

## Лозартан Маклеодз



### Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)  
[Госреестр](#) [Википедия](#)  
[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)<sup>англ</sup>

### Форма выпуска:

**Таблетки, покрытые пленочной оболочкой** оранжевого цвета, капсуловидные, двояковыпуклые, с выдавленной надписью "25" с одной стороны и риской с другой стороны.

|                |               |
|----------------|---------------|
|                | <b>1 таб.</b> |
| лозартан калия | 25 мг         |

**Вспомогательные вещества:** крахмал 45.5 мг, лактоза 38.0 мг, повидон (К-30) 2.0 мг, целлюлоза микрокристаллическая 13.0 мг, магния стеарат 1.00 мг.

**Пленочная оболочка:**

гипромеллоза 1.5 мг, тальк 0.45 мг, титана диоксид 0.40 мг, пропиленгликоль 0.15 мг, диэтилфталат 0.30 мг, краситель солнечный закат желтый (сансет желтый) 0.05 мг.

10 шт. - блистеры из ПВХ/алюминиевой фольги (5) - пачки картонные.

**Таблетки, покрытые пленочной оболочкой** зеленого цвета, капсуловидные, двояковыпуклые, с выдавленной надписью "50" с одной стороны и риской с другой стороны.

|                |               |
|----------------|---------------|
|                | <b>1 таб.</b> |
| лозартан калия | 50 мг         |

**Вспомогательные вещества:** крахмал 33.0 мг, лактоза 25.0 мг, повидон (К-30) 2.0 мг, целлюлоза микрокристаллическая 13.0 мг, магния стеарат 1.05 мг.

**Пленочная оболочка:**

гипромеллоза 1.5 мг, тальк 0.45 мг, титана диоксид 0.40 мг, пропиленгликоль 0.15 мг, диэтилфталат 0.30 мг, краситель зеленый (краситель пиа Грин) 0.05 мг.

10 шт. - блистеры из ПВХ/алюминиевой фольги (5) - пачки картонные.

### Фармакологические свойства:

#### Фармакодинамика

Лозартан является специфическим антагонистом рецепторов ангиотензина II (подтип AT1) для приема внутрь. Ангиотензин II избирательно связывается с AT1-рецепторами, находящимися во многих тканях (в гладкомышечных тканях сосудов, надпочечниках, почках и сердце) и выполняет несколько важных биологических функций, включая вазоконстрикцию и высвобождение альдостерона. Ангиотензин II также стимулирует разрастание гладкомышечных клеток.

Лозартан и его фармакологически активный метаболит (е 3174) как in vitro, так и in vivo блокируют все физиологические эффекты ангиотензина II, независимо от источника или пути синтеза. Лозартан избирательно связывается с AT1-рецепторами и не связывается и не блокирует рецепторы других гормонов и ионных каналов,

играющих важную роль в регуляции функции сердечно-сосудистой системы. Кроме того, 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.

При применении лозартана, отсутствие влияния отрицательной обратной связи на секрецию ренина приводит к повышению активности ренина плазмы крови. Повышение активности ренина приводит к повышению концентрации ангиотензина II в плазме крови.

Однако антигипертензивная активность и снижение концентрации альдостерона плазмы крови сохраняются, что указывает на эффективную блокаду рецепторов ангиотензина II.

Лозартан и его активный метаболит обладают большим сродством к рецепторам ангиотензина I, чем к рецепторам ангиотензина II. Активный метаболит в 10-40 раз активнее лозартана.

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

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

У больных артериальной гипертензией без сопутствующего сахарного диабета с протеинурией (более 2 г/сут), применение препарата достоверно снижает протеинурию, экскрецию альбумина и иммуноглобулина G. Стабилизирует содержание мочевины в плазме крови. Не влияет на вегетативные рефлексы и не оказывает длительного воздействия на концентрацию норадреналина в плазме крови.

Лозартан в дозе 150 мг/сут не влияет на концентрацию триглицеридов, общего холестерина и холестерина липопротеинов высокой плотности (ЛПВП) в сыворотке крови у больных с артериальной гипертензией. В этой же дозе лозартан не влияет на концентрацию глюкозы в крови натощак.

### **Фармакокинетика**

#### *Всасывание*

При приеме внутрь, лозартан хорошо абсорбируется из ЖКТ и при этом подвергается метаболизму при "первичном прохождении" через печень путем карбоксилирования при участии изофермента CYP2C9 с образованием активного метаболита. Системная биодоступность лозартана составляет приблизительно 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 связываются с белками плазмы крови, в основном с альбумином.  $V_d$  лозартана - 34 л. Лозартан практически не проникает через гематоэнцефалический барьер.

#### *Метаболизм*

Примерно 14% лозартана, введенного пациенту внутривенно или внутрь, превращается в активный метаболит.

#### *Выведение*

Плазменный клиренс лозартана и его активного метаболита составляет около 600 мл/мин и 50 мл/мин, соответственно; Почечный клиренс лозартана и его активного метаболита составляет примерно 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 приеме 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 в сутки ни лозартан, ни его 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 меченого  $^{14}C$  изотопом лозартана, около 35% радиоактивной метки обнаруживается в моче и 59% - в кале.

#### *Фармакокинетика у особых групп пациентов*

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 клиренсе креатинина (КК) выше 10 мл/мин концентрация лозартана в плазме крови не отличается от таковой при нормальной функции почек. У пациентов, нуждающихся в гемодиализе, значение 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 существенно не отличаются 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.

## 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 или гиперкреатининемия и протеинурия (соотношение альбумина мочи и креатинина более 300 мг/сут) 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;
- тяжелая печеночная недостаточность (более 9 баллов по шкале Чайлд-Пью);
- наследственная непереносимость галактозы, дефицит лактазы или синдром мальабсорбции глюкозы-галактозы;
- повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С осторожностью применять препарат при артериальной гипотензии, сниженном ОЦК, нарушениях водно-электролитного баланса, двустороннем стенозе почечных артерий или стенозе артерии единственной почки, почечной недостаточности, печеночной недостаточности (менее 9 баллов по шкале Чайлд-Пью).

## Способ применения и дозы:

Препарат Лозартан Маклеодз принимают внутрь независимо от приема пищи. Таблетки проглатывают, не разжевывая, запивая водой. Кратность приема - 1 раз/сут.

### *Артериальная гипертензия*

При артериальной гипертензии средняя суточная доза составляет 50 мг 1 раз/сут. Для достижения большего терапевтического эффекта дозу увеличивают до 100 мг/сут.

### *Хроническая сердечная недостаточность*

Начальная доза для пациентов с хронической сердечной недостаточностью составляет 12.5 мг 1 раз/сут. Как правило, доза увеличивается с недельным интервалом (то есть 12.5 мг/сут, 25 мг/сут и 50 мг/сут) до средней поддерживающей дозы 50 мг 1 раз/сут, в зависимости от переносимости препарата пациентом.

Не требуется коррекции дозы препарата у **пациентов пожилого возраста**.

*Снижение риска развития, сердечно-сосудистых заболеваний (в т.ч. инсульта) и смертности у пациентов с артериальной гипертензией и гипертрофией левого желудочка*

Начальная доза препарата составляет 50 мг 1 раз/сут. В дальнейшем может быть добавлен гидрохлоротиазид в низких дозах или увеличена доза препарата Лозартан Маклеодз до 100 мг в 1 или 2 приема с учетом снижения АД.

*Пациентам с сопутствующим сахарным диабетом 2 типа с протеинурией*

Препарат назначают в начальной дозе 50 мг 1 раз/сут с дальнейшим повышением дозы до 100 мг/сут (с учетом степени снижения АД) в один или в два приема.

У пациентов со сниженным ОЦК (например, при приеме диуретиков в высоких дозах) рекомендуемая начальная доза препарата Лозартан Маклеодз составляет 25 мг 1 раз/сут.

**Пациентам с печеночной недостаточностью (менее 9 баллов по шкале Чайлд-Пью), при проведении процедуры гемодиализа, а также пациентам старше 75 лет** рекомендуется более низкая начальная доза препарата - 25 мг 1 раз/сут.

Недостаточно опыта применения препарата у **пациентов с тяжелой печеночной недостаточностью**, поэтому препарат не рекомендован у данной категории больных.

Препарат не обладает особенностями действия при первом приеме или при его отмене, но необходим контроль АД как при приеме любого гипотензивного препарата.

Прием гипотензивных препаратов следует проводить в одно и то же установленное время по рекомендации врача для увеличения терапевтического эффекта. При пропуске приема-одной дозы необходимо принять следующую дозу препарата во время наиболее близкое ко времени обычного приема препарата или в то время, когда вспомнили о том, что пропустили прием, передвинув время приема следующей дозы. Не следует принимать удвоенную дозу препарата.

## Побочное действие:

*Со стороны нервной системы и органов чувств:* > 1 % — головокружение, астения/утомление, головная боль, бессонница; < 1 % — беспокойство, нарушение сна, сонливость, расстройства памяти, периферические невропатии, парестезии, гипестезии, гиперестезии, мигрень, тремор, атаксия, депрессия, синкопэ, звон в ушах, нарушение вкуса, изменение зрения, конъюнктивит.

*Со стороны дыхательной системы:* > 1 % — заложенность носа, кашель, инфекции верхних дыхательных путей (повышенная температура тела, боль в горле), синусопатия, синусит, фарингит; < 1 % — диспноэ, бронхит, ринит.

*Со стороны пищеварительной системы:* > 1 % — тошнота, диарея, диспептические явления, боль в животе, сухость слизистой оболочки полости рта; < 1 % — анорексия, зубная боль, рвота, метеоризм, гастрит, запор.

*Со стороны опорно-двигательного аппарата:* > 1 % — судороги, миалгия, боль в спине, грудной клетке, ногах; < 1 % — артралгия, боль в плече, колене, артрит, фибромиалгия.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы и крови (кроветворение, гемостаз):* < 1 % — ортостатические реакции (дозозависимые), гипотензия, ощущение сердцебиения, тахи- или брадикардия, аритмии, стенокардия, анемия, инфаркт миокарда.

*Со стороны мочеполовой системы:* < 1 % — императивные позывы на мочеиспускание, инфекции, мочевыводящих путей, нарушение функции почек, ослабление либидо, импотенция.

*Со стороны кожных покровов:* < 1 % — сухость кожи, эритема, прилив крови, фотосенсибилизация, повышенное потоотделение, алопеция.

*Аллергические реакции:* < 1 % — крапивница, кожная сыпь; зуд, ангионевротический отек, в т.ч. лица, губ, глотки и/или языка.

*Прочие:* > 1 % — гиперкалиемия; < 1 % — лихорадка, подагра, повышение уровня печеночных трансаминаз и билирубина в крови, васкулит, гиперурикемия, тромбоцитопения, эозинофилия, пурпура Шенлейн-Геноха, гиперкреатининемия.

## Передозировка:

*Симптомы:* выраженное снижение АД, возможно изменение ЧСС (тахикардия или брадикардия).

*Лечение:* промывание желудка, форсированный диурез, симптоматическая поддерживающая терапия. Гемодиализ

неэффективен (ни лозартан, ни его активный метаболит не выводятся при гемодиализе).

## Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата Лозартан Маклеодз при беременности противопоказано. Известно, что препараты, воздействующие непосредственно на ренин-ангиотензин-альдостероновую систему (РААС), при применении во II и III триместрах беременности, могут вызывать дефекты развития или даже смерть развивающегося плода. Поэтому при диагностировании беременности, прием препарата Лозартан Маклеодз следует немедленно прекратить.

Неизвестно, выделяется ли лозартан с грудным молоком. Не рекомендуется принимать препарат Лозартан Маклеодз в период лактации. Если прием препарата Лозартан Маклеодз необходим в период лактации, то грудное вскармливание необходимо прекратить.

## Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Препарат Лозартан Маклеодз может применяться одновременно с другими гипотензивными средствами.

Взаимно усиливает эффект бета-адреноблокаторов и симпатолитиков.

Совместное применение лозартана с диуретиками вызывает аддитивный эффект.

Не отмечено фармакокинетических взаимодействий лозартана с гидрохлортиазидом, дигоксином, варфарином, циметидином, фенобарбиталом, кетоконазолом и эритромицином.

По сообщениям, рифампицин и флуконазол снижают концентрацию активного метаболита в плазме крови. Клиническое значение этих взаимодействий 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, солями, содержащими калий, повышает риск гиперкалиемии.

Нестероидные, противовоспалительные препараты (НПВП), включая селективные ингибиторы циклооксигеназы-2 (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 солями лития. В случае необходимости совместного применения препаратов, надо регулярно контролировать концентрацию лития в плазме крови.

## Особые указания и меры предосторожности:

Для пациентов с хронической сердечной недостаточностью, у которых стабильный эффект был достигнут в результате применения ингибиторов АПФ, не рекомендуется переход на прием антагонистов рецепторов ангиотензина II, в т.ч. препарата Лозартан Маклеодз.

Больным с патологией печени (менее 9 баллов по шкале Чайлд-Пью, и особенно при циррозе), в т.ч. в анамнезе, необходимо назначать меньшие дозы.

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

У пациентов с нарушением функции почек, как с сахарным диабетом, так и без него, часто развиваются электролитные нарушения (гиперкалиемия), на которые следует обращать внимание. При наличии острой или хронической почечной недостаточности лозартан может привести к ухудшению функции почек с гиперкалиемией или без нее.

В период лечения лозартаном следует регулярно контролировать содержание калия в крови, особенно у пациентов пожилого возраста и при нарушении функции почек. Следует избегать одновременного применения лозартана с калийсберегающими диуретиками.

У пациентов пожилого возраста, применяющих нестероидные противовоспалительные препараты, с одновременным приемом диуретиков, или с нарушениями функции почек, применение лозартана может привести к ухудшению функции почек, включая возможность острой почечной недостаточности. Эти эффекты обычно обратимы. Необходимо периодически контролировать функцию почек у пациентов, принимающих лозартан и нестероидные противовоспалительные препараты.

Данные по безопасности и эффективности применения препарата у детей не достаточны.

*Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами*

Способность препарата влиять на скорость психомоторных реакций и на способность управлять транспортными или другими техническими средствами не изучена. Следует соблюдать осторожность при занятии потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстрых психомоторных реакций.

**При нарушениях функции почек**

С осторожностью применять препарат при двустороннем стенозе почечных артерий или стенозе артерии единственной почки, почечной недостаточности.

**При нарушениях функции печени**

Противопоказан:

— тяжелая печеночная недостаточность (более 9 баллов по шкале Чайлд-Пью).

С осторожностью применять препарат при печеночной недостаточности (менее 9 баллов по шкале Чайлд-Пью).

**Применение в пожилом возрасте**

Не требуется коррекции дозы препарата у **пациентов пожилого возраста**.

Пациентам старше 75 лет рекомендуется более низкая начальная доза препарата - 25 мг 1 раз/сут.

**Применение в детском возрасте**

Противопоказан детям до 18 лет.

## **Условия хранения:**

Срок годности препарата - 3 года. В сухом месте при температуре не выше 25°C. Хранить в местах, недоступных для детей.

## **Условия отпуска в аптеке:**

По рецепту.

**Источник:** [http://drugs.thead.ru/Lozartan\\_Makleodz](http://drugs.thead.ru/Lozartan_Makleodz)