

Опсамит - препарат применяется при легочной артериальной гипертензии.

Фармакологические свойства

Препарат содержит мацитентан, который воздействует на эндотелиновые рецепторы, образуя сложные структуры. Эндотелин-1 является универсальным медиатором, отвечающим за ряд процессов, включая пролиферацию на клеточном уровне, воспалительные и гипертрофические процессы, индукцию фиброзных структур и вазоконстрикцию. Благодаря воздействию **Опсамита** на группу эндотелиновых рецепторов возникают такие процессы:

- длительная блокада рецепторов, отвечающих за активность гладкомышечных клеток, устилающих легочные артерии;
- замедление и приостановка активации вторичных мессенджеров эндотелин опосредованного механизма;
- смягчаются последствия пролиферации и вазоконстрикции вышеуказанных клеток.

Опсамит обладает следующими фармакокинетическими характеристиками.

Механизм всасывания

Лекарство, попадая в желудочно-кишечный тракт, всасывается и накапливается в плазме крови пациента. Максимальная концентрация мацитентана наступает через 7-8 часов после приема начальной дозировки.

Снижение максимального количества действующего вещества: происходит медленно.

Полупериод усвоения мацитента и метаболитов: 16 и 48 часов соответственно.

Совместный прием с пищей: допускается, не влияет на конечное усвоение, всасывание, скорость образования метаболитов.

Способы распределения

Действие активного компонента и его метаболитов распространяется на большинство систем организма. До 99% вещества активно соединяется с белковыми структурами плазмы крови, включая:

- гликопротеины, кислые тип альфа-1;
- альбумин (максимальный уровень связывания).

Показатели распределения мацитентана и его метаболитов не превышают 50 и 40 литров, с учетом начальной дозировки.

Фармакокинетические особенности с учетом экстренных ситуаций

Эффективность действующего вещества и его активных метаболитов не зависит от популяционных характеристик, включая пол, нацию, возраст пациента, проживание в особых климатических зонах.

Людам, страдающим почечной недостаточностью, в средней и тяжелой форме, назначается индивидуальная доза Опсамита. Предельная концентрация мацитентана увеличивается в 1,3 и 1,6 раза соответственно, если клиренс креатинина меньше 30 мл в минуту и постоянно снижается.

•



Есть противопоказания. Посоветуйтесь с врачом.

Лечение грибка стопы



Теплые полы в Ташкенте



Емкости баки от 50л до 25.000л

С точки зрения официальной медицины, данное повышение не считается клинически важным. Пациенты, страдающие функциональными нарушениями печени, в легкой, средней и тяжелой форме, не отмечали особого дискомфорта и осложнений. Максимальная концентрация активного компонента снижалась до следующих показателей:

- мацитентан: 21, 34 и 6%;
- активный метаболит: 20, 25 и 25%.

Показания к применению

Легочная артериальная гипертензия II-III функциональных классов по классификации ВОЗ. Длительное лечение **Опсамитом** в качестве монотерапии или в составе комбинированной терапии у взрослых пациентов:

- с первичной (идиопатической и наследственной) легочной артериальной гипертензией;
- с легочной артериальной гипертензией и компенсированным врожденным неосложненным пороком сердца;
- с легочной артериальной гипертензией и заболеваниями соединительной ткани.

Способ применения

Препарат применяют внутрь в дозе 10 мг (1 таблетка **Опсамита**) 1 раз/сут, независимо от времени приема пищи.

Таблетку следует проглатывать целиком, запивая достаточным количеством воды. Препарат необходимо принимать каждый день в одно и то же время. Если пациент пропустил дозу **Опсамита**, ее нужно принять как можно быстрее и затем продолжить регулярный прием

препарата в обычное время. Не следует принимать одновременно 2 таблетки препарата, чтобы восполнить пропущенную дозу.

Противопоказания

- гиперчувствительность к мацитентану и/или любому из компонентов **Опсамита**;
- тяжелая степень печеночной недостаточности (10 баллов и выше по шкале Чайлд-Пью), как в случае диагностированного цирроза печени, так и без него;
- исходное повышение активности "печеночных" трансаминаз АЛТ и/или АСТ более чем в 3 раза по сравнению с ВГН;
- почечная недостаточность тяжелой степени (КК <30 мл/мин), в т.ч., и при необходимости диализа;
- беременность;
- грудное вскармливание;
- применение препарата у женщин с сохраненным детородным потенциалом, не пользующихся надежными методами контрацепции;
- возраст до 18 лет (ограниченный опыт клинического применения);
- редко встречающаяся врожденная непереносимость галактозы, дефицит лактазы и синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции, или повышенная чувствительность к белку сои (препарат содержит лактозу и лецитин, полученные из сои).

Применение при беременности и кормлении грудью

Средство обладает тератогенным эффектом. Подробных исследований по данному вопросу не проводилось. Большинство справочных материалов основываются на доклинических изысканиях.

Назначая терапию **Опсамитом**, лечащий врач предупреждает пациентку, в обязательном порядке, о необходимости контрацепции до начала курса и после его завершения, на протяжении 30 дней.

В период лактации, проводится отмена данного лекарства. Во время клинических тестов на животных, отмечена выраженная тестикулярная атрофия у самцов грызунов. Подобные исследования для людей не проводились.

Взаимодействие с другими лекарствами

Кетоконазол: совместное применение кетоконазола, мощного ингибитора изофермента СYP3A4, в дозе 400 мг 1 раз/сут сопровождалось двукратным повышением экспозиции **Опсамита** в плазме крови.

Следует избегать совместного применения **Опсамита** с мощными индукторами изофермента СYP3A4 (например, рифампицином, звербобом продырявленным, карбамазепином, фенитоином).

Побочные действия

Инфекционные и паразитарные заболевания: очень часто - назофарингит, бронхит; часто - фарингит, гриппоподобный синдром, инфекция мочевыводящих путей.

Со стороны системы кроветворения: очень часто - анемия.

Со стороны иммунной системы: нечасто - реакции гиперчувствительности на компоненты **Опсамита** (например, ангионевротический отек, кожный зуд, сыпь).

Со стороны нервной системы: очень часто - головная боль.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - выраженное снижение АД.

Со стороны дыхательной системы: часто - заложенность носа.

Общие реакции: очень часто - периферические отеки/задержка жидкости.

Условия хранения

Хранить в темном, хорошо защищенном от влаги месте, подальше от детей. Оптимальная температура для хранения и транспортировки - до +30 градусов. Максимальный срок годности - 36 месяцев.

Форма выпуска

В упаковке 28 таблеток по 10мг.

Состав

Действующее вещество: мацитентан, не менее 10 мг в одной таблетке.
Вспомогательные составляющие: целлюлоза, моногидрат лактозы, стеарат магния, полисорбаты.

Дополнительно

Повышение активности печеночных трансаминаз (АЛТ и АСТ) ассоциируется с ЛАГ и с применением других антагонистов рецепторов к эндотелину-1. Не следует начинать терапию **Опсамитом** при печеночной недостаточности тяжелой степени или при исходном повышении активности печеночных трансаминаз более чем в 3 раза по сравнению с ВГН. Необходимо проводить тесты для определения активности печеночных ферментов до начала лечения и в период лечения **Опсамитом**. Следует контролировать клиническое состояние пациентов для выявления признаков печеночной недостаточности и ежемесячно определять активность АЛТ и АСТ.