Лозарел



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 белого с желтоватым оттенком цвета, круглые, двояковыпуклые, с риской на одной стороне.

	1 таб.
лозартан калия	50 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая, лактозы моногидрат, крахмал прежелатинизированный, кремния диоксид коллоидный безводный, магния стеарат.

Состав пленочной оболочки: гипромеллоза, гипролоза, макрогол 400, титана диоксид (Е171), тальк.

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

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антигипертензивный препарат, селективный антагонист рецепторов ангиотензина II (тип AT_1). Ангиотензин II избирательно связывается с AT_1-рецепторами, находящимися во многих тканях (в гладкомышечных тканях сосудов, в надпочечниках, почках и сердце) и вызывает вазоконстрикцию и высвобождение альдостерона, пролиферацию гладких мышц.

В исследованиях in vitro и in vivo показано, что лозартан и его фармакологически активный метаболит блокируют все физиологически важные эффекты ангиотензина II, независимо от источника или от пути его синтеза. Не подавляет киназу II - фермент, разрушающий брадикинин.

Снижает ОПСС, концентрацию в крови альдостерона, АД, давление в малом круге кровообращения; уменьшает постнагрузку, оказывает диуретический эффект. Препятствует развитию гипертрофии миокарда, повышает толерантность к физической нагрузке у пациентов с хронической сердечной недостаточностью.

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 регулярного приема препарата.

Не ингибирует АПФ и, соответственно, не препятствует разрушению брадикинина, поэтому лозартану не свойственны побочные эффекты, опосредованно связанные с брадикинином (например, ангионевротический отек).

У больных 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 уровень норэпинефрина в плазме крови.

В дозе до 150 мг 1 раз/сут не влияет на уровень триглицеридов, общего холестерина и холестерина (Хс) ЛПВП в сыворотке крови у больных с артериальной гипертензией. В этой же дозе лозартан не влияет на уровень глюкозы в крови натощак.

Фармакокинетика

Всасывание

При приеме внутрь лозартан хорошо всасывается из ЖКТ. Подвергается метаболизму при "первом прохождении" через печень путем карбоксилирования при участии изофермента 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.

При приеме препарата внутрь в дозах до 200 мг лозартан и его активный метаболит характеризуются линейной фармакокинетикой.

Распределение

Связывание лозартана и его активного метаболита с белками плазмы крови (в основном с альбуминами) составляет более 99%. V_d лозартана - 34 л. Лозартан практически не проникает через ГЭБ.

Метаболизм

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

Выведение

Плазменный клиренс лозартана составляет 600 мл/мин, 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. 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.

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 более 10 мл/мин концентрация лозартана в плазме крови не отличается от таковой при нормальной функции почек. У пациентов, которым требуется гемодиализ, значение AUC приблизительно в 2 раза выше, чем у пациентов с нормальной функцией почек.

Ни лозартан, ни его активный метаболит не удаляются 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, страдающих артериальной гипертензией. Концентрации активного метаболита у мужчин и женщин не различаются. Это фармакокинетическое различие, не имеет клинического значения.

Показания к применению:

— артериальная гипертензия;

— хроническая сердечная недостаточность (при неэффективности лечения ингибиторами АПФ);

— нефропатия при сахарном диабете 2 типа (снижение риска развития гиперкреатининемии и протеинурии);

— снижение риска развития сердечно-сосудистых осложнений и смертности у пациентов с артериальной гипертензией и гипертрофией левого желудочка.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Нефрит
- Сахарный диабет
- Сердечная недостаточность

Противопоказания:

— беременность;

— период лактации (грудного вскармливания);

— возраст до 18 лет (эффективность и безопасность не установлены);

— непереносимость лактозы, галактоземия или синдром нарушенного всасывания глюкозы/галактозы;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

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

Способ применения и дозы:

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

При *артериальной гипертензии* в большинстве случаев начальная и поддерживающая доза составляет 50 мг 1 раз/сут. При необходимости дозу препарата можно увеличить до 100 мг/сут в 1 или 2 приема.

На фоне приема диуретиков в высоких дозах рекомендуется начинать терапию препаратом Лозарел с 25 мг (1/2 таб. по 50 мг) 1 раз/сут.

При *хронической сердечной недостаточности* начальная доза составляет 12.5 мг/сут, с последующим еженедельным увеличением в 2 раза до 50 мг/сут, в зависимости от переносимости приема препарата. При применении в начальной дозе 12.5 мг рекомендуется использовать лекарственные формы с меньшим содержанием действующего вещества (таблетки по 25 мг с риской).

При *сахарном диабете 2 типа с протеинурией (снижение риска развития гиперкреатининемии и протеинурии)* начальная доза составляет 50 мг 1 раз/сут в 1 прием. В ходе лечения, в зависимости от показателей АД, можно повысить суточную дозу препарата до 100 мг в 1 или 2 приема.

При применении препарата Лозарел *с целью снижения риска развития сердечно-сосудистых осложнений и смертности у пациентов с артериальной гипертензией и гипертрофией левого желудочка* начальная доза составляет 50 мг 1 раз/сут, при необходимости дозу можно увеличить до 100 мг/сут.

Пациентам с нарушениями функции почек (КК менее 20 мл/мин), с заболеваниями печени в анамнезе, **дегидратацией, при проведении процедуры диализа, а также пациентам старше 75 лет** препарат рекомендуется назначать в более низкой начальной дозе - 25 мг (1/2 таб. по 50 мг) 1 раз/сут.

Побочное действие:

Обычно побочные эффекты слабые и преходящие, не требуют прекращения лечения.

Определение частоты побочных реакций: очень часто (>10%), часто (>1% <10%), иногда (>0.1% <1%), редко (>0.01% < 0.1%) и очень редко, включая отдельные сообщения (< 0.01%).

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

Со стороны пищеварительного тракта: часто - тошнота, диарея, диспептические симптомы, боль в животе; иногда - анорексия, нарушение вкуса, сухость во рту, зубная боль, рвота, метеоризм, гастрит, запор, гепатит, нарушение функции печени.

Дерматологические реакции: иногда - сухость кожи, эритема, подкожные кровоизлияния, фотосенсибилизация, повышенное потоотделение, алопеция.

Аллергические реакции: иногда - крапивница, кожная сыпь, зуд, ангионевротический отек.

Со стороны системы кроветворения: иногда - анемия, тромбоцитопения, эозинофилия, тромбоцитопеническая пурпура (болезнь Шенлейн-Геноха).

Со стороны костно-мышечной системы: часто - судороги, миалгии, боль в спине, в грудной клетке, ногах; иногда - артралгии, артрит, фибромиалгия; редко - рабдомиолиз.

Со стороны ЦНС и органов чувств: часто - головокружение, астения, головная боль, утомляемость, бессонница; иногда - беспокойство, нарушение сна, сонливость, расстройства памяти, периферическая невропатия, парестезии, гипестезии, тремор, атаксия, депрессия, синкопе, звон в ушах, нарушения зрения, конъюнктивит, мигрень.

Со стороны дыхательной системы: часто - заложенность носа, кашель, инфекции верхних отделов дыхательных путей, фарингит, диспноэ, бронхит, отек слизистой оболочки носа.

Со стороны мочевыделительной системы: иногда - императивные позывы на мочеиспускание, инфекции мочевыводящих путей, нарушение функции почек.

Со стороны половой системы: иногда - снижение либидо, импотенция.

Лабораторные показатели: часто - гиперкалиемия (уровень калия в плазме крови более 5.5 ммоль/л); иногда - повышение уровня мочевины и остаточного азота или креатинина в сыворотке крови; очень редко - умеренное повышение активности печеночных трансаминаз (АСТ, АЛТ), гипербилирубинемия.

Прочие: подагра.

Передозировка:

Симптомы: выраженное снижение АД и тахикардия; в результате парасимпатической (вагусной) стимуляции может развиться брадикардия.

Лечение: форсированный диурез, симптоматическая терапия. Гемодиализ не эффективен, т.к. лозартан и его активный метаболит не выводятся из организма посредством гемодиализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Препарат противопоказан при беременности и в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

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

Имеются данные о том, что рифампицин и флуконазол снижают уровень активного метаболита в плазме крови. Клиническое значение этого взаимодействия в настоящее время неизвестно.

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

НПВП, включая селективные ингибиторы ЦОГ-2, ацетилсалициловую кислоту в дозе более 3 г/сут, способны снижать эффективность блокаторов рецепторов ангиотензина II.

Совместное применение антагонистов рецепторов ангиотензина II с НПВП, включая селективные ингибиторы ЦОГ-2, особенно при наличии сниженной функции почек, может привести к нарушению функции почек, включая острую почечную недостаточность и повышение уровня калия в плазме крови. Этот эффект обычно обратим.

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

Совместное применение лозартана с диуретиками оказывает аддитивный эффект.

Усиливает (взаимно) эффект других гипотензивных средств (диуретиков, бета-адреноблокаторов, симпатолитиков).

Особые указания и меры предосторожности:

Лекарственные средства, оказывающие воздействие на систему РААС способны увеличивать сывороточную концентрацию мочевины и креатинина у пациентов с двусторонним стенозом почечных артерий или стенозом артерии единственной почки.

У пациентов с дегидратацией (например, получающих лечение высокими дозами диуретиков) в начале лечения препаратом Лозарел может возникнуть симптоматическая артериальная гипотензия (необходимо проводить коррекцию дегидратации до назначения препарата Лозарел или начинать лечение с более низкой дозы).

Необходим регулярный контроль содержания калия в плазме крови у пациентов, длительно принимающих препарат Лозарел.

Использование в педиатрии

Безопасность и эффективность применения препарата у детей не установлены.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Лозартан не влияет на способность управлять автомобилем или работать с механизмами.

При нарушениях функции почек

Пациентам с нарушениями функции почек (КК менее 20 мл/мин) препарат рекомендуется назначать в более низкой начальной дозе - 25 мг (1/2 таблетки по 50 мг) 1 раз/сут.

При нарушениях функции печени

Пациентам с заболеваниями печени в анамнезе препарат рекомендуется назначать в более низкой начальной дозе - 25 мг (1/2 таблетки по 50 мг) 1 раз/сут. С *осторожностью* следует применять препарат при печеночной недостаточности

Применение в пожилом возрасте

Пациентам старше 75 лет препарат рекомендуется назначать в более низкой начальной дозе - 25 мг (1/2 таб. по 50 мг) 1 раз/сут.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в детском и подростковом возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

2 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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