

[Лозап](#)



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Лозартан](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)
[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}
[PLC VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, продолговатые, двояковыпуклые.

	1 таб.
лозартан калия	12.5 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, маннитол, кросповидон, кремния диоксид коллоидный безводный, тальк, магния стеарат.

Состав пленочной оболочки: сепифилм 752 белый (гипромеллоза, целлюлоза микрокристаллическая, макрогола 2000 стеарат, титана диоксид), макрогол 6000.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, продолговатые, двояковыпуклые, с риской с обеих сторон.

	1 таб.
лозартан калия	50 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, маннитол, кросповидон, кремния диоксид коллоидный безводный, тальк, магния стеарат.

Состав пленочной оболочки: сепифилм 752 белый (гипромеллоза, целлюлоза микрокристаллическая, макрогола 2000 стеарат, титана диоксид), макрогол 6000.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, продолговатые, двояковыпуклые, с риской с обеих сторон.

	1 таб.
лозартан калия	100 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, маннитол, кросповидон, кремния диоксид коллоидный безводный, тальк, магния стеарат.

Состав пленочной оболочки: сепифилм 752 белый (гипромеллоза, целлюлоза микрокристаллическая, макрогола 2000 стеарат, титана диоксид) макрогол 6000.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

10 шт. - блистеры (6) - пачки картонные.

10 шт. - блистеры (9) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антигипертензивный препарат. Специфический антагонист рецепторов ангиотензина II (подтип AT₁). Не подавляет киназазу II – фермент, который катализирует реакцию превращения ангиотензина I в ангиотензин II. Снижает ОПСС, концентрацию в крови адреналина и альдостерона, АД, давление в малом круге кровообращения; уменьшает постнагрузку, оказывает диуретическое действие. Препятствует развитию гипертрофии миокарда, повышает толерантность к физической нагрузке у пациентов с хронической сердечной недостаточностью. Лозартан не ингибирует АПФ-киназазу II и соответственно не препятствует разрушению брадикинина, поэтому побочные эффекты, опосредованно связанные с брадикинином (например, ангионевротический отек) возникают достаточно редко.

У пациентов с артериальной гипертензией без сопутствующего сахарного диабета с протеинурией (более 2 г/сут), применение препарата достоверно снижает протеинурию, экскрецию альбумина и иммуноглобулинов G.

Стабилизирует уровень мочевины в плазме крови. Не влияет на вегетативные рефлексы и не оказывает длительного воздействия на концентрацию норадреналина в плазме крови. Лозартан в дозе до 150 мг/сут не влияет на уровень триглицеридов, общего холестерина и холестерина ЛПВП в сыворотке крови у пациентов с артериальной гипертензией. В этой же дозе лозартан не влияет на уровень глюкозы в крови натощак.

После однократного приема внутрь гипотензивное действие (снижается систолическое и диастолическое АД) достигает максимума через 6 ч, затем в течение 24 ч постепенно снижается.

Максимальный гипотензивный эффект развивается через 3-6 недель после начала приема препарата.

Фармакокинетика

Всасывание

При приеме внутрь лозартан хорошо всасывается, и при этом подвергается метаболизму при "первом прохождении" через печень путем карбоксилирования при участии изофермента цитохрома CYP2C9 с образованием активного метаболита. Системная биодоступность лозартана - около 33%. C_{max} лозартана и его активного метаболита достигаются в сыворотке крови приблизительно через 1 ч и через 3-4 ч после приема внутрь, соответственно. Прием пищи не влияет на биодоступность лозартана.

Распределение

Более 99% лозартана и его активного метаболита связывается с белками плазмы крови, в основном с альбуминами. V_d лозартана - 34 л. Лозартан практически не проникает через ГЭБ.

Метаболизм

Приблизительно 14% лозартана, введенного пациенту в/в, или принятого внутрь, превращается в активный метаболит.

Выведение

Плазменный клиренс лозартана составляет 600 мл/мин, а активного метаболита - 50 мл/мин. Почечный клиренс лозартана и его активного метаболита составляет 74 мл/мин и 26 мл/мин, соответственно. При приеме внутрь приблизительно 4% принятой дозы выводится почками в неизменном виде и около 6% выводится почками в форме активного метаболита. Лозартану и его активному метаболиту свойственна линейная фармакокинетика при применении внутрь в дозах до 200 мг.

После приема внутрь плазменные концентрации лозартана и его активного метаболита снижаются полиэкспоненциально с конечным T_{1/2} лозартана около 2 ч, а активного метаболита - около 6-9 ч. При приеме

препарата в дозе 100 мг/сут ни лозартан, ни активный метаболит значительно не кумулируют в плазме крови. Лозартан и его метаболиты выводятся из организма через кишечник и почками. У здоровых добровольцев, после приема внутрь лозартана, меченого ¹⁴C-изотопом, около 35% радиоактивной метки обнаруживается в моче и 58% - в кале.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов с алкогольным циррозом печени легкой и умеренной степени тяжести концентрация лозартана была в 5 раз, а активного метаболита - в 1.7 раз выше, чем у здоровых добровольцев - мужчин.

При КК >10 мл/мин концентрация лозартана в плазме крови не отличается от таковой при нормальной функции почек. У пациентов, которые нуждаются в гемодиализе, AUC приблизительно в 2 раза выше, чем у пациентов с нормальной функцией почек.

Ни лозартан, ни его активный метаболит не удаляется из организма с помощью гемодиализа.

Концентрации лозартана и его активного метаболита в плазме крови у пожилых мужчин с артериальной гипертензией не различаются существенно от значений этих параметров у молодых мужчин с артериальной гипертензией.

Значения плазменных концентраций лозартана у женщин с артериальной гипертензией в 2 раза превышают соответствующие значения у мужчин с артериальной гипертензией. Концентрации активного метаболита у мужчин и женщин не различаются. Это фармакокинетическое различие не имеет клинической значимости.

Показания к применению:

- артериальная гипертензия;
- хроническая сердечная недостаточность (в составе комбинированной терапии, при непереносимости или неэффективности терапии ингибиторами АПФ);
- снижение риска развития сердечно-сосудистых заболеваний (в т.ч. инсульта) и смертности у пациентов с артериальной гипертензией и гипертрофией левого желудочка;
- диабетическая нефропатия при гиперкреатинемии и протеинурии (соотношение альбумина мочи и креатинина более 300 мг/г) у пациентов с сахарным диабетом 2 типа и сопутствующей артериальной гипертензией (снижение прогрессирования диабетической нефропатии до терминальной хронической почечной недостаточности).

Относится к болезням:

- [Артериальная гипертензия](#)
- [Гипертензия](#)
- [Инсульт](#)
- [Нефрит](#)
- [Сахарный диабет](#)
- [Сердечная недостаточность](#)

Противопоказания:

- беременность;
- период лактации;
- возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);
- повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат при артериальной гипотензии, снижении ОЦК, нарушениях водно-электролитного баланса, двустороннем стенозе почечных артерий или стенозе артерии единственной почки, при почечной/печеночной недостаточности.

Способ применения и дозы:

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

При *артериальной гипертензии* средняя суточная доза составляет 50 мг. В отдельных случаях, для достижения

Лозап

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

большого терапевтического эффекта, суточная доза может быть увеличена до 100 мг в 2 или 1 прием.

Начальная доза для пациентов с *хронической сердечной недостаточностью* составляет 12.5 мг 1 раз/сут. Как правило, дозу увеличивают с недельным интервалом (т.е. 12.5 мг/сут, 25 мг/сут, 50 мг/сут) до средней поддерживающей дозы 50 мг 1 раз/сут в зависимости от переносимости препарата.

При назначении препарата **пациентам, получающим диуретики в высоких дозах**, начальную дозу препарата Лозап следует уменьшить до 25 мг 1 раз/сут.

Для **пациентов пожилого возраста** нет необходимости коррекции дозы.

При назначении препарата с целью *снижения риска развития сердечно-сосудистых заболеваний (в т.ч. инсульта) и смертности у пациентов с артериальной гипертензией и гипертрофией левого желудочка* начальная доза составляет 50 мг/сут. В дальнейшем может быть добавлен гидрохлоротиазид в низкой дозе и/или увеличена доза препарата Лозап до 100 мг/сут в 1-2 приема.

Пациентам с сопутствующим **сахарным диабетом 2 типа с протеинурией** начальная доза препарата составляет 50 мг 1 раз/сут, в дальнейшем дозу повышают до 100 мг/сут (с учетом степени снижения АД) в 1-2 приема.

Пациентам с заболеваниями печени в анамнезе, дегидратацией, при проведении процедуры гемодиализа, а также **пациентам старше 75 лет** рекомендуется более низкая начальная доза препарата – 25 мг (1/2 таб. по 50 мг) 1 раз/сут.

Побочное действие:

При применении лозартана для лечения эссенциальной гипертензии в контролируемых исследованиях, среди всех побочных эффектов только частота развития головокружения отличалась от плацебо более чем на 1% (4.1% против 2.4%).

Дозозависимое ортостатическое действие, характерное для антигипертензивных средств, при применении лозартана отмечалось менее чем у 1% больных.

Определение частоты побочных эффектов: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100, \leq 1/10$); иногда ($\geq 1/1000, \leq 1/100$); редко ($\geq 1/10\ 000, \leq 1/1000$); очень редко ($\leq 1/10\ 000$, включая отдельные сообщения).

Побочные эффекты, встречающиеся с частотой более 1%

Побочные эффекты	Лозартан (n=2085)	Плацебо (n=535)
<i>Общие реакции</i>		
Астения, утомляемость	3.8	3.9
Боль в области грудной клетки	1.1	2.6
Периферические отеки	1.7	1.9
<i>Со стороны сердечно-сосудистой системы</i>		
Сердцебиение	1.0	0.4
Тахикардия	1.0	1.7
<i>Со стороны пищеварительной системы</i>		
Боль в животе	1.7	1.7
Диарея	1.9	1.9
Диспептические явления	1.1	1.5
Тошнота	1.8	2.8
<i>Со стороны костно-мышечной системы</i>		
Боль в спине, ногах	1.6	1.1
Судороги икрожных мышц	1.0	1.1
<i>Со стороны ЦНС</i>		
Головокружение	4.1	2.4
Головная боль	14.1	17.2
Бессонница	1.1	0.7
<i>Со стороны дыхательной системы</i>		
Кашель, бронхит	3.1	2.6
Заложенность носа	1.3	1.1
Фарингит	1.5	2.6
Синусит	1.0	1.3
Инфекции верхних дыхательных путей	6.5	5.6

Побочные эффекты лозартана обычно преходящие и не требуют отмены препарата.

Побочные эффекты, встречающиеся с частотой менее 1%

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ортостатическая гипотензия (дозозависимая), носовое кровотечение, брадикардия, аритмии, стенокардия, васкулит, инфаркт миокарда.

Со стороны пищеварительной системы: анорексия, сухость слизистой оболочки полости рта, зубная боль, рвота, метеоризм, гастрит, запор, гепатит, нарушение функции печени; очень редко – умеренное повышение активности АСТ и АЛТ, гипербилирубинемия.

Дерматологические реакции: сухость кожи, эритема, экхимозы, фотосенсибилизация, повышенное потоотделение, алопеция.

Аллергические реакции: крапивница, кожная сыпь, зуд, ангионевротический отек (включая отек гортани и языка, вызывающий обструкцию дыхательных путей и/или отек лица, губ, глотки).

Со стороны системы кроветворения: иногда – анемия (незначительное снижение концентрации гемоглобина и гематокрита, в среднем на 0.11 г% и 0.09 объем% соответственно, редко – имеющее клиническое значение), тромбоцитопения, эозинофилия, пурпура Шенлейн-Геноха.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, артрит, боль в плече, колене, фибромиалгия.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: беспокойство, нарушение сна, сонливость, расстройства памяти, периферическая невропатия, парестезии, гипестезии, тремор, атаксия, депрессия, обморок, мигрень.

Со стороны органов чувств: звон в ушах, нарушение вкуса, нарушения зрения, конъюнктивит.

Со стороны мочевыделительной системы: императивные позывы на мочеиспускание, инфекции мочевыводящих путей, нарушение функции почек; иногда – повышение уровня мочевины и остаточного азота или креатинина в сыворотке крови.

Со стороны половой системы: снижение либидо, импотенция.

Со стороны обмена веществ: часто – гиперкалиемия (уровень калия в плазме крови более 5.5 ммоль/л); подагра.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД, тахикардия; из-за парасимпатической (вагусной) стимуляции может появляться брадикардия.

Лечение: форсированный диурез, симптоматическая терапия; гемодиализ не эффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Данных по применению препарата Лозап при беременности нет. Однако известно, что препараты, воздействующие непосредственно на РААС, при применении во II и III триместрах беременности могут вызывать дефект развития или даже смерть развивающегося плода. Поэтому при наступлении беременности применение препарата Лозап следует немедленно прекратить.

При необходимости применения Лозапа в период лактации следует принять решение или о прекращении грудного вскармливания, или о прекращении лечения препаратом.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Препарат можно назначать с другими антигипертензивными средствами. Наблюдается взаимное усиление эффектов бета-адреноблокаторов и симпатолитиков. При совместном применении лозартана с диуретиками наблюдается аддитивный эффект.

Не отмечено фармакокинетического взаимодействия лозартана с гидрохлоротиазидом, дигоксином, варфарином, циметидином, фенобарбиталом, кетоконазолом и эритромицином.

По сообщениям, рифампицин и флуконазол снижают концентрацию активного метаболита лозартана в плазме крови. Клиническое значение этого взаимодействия пока неизвестно.

Как и при применении других средств, ингибирующих ангиотензин II или его действие, совместное применение лозартана с калийсберегающими диуретиками (например, спиронолактоном, триамтереном, амилоридом), препаратами калия и солей, содержащих калий, повышает риск гиперкалиемии.

НПВС, включая селективные ингибиторы ЦОГ-2, могут снижать эффект диуретиков и других гипотензивных средств.

При совместном применении антагонистов рецепторов ангиотензина II и лития возможно увеличение концентрации лития в плазме крови. Учитывая это, необходимо взвешивать пользу и риск совместного применения лозартана с препаратами солей лития. При необходимости совместного применения следует регулярно контролировать концентрацию лития в плазме крови.

Особые указания и меры предосторожности:

Необходимо проводить коррекцию дегидратации до назначения препарата Лозап или начинать лечение с применения препарата в более низкой дозе.

Препараты, оказывающие воздействие на РААС, могут увеличить уровень мочевины в крови и сывороточного креатинина у пациентов с билатеральным стенозом почечных артерий или стенозом артерии единственной почки.

У пациентов с циррозом печени концентрация лозартана в плазме крови значительно увеличивается, в связи с чем при наличии заболеваний печени в анамнезе его следует назначать в более низких дозах.

В период лечения следует регулярно контролировать концентрацию калия в крови, особенно у пациентов пожилого возраста, при нарушениях функции почек.

Использование в педиатрии

Безопасность и эффективность применения препарата Лозап у **детей и подростков в возрасте до 18 лет** не установлены.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Лозап не влияет на способность к управлению автотранспортом или работе с механизмами.

При нарушениях функции почек

У пациентов **с нарушениями функции почек, включая пациентов на диализе**, нет необходимости в коррекции начальной дозы.

В период лечения следует регулярно контролировать концентрацию калия в крови при нарушениях функции почек.

При нарушениях функции печени

Пациентам с нарушениями функции печени следует назначать Лозап в более низких дозах.

Применение в пожилом возрасте

У **пациентов пожилого возраста** нет необходимости в коррекции начальной дозы.

В период лечения следует регулярно контролировать концентрацию калия в крови, особенно у пациентов пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены).

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°C.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Лозап

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

Источник: <http://drugs.thead.ru/Lozap>