Лозартан Маклеодз



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

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

	1 таб.
лозартан калия	25 мг

Вспомогательные вещества: крахмал 45.5 мг, лактоза 38.0 мг, повидон (K-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.

	1 таб.
лозартан калия	50 мг

Вспомогательные вещества: крахмал 33.0 мг, лактоза 25.0 мг, повидон (K-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 (e 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 аптигипертензивная 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 неизмененном 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 в1 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, гипостезии,
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 но IIIи 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 гидрохлоротиазидом, 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 ангиотензйна 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 .Чайдд-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 нарушениях функции почек. Следует избегать одновременного применения лозартана с калийсберегающими диуретиками.

У пациентов пожилого возраста, применяющих нестероидные противоспалительные препараты, с одновременным приемом диуретиков, или с нарушениями функции почек, применение лозартана может привести к ухудшению функции почек, включая возможность острой почечной недостаточностью. 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°С. Хранить в местах, недоступных для детей.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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