Лозап



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Лозартан

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС 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 AT_1). Не подавляет кининазу 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-кининазу 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 неизмененном 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 ^{14}C-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 гиперкреатининемии и протеинурии (соотношение альбумина мочи и креатинина более 300 мг/г) у пациентов с сахарным диабетом 2 типа и сопутствующей артериальной гипертензии (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

большего 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 (≥ 1/10); часто (≥ 1/100, ≤ 1/10); иногда (≥ 1/1000, ≤ 1/100); редко (≥ 1/10 000, ≤ 1/1000); очень редко (≤ 1/10 000, включая отдельные сообщения).

Побочные эффекты, встречающиеся с частотой более 1%

Побочные эффекты	Лозартан (n=2085)	Плацебо (n=535)
Общие реакции		
Астения, утомляемость	3.8	3.9
Боль в области грудной клетки	1.1	2.6
Периферические отеки	1.7	1.9
Со стороны сердечно-сосудистой системы		
Сердцебиение	1.0	0.4
Тахикардия	1.0	1.7
Со стороны пищеварительной системы		
Боль в животе	1.7	1.7
Диарея	1.9	1.9
Диспептические явления	1.1	1.5
Тошнота	1.8	2.8
Со стороны костно-мышечной системы		
Боль в спине, ногах	1.6	1.1
Судороги икроножных мышц	1.0	1.1
Со стороны ЦНС		
Головокружение	4.1	2.4
Головная боль	14.1	17.2
Бессонница	1.1	0.7
Со стороны дыхательной системы		
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°С.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Lozap