

Инструкция по медицинскому применению препарата Микардис®

Регистрационный номер: П №015387/01 от 15.12.2009

Торговое название препарата: Микардис®

Международное непатентованное название: телмисартан

Лекарственная форма: таблетки

Состав:

В одной таблетке содержится активного вещества телмисартана -
20, 40 или 80 мг.

Вспомогательные вещества: повидон, меглумин, натрия гидроксид,
сорбитол, магния стеарат.

Описание:

Таблетки 20 мг – белые или почти белые, круглые таблетки, с двух сторон гладкие, со скошенными краями, на одной стороне выгравировано «50Н», на другой стороне – знак компании.

Таблетки 40 мг – белые или почти белые, продолговатой формы таблетки на одной стороне нанесена маркировка «51Н», на другой стороне – символ фирмы.

Таблетки 80 мг – белые или почти белые, продолговатой формы таблетки на одной стороне нанесена маркировка «52Н», на другой стороне – символ фирмы.

Фармакотерапевтическая группа: ангиотензина II рецепторов блокатор.
Код АТС С09СА07

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Телмисартан – эффективный при пероральном применении специфический антагонист рецептора ангиотензина II (тип АТ₁). Телмисартан обладает высоким сродством к подтипу АТ₁ рецептора ангиотензина II, через который

реализуется действие ангиотензина II. Телмисартан вытесняет ангиотензин II из связи с рецептором, не обладая действием агониста в отношении этого рецептора. Телмисартан образует связь только с подтипом AT₁ рецептора ангиотензина II. Связывание носит длительный характер. Телмисартан не обладает сродством к другим рецепторам, в том числе к AT₂ рецептору и другим, менее изученным рецепторам ангиотензина. Функциональное значение этих рецепторов, а также эффект их возможной избыточной стимуляции ангиотензином II, концентрация которого увеличивается при назначении телмисартана, не изучены. Телмисартан приводит к снижению уровня альдостерона в крови. Телмисартан не блокирует ренин в крови и ионные каналы. Телмисартан не блокирует ангиотензин-превращающий фермент (киназу II), который инактивирует брадикинин. Это позволяет избежать побочных эффектов, связанных с действием брадикинина.

У людей телмисартан в дозе 80 мг полностью блокирует гипертензивный эффект ангиотензина II. Эффективное действие препарата продолжается более 24 часов и еще определяется через 48 часов.

Начало гипотензивного действия отмечается в течение трех часов после первого приема телмисартана. Максимальное снижение артериального давления обычно наблюдается через 4 недели после начала лечения.

Гипотензивное действие продолжается в течение 24 часов после назначения препарата, включая последние 4 часа перед приемом очередной дозы.

У пациентов, страдающих артериальной гипертензией, телмисартан снижает систолическое и диастолическое давление, не оказывая влияния на частоту сердечных сокращений.

Телмисартан по силе гипотензивного действия сравним с представителями других классов гипотензивных препаратов.

В случае резкой отмены телмисартана артериальное давление постепенно возвращается к исходному уровню без развития синдрома отмены.

Влияние телмисартана на показатель смертности и заболеваемости сердечно-сосудистыми заболеваниями не установлен.

В клинических исследованиях показано, что применение телмисартана связано со статистически значимым уменьшением массы левого желудочка и индекса массы левого желудочка у больных с артериальной гипертензией и гипертрофией левого желудочка.

Фармакокинетика

При приеме внутрь быстро всасывается из желудочно-кишечного тракта. Биодоступность – 50%. При приеме одновременно с пищей снижение AUC (концентрация в плазме–время) колеблется от 6% (при дозе 40 мг) до 19% (при дозе 160 мг). Спустя 3 часа после приема концентрация в плазме выравнивается, независимо, принят ли он с пищей или натощак.

Наблюдается разница в плазменных концентрациях у мужчин и женщин. С_{max} (максимальная концентрация) и AUC были приблизительно в 3 и 2 раза, соответственно, выше у женщин по сравнению с мужчинами без значимого влияния на концентрацию. Связь с белками плазмы – 99,5%, в основном с альбумином и альфа-1 гликопротеином. Среднее значение кажущегося объема распределения в равновесной стадии – 500 л. Метаболизируется путем конъюгирования с глюкуроновой кислотой. Метаболиты фармакологически неактивны. Период полувыведения (T_{1/2}) - более 20 час. Выводится через кишечник в неизменном виде, выведение почками – менее 2%. Общий плазменный клиренс высокий (900 мл/мин) по сравнению с печеночным кровотоком (около 1500 мл/мин).

Показания к применению

Артериальная гипертензия

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к активному веществу или другим компонентам препарата
- Беременность и период лактации
- Нарушения проходимости желчевыводящих путей
- Выраженные нарушения функции печени
- Наследственная непереносимость фруктозы
- Из-за отсутствия данных не применять у детей и подростков.

Применять с осторожностью:

Почечная гипертензия

У пациентов с двухсторонним сужением просвета почечных артерий или почечной артерии единственной действующей почки при назначении лекарственных препаратов, оказывающих влияние на систему ренин-ангиотензин-альдостерон, увеличивается риск развития тяжелой артериальной гипотензии и почечной недостаточности. Поэтому Микардис, в подобных случаях, следует применять с особой осторожностью.

Нарушение функции почек и состояние после пересадки почки

При назначении Микардиса пациентам с нарушением функции почек рекомендуется регулярно проводить измерения уровня калия и креатинина в крови. Опыт применения Микардиса у пациентов после трансплантации почек отсутствует.

Снижение объема циркулирующей крови

У пациентов со сниженным объемом циркулирующей крови и гипонатриемией, вследствие назначения диуретиков, ограничения потребления соли, или потери жидкости в результате диареи или рвоты,

при назначении Микардиса возможно развитие выраженного снижения артериального давления, особенно при назначении препарата в первый раз.

Сниженный объем циркулирующей крови и гипонатриемия должны быть восстановлены до назначения Микардиса.

Другие состояния, связанные с активацией системы ренин-ангиотензин-альдостерон

В случаях зависимости сосудистого тонуса и функции почек преимущественно от активности системы ренин-ангиотензин-альдостерон (например, у пациентов с хронической сердечной недостаточностью или заболеваниями почек, в том числе при сужении почечных артерий) назначение препаратов, влияющих на эту систему, может сопровождаться развитием острой артериальной гипотензии, гиперазотемии, олигурии и, в редких случаях, острой почечной недостаточности. Поэтому Микардис, в подобных случаях, следует применять с особой осторожностью.

Первичный гиперальдостеронизм

Назначение препаратов, блокирующих систему ренин-ангиотензин-альдостерон у пациентов с первичным гиперальдостеронизмом, обычно является неэффективным. Поэтому назначение Микардиса в подобных случаях не рекомендуется.

Стеноз аортального и митрального клапанов, идиопатический гипертрофический субаортальный стеноз (ИГСС)

Следует соблюдать осторожность при назначении телмисартана и других сосудорасширяющих средств пациентам, страдающим стенозом аортального или митрального клапанов, или ИГСС.

Гиперкалиемия

При использовании различных препаратов, влияющих на систему ренин-ангиотензин-альдостерон, возможно развитие гиперкалиемии, особенно при наличии заболеваний почек и/или сердечной недостаточности. При назначении Микардиса пациентам с высоким риском развития гиперкалиемии рекомендуется проводить периодическое определение уровня калия в крови.

Основываясь на опыте применения других препаратов, влияющих на систему ренин-ангиотензин-альдостерон, при назначении Микардиса следует с осторожностью использовать калийсберегающие диуретики, калиевую пищевую соль и другие вещества, способные приводить к увеличению уровня калия в крови (например, гепарин).

Нарушение функции печени

Телмисартан выводится из организма в основном с желчью. У пациентов, страдающих нарушением проходимости желчевыводящих путей или печеночной недостаточностью, возможно замедление выведения препарата из организма. В подобных случаях телмисартан следует применять с осторожностью.

Сорбитол

Микардис 20 мг, Микардис 40 мг и Микардис 80 мг содержат 84,5 мг, 169 мг и 338 мг сорбитола соответственно, поэтому Микардис не следует назначать пациентам с наследственной непереносимостью фруктозы.

Как и при использовании других гипотензивных препаратов, чрезмерное снижение артериального давления у пациентов, страдающих ишемической кардиопатией или ишемической болезнью сердца, может приводить к развитию инфаркта миокарда или нарушению мозгового кровообращения.

Беременность и период лактации

В доклинических исследованиях не выявлено тератогенного действия препарата, однако, отмечено фетотоксическое действие. Поэтому, в качестве предупредительной меры, Микардис нежелательно применять во время беременности. В случае планируемой беременности следует заменить Микардис препаратами, разрешенными к применению во время беременности. Если беременность установлена, следует немедленно прекратить прием Микардиса.

Способ применения и дозы

Внутри вне зависимости от приема пищи.

Взрослые

Препарат рекомендуется принимать в дозе 40 мг один раз в день. У некоторых пациентов терапевтический эффект может быть достигнут при использовании дозы 20 мг/сут. В случае отсутствия снижения артериального давления до желаемого уровня доза Микардиса может быть увеличена до 80 мг один раз в день. Принимая решение об увеличении дозы Микардиса, следует помнить, что максимальная эффективность гипотензивного действия препарата обычно отмечается через 4-8 недель после начала лечения.

У пациентов с тяжелой степенью артериальной гипертензии, эффективно и обычно хорошо переносится лечение одним Микардисом в дозе до 160 мг или в комбинации с гидрохлортиазидом 12,5 мг – 25 мг в сутки.

Нарушение функции почек

У пациентов с почечной недостаточностью, в том числе у больных находящих на гемодиализе, коррекции режима дозирования не требуется. Телмисартан не удаляется из крови путем гемодиализа.

Нарушение функции печени

У пациентов с легкими и умеренными нарушениями функции печени суточная доза препарата не должна превышать 40 мг.

Пожилые люди

Режим дозирования не требует изменений.

Побочное действие

Со стороны нервной системы:

головная боль, головокружение, утомляемость, бессонница, тревожность, депрессия, судороги, зрительные нарушения.

Со стороны дыхательной системы:

инфекции верхних дыхательной путей (в т.ч. фарингит, синусит, бронхит), кашель.

Со стороны сердечно-сосудистой системы:

выраженное снижение артериального давления (включая ортостатическую гипотензию), брадикардия, тахикардия, боль в груди.

Со стороны пищеварительной системы:

Тошнота, рвота, диспепсия, диарея, абдоминальные боли, нарушение функции печени

Со стороны опорно-двигательной системы:

Миалгия, артралгия, боль в пояснице, симптомы подобные тендиниту, судороги ног.

Со стороны мочевыводящей системы

Нарушения функции почек, включая острую почечную недостаточность, периферические отеки, инфекции мочевыводящей системы (включая цистит), гиперкреатининемия.

Аллергические реакции:

кожная сыпь и др.

Лабораторные показатели:

В редких случаях возможны гиперкалиемия, анемия или гиперурикемия.

Прочие: гриппоподобный синдром.

Кроме того, в редких случаях, наблюдаются эритема, зуд, обморок, диспноэ, эозинофилия, тромбоцитопения, экзема, потливость.

Как и при использовании других антагонистов ангиотензина II, в редких случаях при назначении Микардиса наблюдались ангионевротический отек, крапивница.

Отмечались случаи повышения креатинфосфокиназы крови.

Передозировка

Случаи передозировки у людей не выявлены.

Симптомы: выраженное снижение артериального давления.

Лечение: в случае развития выраженного понижения артериального давления следует проводить симптоматическую терапию. Гемодиализ не эффективен.

Взаимодействия с другими лекарственными средствами

Может быть использован в комбинированной терапии с тиазидными диуретиками, например, с гидрохлоротиазидом, который усиливает гипотензивное действие телмисартана.

Телмисартан может усиливать гипотензивное действие и других гипотензивных препаратов.

Другие клинически значимые взаимодействия не выявлены.

Проведены фармакокинетические исследования нескольких препаратов, в том числе дигоксина, варфарина, гидрохлоротиазида, глибенкламида, ибупрофена, парацетамола, симвастатина и амлодипина. Отмечено увеличение средней концентрации дигоксина в плазме в среднем на 20% (в одном случае на 39%). При одновременном назначении телмисартана и дигоксина целесообразно периодическое определение концентрации дигоксина в крови.

При одновременном назначении ингибиторов ангиотензин-превращающего фермента и препаратов лития отмечалось обратимое увеличение концентрации лития в крови, сопровождающееся токсическим действием. В редких случаях подобные изменения зарегистрированы при назначении препаратов антагонистов рецепторов ангиотензина II. При одновременном назначении препаратов лития и антагонистов рецепторов ангиотензина II рекомендуется проводить определение концентрации лития в крови.

При одновременном назначении с нестероидными противовоспалительными средствами (включая ацетилсалициловую кислоту в дозе $\geq 0,3$ г в сутки и циклооксигеназы-2 (COX-2) ингибиторов) возможно развитие острой почечной недостаточности у пациентов с дегидратацией. Соединения, действующие на ренин-ангиотензивную систему как телмисартан, могут давать синергетический эффект. Пациенты,

принимающие НПВП и Микардис, должны быть адекватно гидратированы и у них необходимо мониторировать функцию почек в начале комбинированной терапии.

Уменьшение эффекта гипотензивных препаратов, таких как телмисартан, посредством ингибирования вазодилатации простагландинами, отмечалось при совместном лечении с НПВП.

Влияние на способность управлять автомобилем и машинным оборудованием

Специального исследования влияния препарата на способность управлять автомобилем и машинным оборудованием не проводились. Однако при управлении автомобилем и машинным оборудованием следует помнить о возможности развития головокружения и сонливости при применении препаратов используемых для лечения артериальной гипертензии.

Форма выпуска

Таблетки 20, 40 и 80 мг.

По 7 таблеток в блистер из полиамид/алюминий/ПВХ. По 2, 4, 8 или 14 блистеров вместе с инструкцией по применению в картонной коробке.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 30°C и в защищенном от влаги месте.

Хранить в недоступном для детей месте!

Список Б.

Срок годности

Микардис таблетки 40 мг и 80 мг - 4 года

Микардис таблетки 20 мг – 3 года

Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек: По рецепту

Производитель:

Берингер Ингельхайм Фарма ГмбХ и Ко.КГ, Германия

Германия, 55216 Ингельхайм-на-Рейне, Бингерштрассе 173

Представительство в Москве:

119049, Москва, ул. Донская, 29/9, строение 1

тел: (495) 411 – 78 – 01 , факс: (495) 411 – 78 – 02