

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата
ВАЛСАРТАН + ГИДРОХЛОРОТИАЗИД

Регистрационный номер: ЛП-005155

Торговое наименование: Валсартан + Гидрохлоротиазид

Международное непатентованное или группировочное наименование: валсартан+гидрохлоротиазид

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав на 1 таблетку 80 мг*12.5 мг:

Действующие вещества: валсартан – 80,00 мг; гидрохлоротиазид – 12.50 мг

Вспомогательные вещества: цеплюпода микрокристаллическая (МКЛ-101) – 35,20 мг; цеплюпода микрокристаллическая (МКЛ-102) – 36,00 мг; кроскарбомат натрия – 14,00 мг; пovidон-К25 – 5,00 мг; кремний дисоксид коллоидный – 2,70 мг; магния стеарат – 1,60 мг;

Состав оболочки: гипромелоза – 2,85 мг; пигмент диксиод – 1,40 мг; мацрогел – 4000 – 0,75 мг;

Состав на 1 таблетку 160 мг*12.5 мг:

Действующие вещества: валсартан – 160,00 мг; гидрохлоротиазид – 12.50 мг

Вспомогательные вещества: цеплюпода микрокристаллическая (МКЛ-101) – 35,20 мг; цеплюпода микрокристаллическая (МКЛ-102) – 72,00 мг; кроскарбомат натрия – 14,00 мг; пovidон-К25 – 10,00 мг; кремний дисоксид коллоидный – 5,40 мг; магния стеарат – 3,20 мг;

Состав оболочки: гипромелоза – 5,70 мг; пигмент диксиод – 2,70 мг; мацрогел – 4000 – 1,50 мг;

Описания:

Дозировка 80 мг – 12.5 мг: круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета. На изломе видны два слоя – ядро белого или почти белого цвета и пленочная оболочка.

Дозировка 160 мг – 12.5 мг: круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой от розового до светло-розового цвета. На изломе видны два слоя – ядро белого или почти белого цвета и пленочная оболочка.

Дозировка 160 мг – 25 мг: круглые двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета. На изломе видны два слоя – ядро белого или почти белого цвета и пленочная оболочка.

Фармакологическая группа: гипотензивное средство комбинированное (ангиотензина II рецепторов антагонист+диуретик).

Код ATC: S00A02D

Фармакологические свойства

Валсартан – Гидрохлоротиазид – комбинированный гипотензивный препарат, в состав которого входит антагонист рецепторов ангиотензина II и тиазидный диуретик.

Ангиотензин II является активным гормоном ренин-ангиотензин-альдостероновой системы (РААС) и образуется из ангиотензина I при участии ангиотензинпревращающего фермента (АПФ). Ангиотензин II связывается со специфическими рецепторами, расположеными на клоточных мембренах в различных тканях. Он имеет широкий спектр физиологических эффектов, включающих в первую очередь как непосредственное, так и опосредованное участие в регуляции артериального давления (АД). Являясь мощным сосудосуживающим средством, ангиотензин II вызывает прямой пресорный эффект. Кроме того, он стимулирует секрецию алдостерона и способствует задержке иона натрия.

Рецепторы АТ-1, ответственные за гипертензию, являются ангиотензин-II-рецепторами. Валсартан блокирует АТ-1-рецепторы, а диуретики – АТ-2-рецепторы. Поэтому валинаторин блокирует АТ-1-рецепторы, но не блокирует АТ-2-рецепторы, что уменьшает его действие на вазодилатацию и не блокирует рецепторы других гормонов или ионных каналов, участвующих в регуляции функций сердечно-сосудистой системы.

При приеме валсартана пациентов с артериальной гипертензией отмечается снижение артериального давления (АД), не сопровождающееся изменением частоты сердечных сокращений, повышением систолического давления в пределах 2 часов, а максимальное снижение АД достигается в пределах 4-6 часов. После приема препарата антигипертензивное действие сохраняется более 24 часов. При повторных назначениях препарата максимальное снижение АД, вне зависимости от принятой дозы, обычно достигается в пределах 24-недель и поддерживается до достижения уровня в ходе длительной терапии.

Резкое прекращение приема валсартана не сопровождается ростом повышенности последствиями.

В случае комбинации валинаторина с гидрохлоротиазидом достигается достоверное дополнительное снижение АД.

Гидрохлоротиазид – якобиновый гипотензивный препарат, который оказывает прямое антигипертензивное действие на почки. Валинаторин – тиазидный диуретик. Точкой применения действия тиазидных диуретиков являются кисты почек, склонные к перегородкам, расположенным в почках. При приеме препарата антигипертензивное действие сохраняется более 24 часов, а максимальное снижение АД достигается в пределах 4-6 часов. После приема препарата антигипертензивное действие сохраняется более 24 часов, а максимальное снижение АД, вне зависимости от принятой дозы, обычно достигается в пределах 24-недель и поддерживается до достижения уровня в ходе длительной терапии.

При приеме валсартана с гидрохлоротиазидом достигается достоверное дополнительное снижение АД.

Гидрохлоротиазид является тиазидным диуретиком на высокочувствительных рецепторах дистальных канальцев почек. При приеме препарата антигипертензивное действие на почки усиливается примерно в одинаковой степени. В результате диуретического действия наблюдается уменьшение объема склерозирующей крови (СУК), вследствие чего повышается активность ренина, секреция алдостерона, выведение ионами калия и, следовательно, снижение содержания калия в сыворотке крови.

Фармакокинетика

Валсартан

Валсартан. После приема внутрь всасывание гидрохлоротиазида происходит быстро, время достижения максимальной концентрации (T_{max}) – около 2 ч. В терапевтическом диапазоне доз средняя величина AUC возрастает пропорционально увеличению дозы. Одновременный прием гидрохлоротиазида с пищей может приводить как к увеличению, так и уменьшению концентрации валсартана в плазме крови, как в случае приема его натощак, так и в случае приема с пищей, выразившимся уменьшением концентрации валсартана в плазме крови.

Метаболизм. Валсартан не подвергается вымыканию метаболитам (около 20% дозы счищаются в виде валсартана). Данный факт подтверждается гипотензивным действием препарата.

Выведение. Фармокинетика кристаллов валсартана не имеет значительных мультифакториальных параметров (период полупревращения $T_{1/2}$ – 1 и $T_{1/2}$ около 9 ч). Валинаторин вырывается через кишечник (около 83%) и почками (около 13%) превышающими в неизмененном виде.

Метаболизм. Гидрохлоротиазид вырывается из почек в практически неизмененном виде.

В диапазоне изученных доз кинетика валсартана имеет линейный характер. При повторном применении валсартана изменений кинетических показателей не отмечалось. При приеме валсартана 1 раз в сутки кумулятивная незначительная. Концентрация валсартана в плазме крови у женщин и мужчин одинакова.

Метаболизм

Валсартан. Валсартан. После приема внутрь всасывание гидрохлоротиазида происходит быстро, время достижения максимальной концентрации (T_{max}) – около 2 ч. В терапевтическом диапазоне доз средняя величина AUC возрастает пропорционально увеличению дозы. Одновременный прием гидрохлоротиазида с пищей может приводить как к увеличению, так и уменьшению концентрации валсартана в плазме крови, как в случае приема его натощак, так и в случае приема с пищей, выразившимся уменьшением концентрации валсартана в плазме крови.

Метаболизм. Гидрохлоротиазид вырывается из почек в практически неизмененном виде.

Распределение. Валинаторин – якобиновый гипотензивный препарат, который оказывает прямое антигипертензивное действие на почки. Валинаторин – тиазидный диуретик. Точкой применения действия тиазидных диуретиков являются кисты почек, склонные к перегородкам, расположенные в почках. При приеме препарата антигипертензивное действие на почки усиливается примерно в одинаковой степени. В результате диуретического действия наблюдается уменьшение объема склерозирующей крови (СУК), вследствие чего повышается активность ренина, секреция алдостерона, выведение ионами калия и, следовательно, снижение содержания калия в сыворотке крови.

Фармакокинетика

Валинаторин

Валинаторин. После приема внутрь всасывание гидрохлоротиазида происходит быстро, время достижения максимальной концентрации (T_{max}) – около 2 ч. В терапевтическом диапазоне доз средняя величина AUC возрастает пропорционально увеличению дозы. Одновременный прием гидрохлоротиазида с пищей может приводить как к увеличению, так и уменьшению концентрации валсартана в плазме крови, как в случае приема его натощак, так и в случае приема с пищей, выразившимся уменьшением концентрации валсартана в плазме крови.

Метаболизм. Валинаторин не подвергается вымыканию метаболитами (около 10% дозы валсартана). Данный факт подтверждается гипотензивным действием препарата.

Выведение. Фармокинетика кристаллов валсартана не имеет значительных мультифакториальных параметров (период полупревращения $T_{1/2}$ – 1 и $T_{1/2}$ около 9 ч). Валинаторин вырывается через кишечник (около 83%) и почками (около 13%) превышающими в неизмененном виде.

Метаболизм. Гидрохлоротиазид вырывается из почек в практически неизмененном виде.

В диапазоне изученных доз кинетика валсартана имеет линейный характер. При повторном применении валсартана изменений кинетических показателей не отмечалось. При приеме валсартана 1 раз в сутки кумулятивная незначительная. Концентрация валсартана в плазме крови у женщин и мужчин одинакова.

Метаболизм

Валинаторин. Валинаторин. После приема внутрь всасывание гидрохлоротиазида происходит быстро, время достижения максимальной концентрации (T_{max}) – около 2 ч. В терапевтическом диапазоне доз средняя величина AUC возрастает пропорционально увеличению дозы. Одновременный прием гидрохлоротиазида с пищей может приводить как к увеличению, так и уменьшению концентрации валсартана в плазме крови, как в случае приема его натощак, так и в случае приема с пищей, выразившимся уменьшением концентрации валсартана в плазме крови.

Метаболизм. Гидрохлоротиазид вырывается из почек в практически неизмененном виде.

Распределение. Валинаторин – якобиновый гипотензивный препарат, который оказывает прямое антигипертензивное действие на почки. Валинаторин – тиазидный диуретик. Точкой применения действия тиазидных диуретиков являются кисты почек, склонные к перегородкам, расположенные в почках. При приеме препарата антигипертензивное действие на почки усиливается примерно в одинаковой степени. В результате диуретического действия наблюдается уменьшение объема склерозирующей крови (СУК), вследствие чего повышается активность ренина, секреция алдостерона, выведение ионами калия и, следовательно, снижение содержания калия в сыворотке крови.

Фармакокинетика

Валинаторин

Валинаторин. Валинаторин. После приема внутрь всасывание гидрохлоротиазида происходит быстро, время достижения максимальной концентрации (T_{max}) – около 2 ч. В терапевтическом диапазоне доз средняя величина AUC возрастает пропорционально увеличению дозы. Одновременный прием гидрохлоротиазида с пищей может приводить как к увеличению, так и уменьшению концентрации валсартана в плазме крови, как в случае приема его натощак, так и в случае приема с пищей, выразившимся уменьшением концентрации валсартана в плазме крови.

Метаболизм. Валинаторин не подвергается вымыканию метаболитами (около 10% дозы валсартана). Данный факт подтверждается гипотензивным действием препарата.

Выведение. Фармокинетика кристаллов валсартана не имеет значительных мультифакториальных параметров (период полупревращения $T_{1/2}$ – 1 и $T_{1/2}$ около 9 ч). Валинаторин вырывается через кишечник (около 83%) и почками (около 13%) превышающими в неизмененном виде.

Метаболизм. Гидрохлоротиазид вырывается из почек в практически неизмененном виде.

В диапазоне изученных доз кинетика валсартана имеет линейный характер. При повторном применении валсартана изменений кинетических показателей не отмечалось. При приеме валсартана 1 раз в сутки кумулятивная незначительная. Концентрация валсартана в плазме крови у женщин и мужчин одинакова.

Метаболизм

Валинаторин

Валинаторин. Валинаторин. После приема внутрь всасывание гидрохлоротиазида происходит быстро, время достижения максимальной концентрации (T_{max}) – около 2 ч. В терапевтическом диапазоне доз средняя величина AUC возрастает пропорционально увеличению дозы. Одновременный прием гидрохлоротиазида с пищей может приводить как к увеличению, так и уменьшению концентрации валсартана в плазме крови, как в случае приема его натощак, так и в случае приема с пищей, выразившимся уменьшением концентрации валсартана в плазме крови.

Метаболизм. Гидрохлоротиазид вырывается из почек в практически неизмененном виде.

Распределение. Валинаторин – якобиновый гипотензивный препарат, который оказывает прямое антигипертензивное действие на почки. Валинаторин – тиазидный диуретик. Точкой применения действия тиазидных диуретиков являются кисты почек, склонные к перегородкам, расположенные в почках. При приеме препарата антигипертензивное действие на почки усиливается примерно в одинаковой степени. В результате диуретического действия наблюдается уменьшение объема склерозирующей крови (СУК), вследствие чего повышается активность ренина, секреция алдостерона, выведение ионами калия и, следовательно, снижение содержания калия в сыворотке крови.

Фармакокинетика

Валинаторин

Валинаторин. Валинаторин. После приема внутрь всасывание гидрохлоротиазида происходит быстро, время достижения максимальной концентрации (T_{max}) – около 2 ч. В терапевтическом диапазоне доз средняя величина AUC возрастает пропорционально увеличению дозы. Одновременный прием гидрохлоротиазида с пищей может приводить как к увеличению, так и уменьшению концентрации валсартана в плазме крови, как в случае приема его натощак, так и в случае приема с пищей, выразившимся уменьшением концентрации валсартана в плазме крови.

Метаболизм. Гидрохлоротиазид вырывается из почек в практически неизмененном виде.

В диапазоне изученных доз кинетика валсартана имеет линейный характер. При повторном применении валсартана изменений кинетических показателей не отмечалось. При приеме валсартана 1 раз в сутки кумулятивная незначительная. Концентрация валсартана в плазме крови у женщин и мужчин одинакова.

Метаболизм

Валинаторин

Валинаторин. Валинаторин. После приема внутрь всасывание гидрохлоротиазида происходит быстро, время достижения максимальной концентрации (T_{max}) – около 2 ч. В терапевтическом диапазоне доз средняя величина AUC возрастает пропорционально увеличению дозы. Одновременный прием гидрохлоротиазида с пищей может приводить как к увеличению, так и уменьшению концентрации валсартана в плазме крови, как в случае приема его натощак, так и в случае приема с пищей, выразившимся уменьшением концентрации валсартана в плазме крови.

Метаболизм. Гидрохлоротиазид вырывается из почек в практически неизмененном виде.