Вальсакор Н80



Код АТХ:

- C09DA03

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Валсартан
- Гидрохлоротиазид

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] [МНН] Википедия[МНН] [МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой розового цвета, овальные, двояковыпуклые.

	1 таб.
валсартан	80 мг
гидрохлоротиазид	12.5 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 41 мг, лактозы моногидрат - 17.125 мг, магния стеарат - 4.5 мг, кроскармеллоза натрия - 2.375, повидон - 1.5 мг, кремния диоксид коллоидный - 1 мг.

Состав пленочной оболочки: гипромеллоза - 2.8 мг, титана диоксид (Е171) - 0.86 мг, макрогол 4000 - 0.3 мг, краситель железа оксид красный (Е172) - 0.03 мг, краситель железа оксид желтый (Е172) - 0.01 мг.

14 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
14 шт. - блистеры (7) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Интермедианты

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Комбинированный антигипертензивный препарат, состоящий из блокатора рецепторов ангиотензина II и тиазидного диуретика.

Валсартан - селективный антагонист рецепторов ангиотензина II небелковой природы. Оказывает избирательное антагонистическое действие на рецепторы подтипа AT_1. Следствием блокады AT_1-рецепторов является повышение плазменной концентрации ангиотензина II, который может стимулировать незаблокированные рецепторы подтипа AT_2, что уравновешивает эффекты, связанные со стимуляцией AT_1-рецепторов. Валсартан не обладает агонистической активностью в отношении AT_1-рецепторов. Его сродство к рецепторам подтипа AT_1 примерно в 20 000 раз больше, чем к рецепторам подтипа AT_2. Валсартан не ингибирует АПФ, известный также под названием кининазы II, который превращает ангиотензин I в ангиотензин II и разрушает брадикинин. В связи с отсутствием влияния на АПФ эффекты брадикинина и субстанции Р не потенцируются, поэтому при приеме антагонистов рецепторов ангиотензина II маловероятно развитие сухого кашля. Валсартан не вступает во взаимодействие и не блокирует рецепторы других гормонов или ионные каналы, участвующие в регуляции функции сердечно-сосудистой системы.

При лечении артериальной гипертензии валсартан снижает АД, не влияя на ЧСС.

После приема внутрь разовой дозы валсартана антигипертензивный эффект развивается в течение 2 ч, а максимальное снижение АД достигается в течение 4-6 ч. Антигипертензивный эффект валсартана сохраняется в течение 24 ч. При повторных назначениях валсартана максимальное снижение АД, вне зависимости от дозы, достигается через 2-4 недели и сохраняется на достигнутом уровне в ходе длительной терапии. Комбинация с гидрохлоротиазидом позволяет достичь значимого дополнительного снижения АД.

Внезапное прекращение приема валсартана не сопровождается синдромом отмены (резким подъемом АД или другими нежелательными клиническими последствиями).

Гидрохлоротиазид - тиазидный диуретик. Снижает реабсорбцию ионов натрия, хлора, калия, магния, воды в дистальном отделе нефрона; задерживает выведение ионов кальция, мочевой кислоты. Обладает гипотензивным действием, которое обусловлено расширением артериол. Практически не оказывает влияния на нормальные показатели АД. Диуретический эффект развивается через 1-2 ч после приема препарата внутрь, достигает максимума через 4 ч и сохраняется в течение 6-12 ч. Антигипертензивное действие наступает через 3-4 дня, но для достижения оптимального терапевтического эффекта может потребоваться 3-4 недели.

Фармакокинетика

Валсартан

Всасывание и распределение

Валсартан быстро всасывается после приема внутрь, однако степень абсорбции варьируется в широких пределах. Средняя величина абсолютной биодоступности валсартана составляет 23%. Время, необходимое для достижения C_{max} - 2 ч. При приеме препарата внутрь 1 раз/сут накопление его незначительно. Плазменные концентрации валсартана одинаковы у мужчин и женщин.

Валсартан активно связывается с белками сыворотки крови (94-97%), преимущественно с сывороточным альбумином. V_d препарата небольшой, около 17 л. Плазменный клиренс относительно низкий (примерно 2 л/час) при сравнении с печеночным кровотоком (примерно 30 л/час).

При приеме валсартана с пищей уменьшается AUC на 48%. Тем не менее, через 8 ч после приема плазменные концентрации валсартана, принятого натощак или с пищей, одинаковы. Уменьшение AUC не сопровождается клинически значимым снижением терапевтическою эффекта валсартана, поэтому препарат можно применять независимо от приема пищи.

Метаболизм и выведение

Метаболизируется с помощью изофермента CYP2C9.

$T_{1/2}$ составляет 9 ч. Выводится преимущественно в неизмененном виде через кишечник (70%) и почки (30%).

При приеме валсартана с пищей уменьшается AUC на 48%. Тем не менее, через 8 ч после приема плазменные концентрации валсартана, принятого натощак или с пищей, одинаковы. Уменьшение AUC не сопровождается клинически значимым снижением терапевтическою эффекта валсартана, поэтому препарат можно применять независимо от приема пищи.

Гидрохлоротиазид

Всасывание и распределение

После приема внутрь всасывание гидрохлоротиазида составляет 60-80%. C_{max} гидрохлоротиазида в крови достигается через 2 ч после приема внутрь. Связывание с белками плазмы крови составляет 40-70%.

Метаболизм и выведение

Гидрохлоротиазид не метаболизируется и быстро выводится через почки (более 95%). $T_{1/2}$ составляет 6-15 ч.

Фармакокинетика у особых групп пациентов

Учитывая, что почечный клиренс составляет только 30% от величины общего клиренса, у пациентов с нарушением функции почек не требуется коррекции доз препарата. Т.к. степень связывания валсартана с белками плазмы крови высокая, выведение при гемодиализе маловероятно.

Около 83% валсартана выводится через кишечник, преимущественно в неизмененном виде. Валсартан не подвергается существенной биотрансформации, поэтому его системное действие не коррелирует со степенью нарушения функции печени. Поэтому у пациентов с печеночной недостаточностью небилиарного происхождения и при отсутствии холестаза не требуется изменения дозы валсартана. У больных с билиарным циррозом печени или обструкцией желчевыводящих путей AUC валсартана увеличивается примерно в 2 раза.

У некоторых пациентов пожилого возраста выявлено несколько большее системное воздействие валсартана по сравнению с молодыми добровольцами; однако не установлено, имеют ли эти различия клиническое значение. Системный клиренс гидрохлоротиазида снижается у пожилых пациентов, по сравнению с молодыми.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия (пациентам, которым показана комбинированная терапия).

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия

Противопоказания:

— выраженные нарушения функции печени, билиарный цирроз печени и непроходимость желчных путей (холестаз);

— анурия;

— выраженные нарушения функции почек (КК <30 мл/мин (0.5 мл/сек));

— гемодиализ;

— гипокалиемия, гипонатриемия, гиперкальциемия или гиперурикемия с клиническими проявлениями, рефрактерные к адекватной терапии;

— беременность;

— период лактации;

— возраст до 18 лет (эффективность и безопасность валсартана у детей не установлена);

— непереносимость галактозы, дефицит лактазы lapp или синдром нарушенного всасывания глюкозы/галактозы;

— повышенная чувствительность к валсартану, гидрохлоротиазиду, производным сульфонамида и к другим компонентам препарата.

С осторожностью: одновременное применение препаратов калия, калийсберегающих диуретиков, калийсодержащих заменителей пищевой соли и других средств, способных повышать уровень калия в крови (например, гепарин); хроническая сердечная недостаточность (IV функциональный класс по классификации NYHA); почечная недостаточность (КК >30 мл/мин (0.5 мл/сек)); умеренные нарушения функции печени; двусторонний или односторонний стеноз почечных артерий или стеноз артерии единственной почки; состояние после трансплантации почек; состояния, сопровождающиеся снижением ОЦК и/или ионов натрия (в т.ч. диарея, рвота); первичный гиперальдостеронизм; стеноз аортального и митрального клапанов; гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия; системная красная волчанка (СКВ), повышенная чувствительность к другим антагонистам рецепторов ангиотензина II; аллергические реакции и бронхиальная астма.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь, 1 раз/сут, независимо от приема пищи.

Вальсакор Н80 можно сочетать с другими антигипертензивными препаратами.

Пациентам, не достигшим целевого уровня АД на фоне монотерапии (валсартаном или гидрохлоротиазидом), рекомендуется фиксированная комбинация доз - Вальсакор Н80 (80/12.5 мг) 1 раз/сут. При недостаточности гипотензивного эффекта можно увеличить дозу препарата до максимальной суточной - 2 таб./сут Вальсакор Н80 или 1 таб./сут Вальсакор НД160.

Максимальный антигипертензивный эффект препарата Вальсакор Н80 (80/12.5 мг) развивается в течение 2-4 недель. При необходимости (уровень диастолического АД выше 100 мм рт. ст. на фоне монотерапии валсартаном) для достижения более выраженного эффекта возможно увеличение (не ранее чем через 4-8 недель) дозы препарата до 160/25 мг 1 раз/сут (возможно применение препарата Вальсакор НД160).

Пациентам с нарушениями функции почек (КК >30 мл/мин (0.5 мл/сек)) не требуется коррекции дозы препарата.

Максимально рекомендованная суточная доза препарата Вальсакор Н80 у **пациентов с нарушениями функции печени легкой и средней степени тяжести небилиарного происхождения** -1 таб./сут.

Пациентам пожилого возраста коррекции дозы не требуется.

Побочное действие:

Классификация частоты развития побочных эффектов (ВОЗ): очень часто (>1/10), часто (от >1/100 до <1/10), иногда (от >1/1000 до <1/100), редко (от >1/10 000 до <1/1000), очень редко (от <1/10 000, включая отдельные сообщения).

Нежелательные явления имели в целом слабовыраженный и преходящий характер.

Со стороны нервной системы: часто - общая слабость; иногда - повышенная утомляемость, астения, головокружение, в т.ч. постуральное, вертиго, бессонница; редко - головная боль, депрессия, парестезии, невралгия; очень редко - обморок (при применении после перенесенного инфаркта миокарда).

Со стороны дыхательной системы: часто - назофарингит; иногда - инфекции верхних отделов дыхательных путей, ринит, синусит, кашель; очень редко - респираторный дистресс-синдром с пневмонитом и отеком легких.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: иногда - боль в груди; часто - выраженное снижение АД и ортостатическая гипотензия; очень редко - аритмии; потенциально возможно - периферические отеки.

Со стороны пищеварительной системы: часто - диарея; иногда - тошнота, диспепсия, боль в животе; редко - гастроэнтерит, снижение аппетита, запор; очень редко - панкреатит, внутрипеченочный холестаз, желтуха.

Со стороны кожи и подкожных тканей: редко - кожная сыпь, фоточувствительность; очень редко - алопеция.

Со стороны костно-мышечной системы: иногда - боль в спине, конечностях, растяжение и разрывы связок и мышц или мышечных сухожилий, артрит, артралгия; редко - миалгия, мышечная слабость, судороги мышц.

Со стороны мочевыделительной системы: иногда - инфекции мочевыводящего тракта, вирусные инфекции, увеличение частоты мочеиспускания; очень редко - нарушение функции почек.

Со стороны половой системы: иногда - снижение либидо, импотенция (менее 1%).

Со стороны органов чувств: иногда - нарушение зрения; редко - шум в ушах, конъюнктивит.

Аллергические реакции: очень редко - ангионевротический отек, крапивница, кожная сыпь, зуд, реакции повышенной чувствительности, включая сывороточную болезнь и некротизирующий васкулит, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), волчаночноподобные реакции, обострение течения СКВ.

Лабораторные показатели: часто - гиперкалиемия, гипокалиемия, гипонатриемия, гипомагниемия, гиперкальциемия; редко - анемия, в т.ч. гемолитическая, лейкопения, агранулоцитоз, угнетение костного мозга, снижение концентрации гемоглобина и гематокрита, нейтропения, тромбоцитопения (иногда с пурпурой), гиперкреатининемия, гипербилирубинемия, повышение активности печеночных трансаминаз, повышение концентрации сывороточного азота мочевины.

Прочие: редко - повышенное потоотделение; очень редко - носовое кровотечение.

Передозировка:

Валсартан

Симптомы: выраженное снижение АД, которое может привести к головокружению, коллапсу и/или шоку со смертельным исходом.

Лечение: проведение симптоматической терапии; искусственная рвота и промывание желудка, прием активированного угля. При развитии артериальной гипотензии следует придать пациенту горизонтальное положение с низким изголовьем; провести мероприятия по восполнению ОЦК и коррекции нарушений водно-электролитного баланса. Гемодиализ неэффективен.

Гидрохлоротиазид

Симптомы: наиболее частые симптомы являются следствием дефицита электролитов (гипокалиемия, гипохлоремия, гипонатриемия) и дегидратации вследствие чрезмерного диуреза (тошнота, сонливость, аритмия, спазм мышц). При одновременном применении сердечных гликозидов гипокалиемия может усугублять течение аритмии.

Лечение: проведение симптоматической терапии.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Использование антагонистов рецепторов ангиотензина II не рекомендуется в I триместре беременности. Препарат противопоказан во II и III триместрах беременности, поскольку может вызвать фетотоксические эффекты (снижение функции почек, маловодие, замедление окостенения костей черепа плода) и неонатальные токсические эффекты (почечную недостаточность, артериальную гипотензию, гиперкалиемию). Если препарат применялся во II и III триместрах беременности необходимо провести УЗИ почек и костей черепа плода.

При планировании беременности рекомендуется перевести пациентку на альтернативную антигипертензивную терапию с учетом профиля безопасности. При установлении беременности препарат Вальсакор Н80 необходимо отменить как можно раньше.

Нет данных о выделении валсартана с грудным молоком. Однако известно, что валсартан проникает в молоко лактирующих крыс. Гидрохлоротиазид выделяется с грудным молоком. Поэтому при необходимости терапии препаратом Вальсакор Н80 в период лактации следует отменить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Валсартан

Не выявлено клинически значимого фармакокинетического взаимодействия с *циметидином, варфарином, дигоксином, атенололом, индометацином, гидрохлоротиазидом, амлодипином и глибенкламидом*.

Поскольку валсартан не подвергается существенному метаболизму, то не следует ожидать и значимого лекарственного взаимодействия, связанного с индукцией или ингибированием системы цитохрома Р450.

Одновременное применение *калийсберегающих диуретиков (спиронолактона, триамтерена, амилорида), калийсодержащих пищевых добавок, препаратов, повышающих уровень калия в сыворотке крови (ингибиторы АПФ, гепарин, циклоспорин)*, может привести к гиперкалиемии, в связи с чем требуется соблюдать осторожность.

Одновременный прием с другими *антигипертензивными средствами*, в т.ч. диуретиками приводит к усилению антигипертензивного эффекта.

При одновременном применении *препаратов лития* и антагонистов рецепторов ангиотензина II зарегистрированы случаи обратимого повышения содержания лития в сыворотке крови и повышение его токсичности. Рекомендуется регулярный контроль содержания лития в крови.

Гидрохлоротиазид

При одновременном применении с тиазидными диуретиками *этанол, барбитураты и средства для наркоза* могут потенцировать риск развития ортостатической гипотензии.

При одновременном применении с *гипогликемическими препаратами* (для приема внутрь и инсулин) может потребоваться коррекция дозы последних.

В комбинации с другими *антигипертензивными препаратами* - аддитивный эффект.

Холинолитики (например, атропин, бипериден) увеличивают биодоступность тиазидных диуретиков.

В присутствии анионных обменных смол *(колестирамин и колестипол)* всасывание гидрохлоротиазида уменьшается.

Кортикостероиды, АКТГ, слабительные препараты, амфотерицин В, карбеноксолон, бензатина бензилпенициллин,

салициловая кислота и салицилаты могут снижать содержание электролитов, приводя, в частности, к гипокалиемии. Рекомендуется регулярно контролировать содержание калия в крови.

Антиаритмические препараты класса Ia (хинидин, гидрохинидин, дизопирамид), антиаритмические средства III класса (амиодарон, дофетилид, ибутилид), соталол, некоторые нейролептики (тиоридазин, хлорпромазин, левомепромазин, трифтороперазин, циамемазин, сульпирид, сультоприд, амисульприд, тиаприд, пимозид, галоперидол, дроперидол), другие препараты (бепридил, цизаприд, дифеманил, эритромицин и винкамин для в/в введения, галофантрин, кетансерин, мизоластин, пентамидин, спарфлоксацин, терфенадин) при одновременном применении с гидрохлоротиазидом повышают риск развития аритмии типа "пируэт" на фоне возможной гипокалиемии и гипомагниемии. Следует регулярно контролировать содержание калия в крови.

Сердечные гликозиды увеличивают риск развития аритмии на фоне гипокалиемии и гипомагниемии.

Гидрохлоротиазид усиливает гипогликемический эффект *бета-адреноблокаторов и диазоксида*.

При одновременном применении с *урикозурическими препаратами (пробенецид, сульфинпиразон, аллопуринол)* возможно увеличение концентрации мочевой кислоты в крови, а также увеличение частоты развития реакций повышенной чувствительности к аллопуринолу; может потребоваться коррекция дозы урикозурических средств.

Гидрохлоротиазид может снижать эффект *прессорных аминов (например, эпинефрина, норэпинефрина).*

При одновременном применении с гидрохлоротиазидом увеличивается риск побочных эффектов *амантадина*.

При одновременном применении с *цитотоксическими препаратами (например, циклофосфамид, метотрексат*) уменьшается выведение последних и возможно потенцирование миелосупрессивного действия.

Гидрохлоротиазид может усилить эффект *миорелаксантов недеполяризующего типа действия (например, тубокурарина*).

При одновременном применении с *циклоспорином* увеличивается риск гиперурикемии и подагроподобных осложнений.

При одновременном применении с *тетрациклинами (кроме доксициклина)* возможно увеличение концентрации мочевины в сыворотке крови.

При одновременном применении *метилдопы* и гидрохлоротиазида описаны случаи гемолитической анемии.

Диуретики снижают почечный клиренс *лития* и повышают риск развития токсического действия лития; рекомендуется контроль содержания лития в крови.

НПВС, включая ингибиторы ЦОГ-2, (например, салициловая кислота, производные индолуксусной кислоты) могут снижать диуретический, натрийуретический и гипотензивный эффект диуретиков; возможно развитие острой почечной недостаточности.

Одновременное применение с *препаратами кальция, витамином D* может привести к повышению содержания кальция в крови, что может искажать результаты исследования функции паращитовидных желез.

Особые указания и меры предосторожности:

Пациенты с тяжелой хронической сердечной недостаточностью в стадии декомпенсации или другими состояниями, сопровождающимися стимуляцией РААС

Применение препарата Вальсакор Н80 у этой группы пациентов обычно сопровождается более выраженным снижением АД, однако при соблюдении рекомендаций по подбору доз лечение редко требует отмены из-за артериальной гипотензии. Терапию препаратом Вальсакор Н80 следует проводить с осторожностью. Вследствие подавления активности РААС у некоторых пациентов возможно развитие нарушения функции почек. При тяжелой хронической сердечной недостаточности возможно развитие олигурии и/или прогрессирующей азотемии вплоть до (в редких случаях) острой почечной недостаточности и/или смерти.

У пациентов с хронической сердечной недостаточностью необходим регулярный контроль функции почек, при одновременном назначении комбинации трех классов препаратов - ингибиторов АПФ, бета-адреноблокаторов и антагонистов рецепторов ангиотензина II (AT_1). Возможно назначение в комбинации с другими лекарственными средствами, назначаемыми после перенесенного инфаркта миокарда: тромболитики, ацетилсалициловая кислота, бета-адреноблокаторы и статины.

Пациенты с гипонатриемией и/или сниженным ОЦК

У пациентов с выраженной гипонатриемией и/или сниженным ОЦК, например, вследствие приема больших доз диуретиков, в редких случаях в начале терапии препаратом Вальсакор Н80 может развиться выраженная артериальная гипотензия. Перед началом лечения рекомендовано скорректировать нарушения водно-электролитного баланса, в частности, путем уменьшения доз диуретиков. При развитии артериальной гипотензии с

клиническими проявлениями необходимо придать пациенту горизонтальное положение с приподнятыми ногами, восполнить ОЦК и провести коррекцию нарушений водно-электролитного баланса. Терапию препаратом Вальсакор Н80 можно продолжить только после стабилизации показателей АД.

Стеноз почечной артерии

Безопасность применения препарата Вальсакор Н80 у пациентов с двусторонним или односторонним стенозом почечных артерий, а также стенозом артерии единственной почки не установлена (возможно повышение сывороточных концентраций мочевины и креатинина).

Нарушение функции почек

У пациентов с нарушениями функции почек (КК >30 мл/мин (более 0.5 мл/сек)) не требуется изменения доз препарата. Рекомендуется периодически контролировать содержание ионов калия, концентрацию креатинина и мочевой кислоты в сыворотке крови. Опыт применения препарата Вальсакор Н80 у пациентов с недавно перенесенной трансплантацией почек отсутствует.

Нарушение функции печени

Пациентам с нарушением функции печени рекомендуется принимать не более 80 мг валсартана в сутки. Валсартан выводится преимущественно через кишечник с желчью. У пациентов с обструктивными заболеваниями желчевыводящих путей наблюдалось уменьшение клиренса валсартана, поэтому в таких случаях препарат Вальсакор Н80 следует назначать с осторожностью.

Первичный гиперальдостеронизм

Вальсакор Н80 не рекомендован пациентам с первичным гиперальдостеронизмом.

СКВ

Имеются сообщения об обострении течения СКВ при применении тиазидных диуретиков.

Другие метаболические нарушения

Тиазидные диуретики могут изменять толерантность к глюкозе и повышать сывороточные концентрации холестерина, триглицеридов и мочевой кислоты.

Вальсакор Н80 содержит лактозу, поэтому препарат не следует назначать пациентам с наследственной непереносимостью галактозы, дефицитом лактазы lapp или синдромом нарушенного всасывания глюкозы-галактозы.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Пациентам необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортом и работе с другими сложными механизмами, требующей повышенного внимания, т.к. возможно развитие головокружения или слабости на фоне артериальной гипотензии.

При нарушениях функции почек

Пациентам с нарушениями функции почек (КК >30 мл/мин (0.5 мл/сек)) не требуется коррекции дозы препарата.

Противопоказано применение препарата при выраженных нарушениях функции почек (КК <30 мл/мин (0.5 мл/сек)).

С осторожностью следует применять препарат при почечной недостаточности (КК >30 мл/мин (0.5 мл/сек)), в т.ч. у пациентов, находящихся на гемодиализе, при двустороннем стенозе почечных артерий или стенозе артерии единственной почки.

При нарушениях функции печени

Максимально рекомендованная суточная доза препарата Вальсакор Н80 у **пациентов с нарушениями функции печени легкой и средней степени тяжести небилиарного происхождения** -1 таб./сут.

Применение препарата противопоказано при выраженных нарушениях функции печени, билиарном цирроз печени и непроходимости желчных путей (холестаз).

С осторожностью следует назначать препарат при умеренных нарушениях функции печени.

Применение в пожилом возрасте

Пациентам пожилого возраста коррекции дозы не требуется.

Применение в детском возрасте

Противопоказано: возраст до 18 лет (эффективность и безопасность применения валсартана у детей не доказана).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 30°С.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Valsakor_N80