

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
КАСАРТ
(CASART)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: candesartan; (\pm)-1-hydroxyethyl-2-ethoxy-1-[p-(o-1H-tetrazol-5-ylphenyl)benzyl]-7-benzimidazole-carboxylate, cyclohexyl carbonate (ester);

основні фізико-хімічні властивості: таблетки білого або майже білого кольору, круглої форми, двоопуклі;

склад: 1 таблетка містить кандесартану цилексетилу 8 мг;

допоміжні речовини: лактоза, крохмаль кукурудзяний, гідроксипропілцелюлоза малозаміщена, кальцію карбоксиметилцелюлоза, магнію стеарат, макрогол (ПЕГ 6000).

Форма випуску. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Прості препарати антагоністів ангіотензину II.

Код АТС С09С А06.

Фармакологічні властивості. Касарт (кандесартан) являється антигіпертензивним препаратом, селективним антагоністом рецепторів ангіотензину II (типу АТ I). Дія кандесартану ґрунтується на гальмуванні ренін-ангіотензин-альдостеронової системи на рівні ангіотензинових рецепторів I типу для ангіотензиногену II.

Фармакодинаміка. Фармакологічна дія – антигіпертензивна. В процесі всмоктування у шлунково-кишковий тракт кандесартану цилексетил (проліки) піддається гідролізу з утворенням активної форми – кандесартану. Селективно блокує АТ₁ рецептори ангіотензину II, утворює з ними міцний зв'язок з подальшою повільною дисоціацією. Попереджає розвиток ефектів ангіотензину II – вазоконстрикцію, підвищення артеріального тиску, стимуляцію синтезу і вивільнення альдостерону, вазопресину, катехоламінів, реабсорбцію натрію, серцевих скорочень. Зменшує загальний периферичний опір судин (ЗПОС), підвищує нирковий кровотік, підтримує (або підвищує) клубочкову фільтрацію. Викликає компенсаторне підвищення активності реніну плазми, концентрації ангіотензину I і II. Гіпотензивний ефект розвивається поступово і триває до 24 год. Виражений терапевтичний ефект зазвичай досягається через 2-4 тижні після початку лікування.

Кандесартан, як антагоніст рецепторів до ангіотензиногену II, не впливає на метаболізм брадикініну та інших пептидів, що проявляється хорошою переносимістю терапії і, зокрема, достовірно рідкими випадками прояву кашлю.

Фармакокінетика. Абсолютна біодоступність кандесартану цилексетилу при прийомі внутрішньо складає 42 % (їжа не впливає на біодоступність). Максимальна концентрація (C_{max}) у плазмі досягається протягом 3-4 год. Концентрація кандесартану у плазмі пропорційно зростає при збільшенні доз в діапазоні 2-32 мг. Ступінь зв'язування з білками плазми (переважно з альбуміном) складає 99,8%, об'єм розподілу – 0,13 л/кг. Проникає крізь плацентарний бар'єр, не проходить крізь гематоенцефалічний бар'єр. Період напіввиведення препарату складає – 9 год. Плазмовий кліренс – 0,37 мл/хв/кг, нирковий кліренс – 0,19 мл/хв/кг. Кандесартан метаболізується у печінці (20-30 %) за участі цитохрому P₄₅₀ CYP2C з утворенням неактивної похідної. Повільно виводиться із сечею (33 %) і з жовчю (67 %) в основному у незміненому вигляді. Після одноразового прийому протягом 72 год екскретується більше 90% дози, не кумулює. У літніх хворих C_{max} збільшується на 50 %. АUC зростає на 78%.

Показання для застосування. Артеріальна гіпертензія (як монотерапія, так і в комбінації з іншими гіпотензивними препаратами), хронічна серцева недостатність.

Спосіб застосування та дози. Внутрішньо, незалежно від прийому їжі.

Дорослим і дітям старше 16 років: зазвичай 8-16 мг 1 раз на день. Доза підбирається індивідуально. Препарат можна приймати один або два рази на день при максимальній дозі 32 мг. Більші дози кращого ефекту не дають, і застосування їх вивчалось мало. Кращий антигіпертензивний ефект спостерігається у межах 2-х тижнів, а максимальне зниження кров'яного тиску спостерігається протягом 4-6 тижнів лікування препаратом.

Для пацієнтів літнього віку, а також для пацієнтів з помірними порушеннями функцій нирок та печінки коригування початкової дози не потрібне.

При вираженій нирковій недостатності (кліренс креатиніну менше 30 мл/хв/1,73 м²) лікування починають з низьких доз (4 мг).

Побічна дія. Частота розвитку побічних ефектів при прийомі кандесартану співставна з такою при прийманні плацебо. Можливі головний біль, головокружіння, нудота, блювота, діарея, загальна слабкість, артралгія, міалгія, біль у спині.

Протипоказання. Гіперчутливість до складових препарату, вагітність, період годування груддю, дитячий вік до 16 років, виражені порушення функції печінки і нирок.

Передозування. *Симптоми.* Виражена гіпотензія, запаморочення, тахікардія.

Лікування: симптоматична терапія; необхідний постійний контроль життєво важливих функцій. Гемодіаліз не є ефективним.

Особливості застосування. У пацієнтів з двостороннім стенозом ниркових артерій або стенозом ниркової артерії єдиної нирки можливо підвищення рівня сечовини і креатиніну в плазмі (необхідний регулярний контроль цих показників).

Слід дотримуватися обережності у хворих з вираженим зниженням об'єму циркулюючої крові, зумовленим, наприклад, прийомом високих доз діуретиків через небезпеку розвитку гіпотензії.

Препарат може знижувати психічні та/або фізичні реакції, які необхідні при виконанні потенційно небезпечних завдань, таких як керування транспортними засобами або робота з механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. Калійзберігаючі діуретики і препарати калію підвищують ризик розвитку гіперкаліємії.

Умови та термін зберігання. Зберігати у сухому місці при температурі від 15°C до 25°C.

Термін придатності – 2 роки з дати виготовлення in bulk.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. 10 таблеток у блістері, 1 блістер в пачці.

Виробник. ВАТ «Київмедпрепарат».

Адреса. Україна, 01032, м. Київ, вул. Саксаганського, 139.

Тел. (044) 490 7522.