Инструкция по применению
Диасек капсулы 100 мг 10 шт

Характеристики

Форма выпуска: Капсулы
Страна: Россия
Производитель: Обнинская химико-фармацевтическая компания
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Рацекадотрил
Количество в упаковке: 10
Дозировка действующего вещества: 100 мг



Описание

Средства, действующие на ренин-ангиотензиновую систему. Комбинированные препараты ингибиторов ангиотензина II. Антагонисты ангиотензина II и диуретики.

Действующее вещество

Рацекадотрил

Состав

гидрохлоротиазид 12.5 мг телмисартан 80 мг Вспомогательные вещества: меглюмин - 24 мг, натрия гидроксид - 6.72 мг, повидон К30 - 27.1 мг, полисорбат 80 - 1.3 мг, маннитол - 479.38 мг, лактозы моногидрат - 92.5 мг, магния стеарат - 12.15 мг, краситель железа оксид красный (Е172) - 0.35 мг.

Форма выпуска

Капсулы

Фармакокинетика

Одновременное применение гидрохлоротиазида и телмисартана не оказывает влияния на фармакокинетику каждого из компонентов препарата. Телмисартан При приеме внутрь быстро всасывается из ЖКТ. Биодоступность – примерно 50%. Cmax телмисартана достигается в течение 0.5-1.5 ч после применения. При приеме одновременно с пищей снижение AUC колеблется от 6% (при применении в дозе 40 мг) до 19% (при применении в дозе 160 мг). Через 3 ч после приема внутрь концентрация в плазме крови выравнивается, независимо от приема пищи. Связывание с белками плазмы крови значительное (более 99.5%), в основном с альбумином и #1-гликопротеином. Vd приблизительно 500 л. Метаболизируется телмисартан путем конъюгирования с глюкуроновой кислотой. Метаболиты фармакологически неактивны. T1/2 составляет более 20 ч. Выводится через кишечник в неизмененном виде, выведение почками – менее 2%. Общий плазменный клиренс высокий (около 900 мл/мин). Исследования фармакокинетики у пациентов с печеночной недостаточностью показали увеличение абсолютной биодоступности практически до 100%. При печеночной недостаточности T1/2 не изменяется. Гидрохлоротиазид После приема внутрь Cmax гидрохлоротиазида достигается в течение 1-3 ч. Абсолютная биодоступность оценивается по кумулятивной почечной экскреции гидрохлоротиазида и составляет около 60%. Связывание с белками плазмы крови составляет 40-70%. Vd - 0.8±0.3 л/кг. Не метаболизируется в организме человека и выводится с мочой практически в неизмененном виде. Около 60% дозы принятой внутрь выводится в течение 48 ч. Почечный клиренс составляет около 250-300 мл/мин. T1/2 - 10-15 ч. Наблюдается разница в плазменных концентрациях у мужчин и женщин. У женщин имеется тенденция к клинически значимому увеличению в плазме крови концентрации гидрохлоротиазида. У пациентов с нарушенной функцией почек скорость выведения гидрохлоротиазида снижена. Исследования, проведенные с участием пациентов с КК 90 мл/мин, показали, что T1/2 гидрохлоротиазида увеличивается. У пациентов со сниженной функцией почек T1/2 около 34 ч.

Показания

Артериальная гипертензия (при неэффективности телмисартана или гидрохлоротиазида в виде монотерапии).

Способ применения и дозы

Способ применения и режим дозирования конкретного препарата зависят от его формы выпуска и других факторов. Оптимальный режим дозирования определяет врач. Следует строго соблюдать соответствие используемой лекарственной формы конкретного препарата показаниям к применению и режиму дозирования. Принимают внутрь 1 раз/сут. Разовая доза комбинации телмисартан+гидрохлоротиазид составляет от 40 мг/12.5 мг до 80 мг/25 мг. У пациентов с артериальной гипертензией тяжелой степени максимальная суточная доза телмисартана 160 мг/сут. Данная доза была эффективна и хорошо переносилась. У пациентов с нарушениями функции печени легкой и средней степени (класс А и В по шкале Чайлд-Пью) данную комбинацию не следует применять в суточной дозе более 40 мг/12.5 мг.

Противопоказания

Обструктивные заболевания желчевыводящих путей; выраженные нарушения функции печени (класс С по шкале Чайлд-Пью); выраженные нарушения функции почек (КК С осторожностью: двусторонний стеноз почечных артерий или стеноз артерии единственной почки; нарушения функции печени или прогрессирующие заболевания печени (класс А и В по шкале Чайлд-Пью); снижение ОЦК вследствие предшествующей терапии диуретиками, ограничения приема поваренной соли, диареи или рвоты; гиперкалиемия; состояние после трансплантации почки (опыт применения отсутствует); хроническая сердечная недостаточность III-IV ФК по классификации NYHA; стеноз аортального и митрального клапана; идиопатический гипертрофический субаортальный стеноз; гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия; сахарный диабет; первичный альдостеронизм; подагра; закрытоугольная глаукома (в связи с наличием в составе гидрохлоротиазида).

Применение при беременности и кормлении грудью

Противопоказано применение при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Побочные действия

Со стороны дыхательной системы: респираторный дистресс-синдром (включая пневмонию и отек легких), одышка. Со стороны сердечно-сосудистой системы: аритмии, тахикардия, брадикардия, выраженное снижение АД (включая ортостатическую гипотензию). Со стороны нервной системы: синкопе/обморок, парестезии, нарушения сна, бессонница, головокружение, тревога, депрессия, повышенная возбудимость, головная боль. Со стороны пищеварительной системы: диарея, сухость слизистой оболочки полости рта, метеоризм, боль в животе, запор, рвота, гастрит, снижение аппетита, анорексия, гипергликемия, гиперхолестеринемия, панкреатит, нарушение функции печени, желтуха (гепатоцеллюлярная или холестатическая), диспепсия. Со стороны кожных покровов: повышенное потоотделение. Со стороны костно-мышечной системы: боль в спине, спазмы мышц, миалгия, артралгия, судороги икроножных мышц, артроз, тендинитоподобные симптомы, боль в грудной клетке. Со стороны системы кроветворения: железодефицитная анемия, апластическая анемия, гемолитическая анемия, тромбоцитопения, эозинофилия, лейкопения, нейтропения/агранулоцитоз, тромбоцитопения. Со стороны мочевыделительной системы: почечная недостаточность, включая острую почечную недостаточность, интерстициальный нефрит, глюкозурия. Со стороны органов чувств: нарушение зрения, преходящая нечеткость зрения, ксантопсия, острая закрытоугольная глаукома, острая миопия. Со стороны репродуктивной системы: импотенция. Инфекции: сепсис, включая случаи с летальным исходом, инфекции верхних дыхательных путей (бронхит, фарингит, синусит), инфекции мочевыводящих путей (включая цистит), воспаление слюнных желез. Со стороны обмена веществ: повышение концентрации креатинина в плазме крови, повышение активности печеночных ферментов, повышение активности КФК, повышение концентрации мочевой кислоты крови, гипертриглицеридемия, гипокалиемия, гиперкалиемия, гипонатриемия, гиперурикемия, снижение ОЦК, гипогликемия (у пациентов с сахарным диабетом), нарушение толерантности к глюкозе, снижение уровня гемоглобина в крови. Аллергические реакции: ангионевротический отек (включая случаи с летальным исходом), эритема, кожный зуд, сыпь, анафилактические реакции, экзема, лекарственная сыпь, токсический эпидермальный некролиз, волчаночноподобные реакции, обострение или усиление симптомов системной красной волчанки, некротический васкулит, системный васкулит, реакция фотосенсибилизации, рецидив системной красной волчанки, васкулит. Прочие: гриппоподобный синдром, лихорадка, слабость.

Передозировка

Информация о передозировке тельмизартана у людей ограничено. Уровень вывода гидрохлоротиазида путем гемодиализа не установлена. Симптомы. При передозировке тельмизартана наиболее выраженными проявлениями были артериальная гипотензия и тахикардия также сообщается о брадикардии, головокружение, рвота, повышение концентрации креатинина в сыворотке крови и острую почечную недостаточность. С передозировкой гидрохлоротиазида связывают снижение концентрации электролитов (гипокалиемии, гипохлоремия) и гиповолемию вследствие чрезмерного диуреза. Самыми распространенными симптомами передозировки являются тошнота и сонливость. Гипокалиемия может привести к мышечному спазму и / или обострение сердечной аритмии при одновременном применении гликозидов группы наперстянки или определенных антиаритмических препаратов. Лечение. Тельмизартан не удаляется путем гемодиализа. Больные должны находиться под пристальным контролем и получать симптоматическую и поддерживающую терапию. Терапия зависит от времени приема препарата и тяжести симптомов. Рекомендуемые мероприятия включают вызывание рвоты и / или промывание желудка. При лечении передозировки можно применять активированный уголь. Необходимо контролировать уровень электролитов и креатинина в сыворотке. При возникновении артериальной гипотензии пациента следует положить на спину и оказать помощь, направленную на быстрое восполнение объема жидкости и соли в организме.

Взаимодействие с другими препаратами

Телмисартан Другимие антигипертензивные средства - возможно усиление гипотензивного эффекта. Препараты лития- редко отмечалось обратимое увеличение концентрации лития в крови, сопровождающееся токсическими явлениями. При одновременном применении препаратов лития и антагонистов рецептора ангиотензина II рекомендуется проводить определение содержания лития в крови; НПВС, включая ацетилсалициловую кислоту в дозах, применяемых в качестве противовоспалительного средства, ингибиторы ЦОГ-2 и неселективные НПВС - возможно развитие острой почечной недостаточности у пациентов со сниженным ОЦК. Препараты, влияющие на РААС, могут обладать синергическим эффектом. У пациентов, получающих НПВС и телмисартан, в начале лечения следует компенсировать ОЦК и провести исследование функции почек. Снижение эффекта антигипертензивных средств, таких как телмисартан, посредством ингибирования сосудорасширяющего эффекта простагландинов отмечалось при совместном лечении с НПВС. При одновременном применении телмисартана с ибупрофеном или парацетамолом не было выявлено клинически значимого эффекта. Дигоксин -

отмечено увеличение средней концентрации дигоксина в плазме крови в среднем на 20% (в одном случае на 39%). При одновременном назначении телмисартана и дигоксина целесообразно проводить периодическое определение концентрации дигоксина в крови. Гидрохлоротиазид Этанол, барбитураты, опиоидные анальгетики - риск развития ортостатической гипотензии. Гипогликемические препараты для приема внутрь и инсулин - может потребоваться коррекция дозы гипогликемических средств для приема внутрь и инсулина. Метформин - существует риск развития молочнокислого ацидоза. Колестирамин и колестипол - в присутствии анионных обменных смол нарушается всасывание гидрохлоротиазида. Сердечные гликозиды - повышается риск развития гипокалиемии или гипомагниемии, вызываемых тиазидными диуретиками, развития аритмий, вызываемых сердечными гликозидами. Прессорные амины (например, норэпинефрин) - возможно ослабление эффекта прессорных аминов. Недеполяризующие миореклаксанты (например, тубокурарина хлоридом) - гидрохлоротиазид может усиливать эффект недеполяризующих миореклаксантов; Противоподагрические средства - возможно повышение концентрации мочевой кислоты в сыворотке крови, поэтому могут потребоваться изменения дозы урикозурических средств. Применение тиазидных диуретиков увеличивает частоту развития реакций повышенной чувствительности на аллопуринол. Препараты кальция - тиазидные диуретики могут повышать содержание кальция в сыворотке крови вследствие уменьшения его выведения почками. Если требуется применять препараты кальция, следует регулярно контролировать содержание кальция в крови и, при необходимости, изменять дозу препаратов кальция. Бета-адреноблокаторы и диазоксид - тиазидные диуретики могут усиливать гипергликемию, вызываемую бета-адреноблокаторами и диазоксидом; М-холиноблокаторы (например, атропин, биперидин) - уменьшение моторики ЖКТ, увеличение биодоступности тиазидных диуретиков. Амантадин - тиазидные диуретики могут увеличивать риск нежелательных эффектов, вызываемых амантадином. Цитотоксические средства (например, циклофосфамид, метотрексат) - уменьшение почечной экскреции цитотоксических средств и усиление их миелосупрессивного действия. НПВС - совместное применение с тиазидными диуретиками может привести к снижению диуретического и антигипертензивного эффекта. Средствами, которые приводят к выведению калия и гипокалиемии (например, диуретиками, выводящими калий, слабительными средствами; глюко- и минералокортикоидами; кортикотропином; амфотерицином В; карбеноксолоном; бензилпенициллином, производными ацетилсалициловой кислоты) - усиление гипокалиемического эффекта. Гипокалиемия, вызываемая гидрохлоротиазидом, компенсируется калийсберегающим эффектом телмисартана. Калийсберегающие диуретики, препараты калия, другие средства, способные повышать содержание калия в сыворотке крови (например, гепарин) или замена натрия в поваренной соли солями калия - возможно развитие

гиперкалиемии. Рекомендуется периодический контроль содержания калия в плазме крови в случаях, когда комбинация телмисартан+гидрохлоротиазид применяется одновременно с препаратами, которые могут вызывать гипокалиемию, а также с препаратами, способными повышать содержание калия в сыворотке крови.

Особые указания

У некоторых пациентов, вследствие подавления активности РААС, особенно при одновременном назначении лекарственных средств, действующих на эту систему, нарушается функция почек (включая острую почечную недостаточность). Поэтому терапия, сопровождающаяся подобной двойной блокадой РААС (например, при добавлении ингибитора АПФ или прямого ингибитора ренина - алискирена к блокаторам антагонистов рецепторов ангиотензина II), должна проводиться строго индивидуально и при регулярном контроле функции почек (в т.ч. периодический контроль содержания калия и креатинина в сыворотке крови). Применение тиазидных диуретиков у пациентов с нарушениями функции почек может приводить к азотемии. Рекомендуется периодический контроль функции почек. У пациентов с двусторонним стенозом почечных артерий или стенозом артерии единственной функционирующей почки при применении лекарственных препаратов, влияющих на РААС, повышается риск развития выраженной артериальной гипотензии и почечной недостаточности. У пациентов с нарушениями функции печени или прогрессирующими заболеваниями печени данную комбинацию следует применять с осторожностью, поскольку даже небольшие изменения со стороны водно-электролитного баланса могут способствовать развитию печеночной комы. У пациентов с сахарным диабетом может потребоваться изменение дозы инсулина или гипогликемических средств для приема внутрь. Во время проведения терапии тиазидными диуретиками возможна манифестация латентно протекающий сахарный диабет. В некоторых случаях при применении тиазидных диуретиков возможно развитие гиперурикемии и обострения течения подагры. У пациентов с сахарным диабетом и дополнительным сердечно-сосудистым риском, например, у пациентов с сахарным диабетом и ИБС, в случае применения препаратов, снижающих АД, таких как антагонисты рецепторов ангиотензина II или ингибиторы АПФ, может повышаться риск фатального инфаркта миокарда и внезапной сердечно-сосудистой смерти. У пациентов с сахарным диабетом ИБС может протекать бессимптомно и поэтому может быть недиагностированной. Перед началом применения данной комбинации для выявления и лечения ИБС следует проводить соответствующие диагностические исследования, в т.ч. пробу с физической нагрузкой. Гидрохлоротиазид, являясь производным сульфонамида, может вызвать идиосинкратическую реакцию в виде острой транзиторной миопии и острой закрытоугольной глаукомы. Симптомами этих

нарушений являются неожиданное снижение остроты зрения или боль в глазах, которые в типичных случаях возникают в течение от нескольких часов до нескольких недель после начала применения препарата. Если не проводится лечение, острая закрытоугольная глаукома может привести к потере зрения. Основное лечение состоит в как можно более быстрой отмене гидрохлоротиазида. Необходимо иметь в виду, что, если внутриглазное давление остается неконтролируемым, может потребоваться неотложное консервативное или хирургическое лечение. К факторам риска развития острой закрытоугольной глаукомы можно отнести сведения об аллергии к сульфонамидам или пенициллину в анамнезе. Тиазидные диуретики, в т.ч. гидрохлоротиазид, могут вызывать нарушения водно-электролитного баланса и кислотно-основного состояния (гипокалиемию, гипонатриемию и гипохлоремический алкалоз). Признаками, настораживающими в отношении этих нарушений, являются сухость слизистой оболочки полости рта, чувство жажды, общая слабость, сонливость, чувство беспокойства, миалгия или судорожные подергивания икроножных мышц (крампи), мышечная слабость, выраженное снижение АД, олигурия, тахикардия и такие желудочно-кишечные нарушения, как тошнота или рвота. В период лечения данной комбинацией необходим периодический контроль содержания электролитов в сыворотке крови. При применении данной комбинации риск гипокалиемии более вероятен у пациентов с циррозом печени, при усиленном диурезе, при соблюдении бессолевой диеты, а также в случае одновременного применения глюко- и минералокортикоидов или кортикотропина; к факторам риска развития гиперкалиемии относятся почечная и/или сердечная недостаточность и сахарный диабет. Тиазидные диуретики могут уменьшать выведение кальция почками и вызывать (при отсутствии явных нарушений метаболизма кальция) преходящее и небольшое повышение содержания кальция в сыворотке крови. Более выраженная гиперкальциемия может быть признаком скрытого гиперпаратиреоза. Перед проведением оценки функции паращитовидных желез тиазидные диуретики следует отменить. Показано, что тиазидные диуретики увеличивают выведение магния почками, что может привести к гипомагниемии. У пациентов с ИБС применение любого антигипертензивного средства, в случае чрезмерного снижения АД, может привести к инфаркту миокарда или инсульту. Имеются сообщения о развитии СКВ при применении тиазидных диуретиков. Данная комбинация, при необходимости, применяться в сочетании с другими антигипертензивными средствами. Нарушения функции печени при назначении телмисартана в большинстве случаев наблюдались у жителей Японии. Данная комбинация менее эффективен у пациентов негроидной расы. Влияние на способность к управлению транспортными средствами и механизмами В период лечения следует учитывами возможность развития головокружения и сонливости, что требует соблюдения осторожности.