гипосарт составляет 4 мг 1 раз/сут. Увеличение до максимальной суточной дозы – 32 мг 1 раз/сут или до максимально переносимой дозы проводится путем удвоения дозы с интервалом не менее 2 недель. Особые группы пациентов Пациентам пожилого возраста и пациентам с нарушениями функции почек или печени не требуется коррекции начальной дозы препарата. Применение у детей и подростков Безопасность и эффективность применения препарата Гипосарт у детей и подростков в возрасте до 18 лет не установлены. Сопутствующая терапия Препарат Гипосарт можно одновременно применять с другими препаратами для лечения ХСН, включая ингибиторы АПФ, бета-адреноблокаторы, диуретики, сердечные гликозиды или комбинации этих лекарственных средств.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к кандесартану или другим компонентам препарата. Непереносимость лактозы, дефицит лактазы, синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции. Беременность и период грудного вскармливания. Детский и подростковый возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены). Тяжелые нарушения функции печени и/или холестаз. Одновременное применение с алискиреном и препаратами, содержащими алискирен, у пациентов с сахарным диабетом и/или умеренными или тяжелыми нарушениями функции почек (скорость клубочковой фильтрации (СКФ) менее 60 мл/мин/1,73 м2 площади поверхности тела). Одновременное применение с ингибиторами АПФ у пациентов с диабетической нефропатией.

Применение при беременности и кормлении грудью

Беременность. Препарат Гипосарт противопоказан к применению во время беременности, т.к. он оказывает прямое воздействие на РААС и может вызывать нарушения развития плода (в особенности во втором и третьем триместрах беременности) или оказывать негативное влияние на новорожденного, вплоть до летального исхода, если препарат применялся во время беременности. Известно, что терапия антагонистами рецепторов к ангиотензину II (АРАII) может вызывать нарушения развития плода (нарушение функции почек, олигогидрамнион, замедление оссификации костей черепа) и развитие осложнений у новорожденного(почечная недостаточность, артериальная гипотензия, гиперкалиемия). При установлении факта беременности препарат Гипосарт необходимо отменить как можно быстрее. При планировании беременности необходимо перевести пациентку на адекватную альтернативную терапию. Период грудного вскармливания. Неизвестно, проникает ли кандесартан в грудное молоко, но известно, что он проникает в молоко лактирующих крыс. Во время лечения препаратом Гипосарт грудное вскармливание необходимо прекратить. Новорожденные, матери которых принимали во время беременности Гипосарт, должны находиться под тщательным медицинским наблюдением из-за вероятности развития артериальной гипотензии.

Побочные действия

Артериальная гипертензия Побочные эффекты в ходе клинических исследований носили умеренный и преходящий характер и были сопоставимы по частоте с группой плацебо. Общая частота возникновения неблагоприятных реакций на фоне приема кандесартана не зависела от дозы препарата и возраста пациента. Частота случаев прекращения терапии в связи с побочными эффектами была сходной при использовании кандесартана (3,1%) и плацебо (3,2%). В ходе объединенного анализа

данных проведенных исследований сообщалось о следующих побочных эффектах, часто (>1/100) встречавшихся на фоне приема кандесартана. Описанные неблагоприятные реакции наблюдались с частотой хотя бы на 1% больше, чем в группе плацебо. По этому определению наиболее часто отмечали головокружение /вертиго, слабость, головную боль и респираторные инфекции. В таблице ниже представлены побочные эффекты, отмеченные в клинических исследованиях и при постмаркетинговом применении. Частота возникновения побочных реакций в таблицах раздела представлена в следующей градации: очень часто (⩾1/10), часто (от ⩾1/100 до <1/10), нечасто (от ⩾1/1,000 до <1/100), редко (от ⩾1/10,000 до <1/1, 000) и очень редко (<1/10,000). Класс системы органов - Частота - Нежелательная реакция Инфекционные и паразитарные заболевания - Часто - Респираторные инфекции Нарушения со стороны крови и лимфатической системы - Очень редко - Лейкопения, нейтропения и агранулоцитоз Нарушения со стороны обмена веществ и питания - Очень редко Гиперкалиемия, гипонатриемия Нарушения со стороны нервной системы - Часто - Головокружение/вертиго, головная боль Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения - Очень редко - Кашель Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта - Очень редко - Тошнота Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта - Неизвестно - Диарея Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей - Очень редко - Повышение активности печеночных ферментов, нарушение функции печени или гепатит Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей - Очень редко - Ангионевротический отёк, кожная сыпь, крапивница, кожный зуд Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани - Часто - Боль в спине, Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани - Очень редко - Артралгия, миалгия Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей - Очень редко - Нарушение функции почек, включая почечную недостаточность у предрасположенных пациентов (см. раздел Особые указания) Общие расстройства и нарушения в месте введения - Часто - Слабость Лабораторные показатели В целом при применении кандесартана не было отмечено клинически значимых изменений стандартных лабораторных показателей. Как и при применении других средств, влияющих или действующих на ренин-ангиотензин-альдостероновую систему, может наблюдаться небольшое снижение уровня гемоглобина. Наблюдалось увеличение концентрации креатинина и мочевины, увеличение содержания калия и уменьшение содержания натрия. Повышение активности аланинаминотрансферазы (АЛТ) было отмечено несколько чаще при применении кандесартана в сравнении с плацебо (1,3% против 0,5%). При

применении кандесартана обычно не требуется регулярного контроля лабораторных показателей. Однако у пациентов с нарушением функции почек рекомендуется периодически контролировать содержание калия и креатинина в сыворотке   крови. Хроническая сердечная недостаточность Побочные реакции, выявленные на фоне применения кандесартана у пациентов с сердечной недостаточностью, соответствовали фармакологическим свойствам препарата и зависели от состояния пациента. В ходе клинических исследований CHARM проводилось сравнение кандесартана в дозах до 32 мг (n=3,803) с плацебо (n=3, 796), 21,0 % пациентов из группы, получавшей кандесартан, и 16,1 % пациентов из группы, получавшей плацебо, прекратили лечение из-за возникновения побочных реакций. Наиболее часто встречавшимися побочными эффектами были гиперкалиемия, выраженное снижение АД и нарушение функции почек. Эти явления были более частыми у пациентов старше 70 лет, у пациентов с сахарным диабетом или получающих другие препараты, влияющие на ренинангиотензин-альдостероновую систему, в частности, ингибиторы АПФ и /или спиронолактон. В таблице ниже представлены побочные эффекты, отмеченные в клинических исследованиях и при постмаркетинговом применении. Класс системы органов - Частота - Нежелательный эффект Нарушения со стороны крови и лимфатической системы - Очень редко - Лейкопения, нейтропения и агранулоцитоз Нарушения со стороны обмена веществ и питания - Часто - Гиперкалиемия Нарушения со стороны обмена веществ и питания - Очень редко - Гипонатриемия Нарушения со стороны нервной системы - Очень редко - Головокружение, головная боль Нарушения со стороны сосудов - Часто - Выраженное снижение АД Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения - Очень редко - Кашель Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта - Очень редко - Тошнота Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта - Неизвестно - Диарея Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей - Очень редко - Повышение активности печеночных ферментов, нарушение функции печени или гепатит Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей - Очень редко - Ангионевротический отёк, кожная сыпь, крапивница, кожный зуд Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани - Очень редко Боль в спине, артралгия, миалгия Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей - Часто Нарушение функции почек, включая почечную недостаточность у пациентов с предрасположенностью (см. раздел Особые указания) Общие расстройства и нарушения в месте введения - Очень редко - Слабость Лабораторные показатели: повышение концентрации креатинина и мочевины,

повышение содержания калия. Рекомендуется контролировать концентрацию креатинина и содержание калия в сыворотке крови.

Передозировка

Симптомы: выраженное снижение АД, головокружение, тахикардия. Описаны отдельные случаи передозировки препарата (до 672 мг кандесартана цилексетила), закончившиеся выздоровлением пациентов без тяжелых последствий. Лечение: при выраженном снижении АД перевести пациента в положение лежа на спине, ноги приподнять далее следует провести мероприятия, направленные на увеличение ОЦК (введение 0,9% раствора натрия хлорида внутривенно). В случае необходимости могут быть назначены симпатомиметические препараты. Симптоматическая терапия под контролем жизненно важных функций организма. Гемодиализ неэффективен.

Взаимодействие с другими препаратами

Применение кандесартана одновременно с препаратами, содержащими алискирен, противопоказано у пациентов с сахарным диабетом и/или умеренной или тяжелой почечной недостаточностью (СКФ менее 60 мл/мин/1,73 м2 площади поверхности тела) и не рекомендуется у других пациентов. (см. раздел Противопоказания). Изучено одновременное применение кандесартана с гидрохлоротиазидом, варфарином, дигоксином, пероральными контрацептивами (этинилэстрадиол/левоноргестрел), глибенкламидом, нифедипином и эналаприлом клинически значимого фармакокинетического взаимодействия не отмечено. Кандесартан в незначительной степени метаболизируется в печени (с помощью изофермента CYP2C9). Не выявлено влияния на изоферменты CYP2C9 и CYP3A4 эффект в отношении других изоферментов цитохрома P450 в настоящее время неизвестен. Гипотензивные средства потенцируют антигипертензивный эффект кандесартана. Опыт применения других лекарственных средств, действующих на РААС, показывает, что одновременное применение препарата и калийсберегающих диуретиков (спиронолактон, эплеренон, триамтерен, амилорид), препаратов калия, заменителей соли, содержащих калий, или других средств, способных повышать содержание калия в сыворотке крови (например, гепарин), может привести к развитию гиперкалиемии. При одновременном применении препаратов лития и ингибиторов АПФ были отмечены случаи транзиторного повышения концентрации лития в сыворотке крови и развитии токсических эффектов. Аналогичный эффект возможен при одновременном применении препаратов лития и антагонистов рецепторов ангиотензина II, что требует периодического контроля концентрации лития в сыворотке крови при комбинированном применении этих препаратов. При одновременном применении АРАII и нестероидных противовоспалительных препаратов (НПВП), включая селективные ингибиторы циклооксигеназы-2 (ЦОГ-2) и неселективные НПВП, например, ацетилсалициловая кислота более 3 г/сут, может уменьшаться антигипертензивное действие кандесартана. Как и в случае с ингибиторами АПФ, одновременное применение АРАII и НПВП повышает риск снижения функции почек, вплоть до развития почечной недостаточности, что приводит к гиперкалиемии у пациентов с нарушением функции почек. Эта комбинация должна применяться с осторожностью, особенно у пациентов пожилого возраста. Все пациенты должны получать достаточное количество жидкости необходимо контролировать функцию почек в начале терапии и в дальнейшем. Двойная блокада РААС Одновременное применение антагонистов рецепторов ангиотензина II с ингибиторами АПФ противопоказано у пациентов с диабетической нефропатией и не рекомендуется у других пациентов.

Особые указания

Этнические особенности. Антигипертензивный эффект кандесартана у пациентов негроидной расы менее выражен по сравнению с пациентами других рас, в связи с чем, чаще требуется увеличение дозы препарата Гипосарт, а также сочетание с другими гипотензивными препаратами. Нарушение функции почек. Опыт применения препарата у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью или находящихся в терминальной стадии почечной недостаточности (КК менее 15 мл/мин) ограничен. У таких пациентов необходим строгий подбор дозы препарата Гипосарт под тщательным контролем АД. У пациентов с ХСН, особенно старше 75 лет, и у пациентов с нарушениями функции почек необходимо периодически контролировать функцию почек. В период подбора дозы препарата Гипосарт рекомендуется контролировать концентрацию креатинина и калия в сыворотке крови. Комбинированная терапия с ингибитором АПФ при ХСН. При применении препарата Гипосарт в комбинации с ингибитором АПФ может возрастать риск развития побочных эффектов: нарушение функции почек и гиперкалиемия. В этих случаях необходимо тщательное наблюдение и контроль соответствующих лабораторных показателей. Гемодиализ. Во время проведения гемодиализа АД может быть особенно чувствительно к блокаде АТ1- рецепторов в результате уменьшения ОЦК и активации РААС. Поэтому пациентам, находящимся на гемодиализе, необходим контроль АД и индивидуальный подбор дозы препарата Гипосарт. Стеноз почечной артерии. Препараты, оказывающие влияние на РААС, например, ингибиторы АПФ, могут вызывать гиперурикемию и гиперкреатининемию у пациентов с двусторонним стенозом почечных артерий или стенозом артерии единственной почки. Аналогичный эффект может развиться при применении АРАII. Трансплантация почки. Опыт применения препарата у пациентов, недавно перенесших трансплантацию почки, отсутствует. Артериальная гипотензия. У пациентов с ХСН, получающих препарат Гипосарт, может развиться артериальная гипотензия. Также возможно развитие артериальной гипотензии у пациентов со сниженным ОЦК, например, получающих большие дозы диуретиков. В начале терапии необходимо соблюдать осторожность и при необходимости компенсировать ОЦК. Общая анестезия/хирургические вмешательства При проведении хирургических вмешательств под общей анестезией у пациентов, принимающих АРАII, может развиться артериальная гипотензия вследствие блокады РААС. Очень редко артериальная гипотензия может быть выраженной и потребовать внутривенного введения жидкости и/или вазопрессоров. Стеноз аортального и/или митрального клапанов, ГОКМП. Препарат Гипосарт необходимо с осторожностью применять у пациентов с гемодинамически значимым стенозом аортального и/или митрального клапанов или с ГОКМП. Первичный гиперальдостеронизм. Пациенты с первичным гиперальдостеронизмом резистентны к гипотензивным препаратам, влияющим на РААС, поэтому таким пациентам

применение препарата Гипосарт не рекомендуется. Пациенты, у которых сосудистый тонус и функция почек преимущественно зависят от активности РААС (например, пациенты с тяжелой декомпенсированной ХСН или сопутствующим заболеванием почек, в т.ч. односторонний стеноз почечной артерии), терапия другими препаратами, влияющими через РААС, может сопровождаться развитием артериальной гипотензии, азотемией, олигурией и реже – острой почечной недостаточностью. Это нельзя исключить и для антагонистов рецепторов ангиотензина II. Чрезмерное снижение АД у пациентов с ишемической болезнью сердца или цереброваскулярными заболеваниями ишемического генеза может привести к развитию инфаркта миокарда или инсульта. Двойная блокада РААС при применении препаратов, содержащих алискирен Не рекомендуется двойная блокада РААС путем одновременного применения кандесартана и алискирена, ввиду увеличения риска развития артериальной гипотензии, гиперкалиемии и нарушения функции почек. Одновременное применение антагонистов рецепторов ангиотензина II с препаратами, содержащими алискирен, противопоказано у пациентов с сахарным диабетом и/или с умеренной или тяжелой почечной недостаточностью (СКФ менее 60 мл/мин/1,73 м2 площади поверхности тела) и не рекомендуется у других пациентов. (см. раздел Противопоказания). Одновременное применение антагонистов рецепторов ангиотензина II с ингибиторами АПФ противопоказано у пациентов с диабетической нефропатией и не рекомендуется у других пациентов.

Условия хранения

В сухом месте