

І Н С Т Р У К Ц І Я
для медичного застосування препарату
Кардосал 10 мг
(Cardosal 10 mg)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: olmesartan medoxomil; (5-метил-2-оксо-1,3-діоксолен-4-іл)метил 4-(1-гідрокси-1-метилетил)-2-пропіл-1-²-(1*H*-тетразол-5-іл)-1,1¹-біфеніл-4-іл метил -1*H*-імідазол-5-карбоксілат;

основні фізико-хімічні властивості: білі, круглі таблетки, вкриті оболонкою, з нанесеним тисненням “С13” з одного боку;

склад: 1 таблетка, вкрита оболонкою, містить 10 мг олмесартану медоксомілу;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, гідроксипропілцелюлоза, лактози моногідрат, гіпролоза, магнію стеарат, титану діоксид, Е 171, тальк; гіпромелоза.

Форми випуску. Таблетки, вкриті оболонкою.

Фармакотерапевтична група. Блокатори рецепторів ангіотензину II. Код АТС С 09С А08.

Фармакологічні властивості. *Фармакодинаміка.* Олмесартану медоксоміл є сильнодіючим, селективним антагоністом рецепторів (тип АТ₁) ангіотензину II, який гальмує дію ангіотензину II, які опосередковані рецептором АТ₁, незалежно від джерела і шляху синтезу ангіотензину II. Селективний антагонізм рецепторів АТ₁ ангіотензину II призводить до збільшення в плазмі реніну та концентрацій ангіотензину I і ангіотензину II, а також до деякого зменшення концентрації альдостерону в плазмі. При гіпертензії олмесартану медоксоміл викликає дозозалежне, тривале зниження артеріального тиску. Немає доказів щодо гіпотензії після прийому першої дози, тахіфілаксії під час тривалого лікування і синдрому відміни. Дозування олмесартану медоксомілу 1 раз на добу забезпечує ефективне і м'яке зниження артеріального тиску протягом 24 годин. Максимальний антигіпертензивний ефект досягається через 8 тижнів від початку терапії, хоч значний ефект зниження артеріального тиску спостерігається вже через 2 тижні лікування. *Фармакокінетика.* Олмесартану медоксоміл є пролікама. Він швидко перетворюється в фармакологічно активний метаболіт олмесартан під дією естераз у слизовій оболонці кишечника і в порталній крові під час абсорбції з травного тракту. В плазмі чи в продуктах виділення олмесартану медоксоміл, що не розпався, або незмінений боковий ланцюг медоксомільної групи не виявлялись. Середнє абсолютне значення біодоступності олмесартану з таблетованої лікарської форми становить 25,6%. Середнє максимальне значення (C_{max}) олмесартану в плазмі досягається приблизно через 2 години після внутрішнього застосування препарату і концентрація його в плазмі збільшується майже лінійно із збільшенням одноразової пероральної дози до 80 мг. Їжа практично не впливає на біодоступність олмесартану. Зв'язування олмесартану з білками плазми становить 99,7%, але потенціал для клінічно значущого зсуву величини зв'язування з білками при взаємодії олмесартану з іншими ліками, що мають високий ступінь зв'язування з білками, є низьким (це підтверджується тим, що відсутня клінічно значуща взаємодія між олмесартаном і варфарином). Олмесартан виводиться через нирки (приблизно 40%) і з жовчю (приблизно 60%), його період напіввиведення становить 10 – 15 годин. Кумуляція олмесартану не спостерігалась.

Показання для застосування. Есенціальна гіпертензія.

Спосіб застосування та дози. *Дорослі.* Початкова добова доза олмесартану медоксомілу – 10 мг. Якщо зменшення артеріального тиску недостатнє, то дозу збільшують до оптимальної добової дози – 20 мг. Якщо є потреба, то доза препарату може бути збільшена до максимальної добової дози – 40 мг. Препарат приймають щоденно, в один і той же час, незалежно від їди. *Пацієнти похилого віку.* Звичайно, немає необхідності в коригуванні дози для хворих похилого віку (див. рекомендовані дози для пацієнтів із порушенням функції нирок). За необхідності підвищення добової дози до максимальної, що становить 40 мг, треба проводити ретельний контроль артеріального тиску. *Пацієнти з порушенням функції нирок легкого або помірного ступеня, кліренс креатиніну 20 – 60 мл/хв.* Максимальна добова доза для таких пацієнтів – 20 мг. Для підсилення дії препарату застосовують гідрохлортiazид.

Побічна дія. Небажані дії по частоті виникнення розподіляються наступним чином: дуже часто (1/10); часто

(1/100, < 1/10); іноді (1/1000, < 1/100); рідко (1/10000, < 1/1000); дуже рідко (<1/10000), включаючи окремі повідомлення. Наступні повідомлення про небажані явища при застосуванні олмесартану медоксомілу надходили під час клінічних досліджень і в пост-маркетинговий період:

Клас системних порушень	Характер проявів	Частота проявів
Кардіоваскулярні порушення	Гіпотензія.	Рідко
	Стенокардія.	Іноді
Порушення з боку крові	Тромбоцитопенія.	Дуже рідко
Порушення з боку нервової системи	Запаморочення при обертанні голови	Іноді
	Запаморочення, головний біль.	Дуже рідко
Порушення з боку респіраторної системи	Бронхіт, фарингіт, риніт.	Часто
	Кашель.	Дуже рідко
Порушення з боку травного тракту	Діарея, диспепсія, гастроентерит.	Часто
	Абдомінальний біль, нудота, блювання.	Дуже рідко
Порушення з боку шкіри і під-шкірної тканини	Свербіж, екзантема, висип, ангіо-невротичний набряк, алергічний дер-матит, набряк обличчя, кропив'янка.	Дуже рідко
Порушення з боку скелетно-м'язової системи і сполучної тканини	Артрит, біль у спині, скелетний біль.	Часто
	Судоми м'язів, міалгія.	Дуже рідко
Порушення з боку нирок і сечо-вивідної системи	Гематурія, інфекція сечових шляхів.	Часто
	Гостра ниркова недостатність.	Дуже рідко
Загальні порушення	Біль у грудній клітці, гриппоподібні симптоми, периферичний набряк.	Часто
	Астенічний синдром (втомлюваність, сонливість, загальне нездужання).	Дуже рідко
Зміни з боку лабораторних параметрів	Збільшення креатин-фосфокінази, гіпер-тригліцеридемія, гіперурикемія.	Часто
	Гіперкаліємія.	Рідко
	Збільшення креатиніну і сечовини крові, підвищення ферментів печінки.	Дуже рідко

Протипоказання. Підвищена чутливість до діючої речовини або до одного з компонентів препарату, вагітність, період годування груддю, обструкція жовчовивідних шляхів, вік до 18 років.

Передозування. Стосовно передозування є лише обмежена інформація. Найвірогіднішим ефектом при передозуванні є гіпотензія. У разі передозування за пацієнтом треба уважно спостерігати і проводити симптоматичну, підтримуючу терапію, яка направлена на підвищення артеріального тиску. Даних про можливість виведення олмесартану медоксомілу шляхом діалізу немає.

Особливості застосування. За відсутності достатнього клінічного досвіду не рекомендують застосовувати олмесартану медоксоміл хворим з тяжкою нирковою недостатністю (кліренс креатиніну менше 20 мл/хв.), хворим з порушенням функції печінки. Якщо хворий до застосування олмесартану медоксомілу інтенсивно лікувався діуретиками, обмежував вживання солі з їжею або в нього була діарея чи/і блювання, то після прийому першої дози препарату може розвинути гіпотензія у результаті зменшеного об'єму крові. Тому слід усунути можливу гіповолемію перед початком лікування олмесартаном медоксомілом. Слід з обережністю призначати олмесартану медоксоміл хворим із серцевою недостатністю, хворобами нирок, при стенозі ниркової артерії обох або єдиної нирки, бо є можливість розвитку гострої гіпотензії, азотемії, олігурії, гострої ниркової недостатності. При лікуванні хворих з порушенням функції нирок рекомендується проводити періодичний контроль рівня сироваткового калію і креатиніну. Слід бути обережним при застосуванні олмесартану медоксомілу у хворих із стенозом аортального або мітрального клапанів або з обструктивною гіпертрофічною кардіоміопатією. Пацієнти з первинним альдостеронізмом не реагують на застосування інгібіторів ангіотензин-перетворюючого ферменту, тому їм не рекомендують застосовувати олмесартану медоксоміл. Треба пам'ятати, що надмірне зниження артеріального тиску у пацієнтів з ішемічною хворобою серця або з

церебральним атеросклерозом може призвести до розвитку інфаркту міокарда або інсульту. При застосуванні олмесартану медоксомілу зрідка можуть виникати запаморочення або втомлюваність, що слід враховувати пацієнтам, яким він призначений і які керують транспортними засобами чи/і обслуговують технічні засоби. Препарат містить лактозу, тому його не слід застосовувати хворим із спадковою непереносимістю галактози, недостатністю в організмі лактази або синдромі малабсорбції глюкози і галактози.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. При застосуванні з іншими антигіпертензивними засобами може посилюватись дія олмесартану медоксомілу. При одночасному застосуванні олмесартану медоксомілу з нестероїдними протизапальними препаратами може зменшуватись його антигіпертензивна дія і виникає ризик виникнення гострої ниркової недостатності. Після терапії антацидами (магнію-алюмінію-гідроксид) спостерігалось зменшення біодоступності олмесартану медоксомілу. Одночасне застосування варфарину і дигоксину не змінює фармакокінетику олмесартану. Не рекомендується застосовувати олмесартану медоксоміл з препаратами літію через підвищення токсичності останнього. У результаті можливої гіперкаліємії не рекомендується застосовувати олмесартану медоксоміл з калійзберігаючими діуретиками, препаратами, які містять калій, або з іншими препаратами, які можуть призводити до збільшення рівня калію у сироватці крові, наприклад з гепарином. При застосуванні олмесартану медоксомілу з правастатином клінічно значущих взаємодій не спостерігається. Взаємодія олмесартану медоксомілу з препаратами, які метаболізуються за допомогою ферменту цитохрому P 450 не визначена.

Умови та строки зберігання. Зберігати при температурі не вище 30 °С! Зберігати у недоступному для дітей місці! Термін придатності – 3 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. Блістер, в якому міститься 14 таблеток, вкритих оболонкою. В одній картонній коробочці знаходиться 1, 2, 4 або 7 блістерів.

Власник реєстрації.

Менаріні Інтернешонал Оперейшонс Люксембург С.А.
1, Авеню де ла Гар, L-1611 Люксембург.

Виробники.

Виробництво таблеток, вкритих оболонкою (in bulk):

Даїчі Санкіо Юроуп ГмбХ.

Луїпольдштрассе 1, 85276 Пфафенхофен, Німеччина.

Кінцеве пакування:

БЕРЛІН-ХЕМІ АГ (МЕНАРІНІ ГРУП).
Глінікер Вег 125, 12489 Берлін, Німеччина.