Инструкция по применению
Козаар таблетки 100 мг 28 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки покрытые оболочкой
Страна: Нидерланды
Производитель: МСД ФАРМАСЬЮТИКАЛС
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Лозартан
Количество в упаковке: 28
Дозировка действующего вещества: 100 мг
Срок годности: 36.0



Действующее вещество

Лозартан

Состав

Лозартан калия 100 мгвспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 105 мг, лактозы моногидрат - 51 мг, крахмал прежелатинизированный - 41.9 мг, магния стеарат - 2.1 мг.состав оболочки: гипролоза (с 0.3% кремния диоксида) - 3.6 мг, гипромеллоза - 3.6 мг, титана диоксид - 1.8 мг, воск карнаубы - 0.05 мг.

Форма выпуска

Таблетки покрытые оболочкой

Фармакокинетика

ВсасываниеПри приеме внутрь лозартан хорошо абсорбируется из ЖКТ и подвергается эффекту первого прохождения через печень, в результате чего образуются активный карбоксилированный метаболит и неактивные метаболиты. Системная биодоступность лозартана составляет приблизительно 33%. Средние Cmax лозартана и его активного метаболита достигаются через 1 ч и через 3-4 ч соответственно. При приеме лозартана во время обычного приема пищи клинически значимого влияния на профиль концентрации лозартана в плазме крови выявлено не было.РаспределениеЛозартан и его активный метаболит связываются с белками плазмы крови (в основном с альбумином) более чем на 99%. Vd лозартана составляет

34 л. Исследования на крысах показали, что лозартан практически не проникает через ГЭБ.МетаболизмПримерно 14% дозы лозартана (при приеме внутрь и в/в введении) превращается в его активный метаболит. После приема внутрь или в/в введения лозартана, меченного 14С, радиоактивность циркулирующей плазмы крови прежде всего связана с наличием в ней лозартана и его активного метаболита. Образуются также биологически неактивные метаболиты, в т.ч. два основных, образующихся в результате гидроксилирования бутиловой боковой цепи, и один второстепенный - N-2-тетразол-глюкуронид.ВыведениеПлазменный 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 лозартана внутрь около 4% дозы выводится в неизмененном виде с мочой и около 6% дозы выводится с мочой в виде активного метаболита. Лозартан и его активный метаболит имеют линейную фармакокинетику при пероральном приеме лозартана калия в дозах до 200 мг.После приема внутрь плазменные концентрации лозартана и его активного метаболита снижаются полиэкспоненциально с конечным Т1/2 приблизительно 2 и 6-9 ч соответственно. При приеме препарата в дозе 100 мг 1 раз/сут не происходит значимой кумуляции в плазме крови ни лозартана, ни его активный метаболита.Выведение лозартана и его метаболитов происходит с желчью и мочой. После приема внутрь лозартана, меченного 14С, около 35% радиоактивной метки обнаруживается в моче и 58% - в кале. После в/в введения лозартана, меченного 14С, примерно 43% радиоактивной метки выявляется в моче и 50% в кале.Фармакокинетика у особых групп пациентовКонцентрации лозартана и его активного метаболита в плазме крови у лиц пожилого возраста с артериальной гипертензией значимо не различаются от данных показателей у более молодых пациентов с артериальной гипертензией.Концентрации лозартана в плазме крови были в 2 раза выше у женщин с артериальной гипертензией по сравнению с мужчинами, страдающими артериальной гипертензией. Концентрации активного метаболита у мужчин и женщин не различались. Это явное фармакокинетическое различие не имеет клинического значения.При приеме лозартана внутрь у пациентов с циррозом печени алкогольного генеза легкой и умеренной степенью тяжести концентрации лозартана и его активного метаболита в плазме крови оказались в 5 и 1.7 раза (соответственно) больше, чем у молодых здоровых добровольцев мужского пола.Концентрации лозартана в плазме крови у пациентов с клиренсом креатинина выше 10 мл/мин не отличались от таковых у лиц с нормальной функцией почек. При сравнении величина AUC у больных, находящихся на гемодиализе, оказалась примерно в 2 раза больше, чем у пациентов с нормальной функцией почек. Плазменные концентрации активного метаболита не изменяются у пациентов с нарушением функции почек или у больных, находящихся на гемодиализе. Лозартан и его активный метаболит не могут быть удалены с помощью гемодиализа.

Показания

- артериальная гипертензия;- снижение риска ассоциированной сердечно-сосудистой заболеваемости и смертности у пациентов с артериальной гипертензией и гипертрофией левого желудочка, проявляющееся снижением совокупно частоты сердечно-сосудистой смертности, частоты инсульта и инфаркта миокарда;- защита почек у пациентов с сахарным диабетом типа 2 с протеинурией - замедление прогрессирования почечной недостаточности, проявляющееся снижением частотыгиперкреатининемии, частоты развития терминальной стадии ХПН, требующей проведения гемодиализа или трансплантации почек,показателей смертности, а также снижение протеинурии;- хроническая сердечная недостаточность при неэффективности лечения ингибиторами АПФ.

Способ применения и дозы

Козаар принимается внутрь вне зависимости от приема пищи, возможно применение как в виде монотерапии, так и в в комбинации с другими антигипертензивными средствами.При артериальной гипертензии стандартная начальная и поддерживающая доза для большинства пациентов составляет 50 мг 1 раз/сут. Максимальный гипотензивный эффект достигается через 3-6 недель после начала терапии. У некоторых пациентов для достижения большего эффекта доза может быть увеличена до 100 мг 1 раз/сут.У пациентов со сниженным ОЦК (например, при приеме диуретиков в высоких дозах) начальную дозу препарата следует снизить до 25 мг 1 раз/сут.Нет необходимости в подборе начальной дозы у лиц пожилого возраста и у пациентов с почечной недостаточностью, включая больных на диализе.Пациентам с заболеванием печени в анамнезе рекомендуется назначать препарат в более низких дозах.Для снижения риска ассоциированной сердечно-сосудистой заболеваемости и смертности у пациентов с артериальной гипертензией и гипертрофией левого желудочка стандартная начальная доза препарата составляет 50 мг 1 раз/сут. В дальнейшем рекомендуется добавить гидрохлоротиазид в низких дозах или увеличить дозу Козаара до 100 мг 1 раз/сут с учетом степени снижения АД.Для защиты функции почек у пациентов с сахарным диабетом типа 2 и протеинурией стандартная начальная доза препарата составляет 50 мг 1 раз/сут. В дальнейшем рекомендуется увеличить дозу Козаара до 100 мг 1 раз/сут с учетом степени снижения АД. Козаар может быть назначен совместно с другими антигипертензивными средствами (диуретики, блокаторы кальциевых каналов, альфа- и бета-адреноблокаторы, препараты центрального действия), инсулином и другими гипогликемическими средствами (производные сульфонилмочевины, глитазоны и ингибиторы глюкозидазы).При хронической сердечной недостаточности начальная доза Козаара составляет 12.5 мг 1 раз/сут. Как правило, доза титруется с недельным интервалом (т.е. 12.5 мг/сут, 25 мг/сут, 50 мг/сут) до обычной поддерживающей дозы 50 мг 1 раз/сут в зависимости от индивидуальной переносимости.

Противопоказания

- беременность;- повышенная чувствительность к компонентам препарата.С осторожностью следует назначать препарат пациентам со сниженным ОЦК, например, получающим лечение диуретиками в высоких дозах (может возникать симптоматическая гипотензия), а также пациентам с заболеваниями печени и почек в анамнезе.

Применение при беременности и кормлении грудью

Применение Козаара при беременности противопоказано.Применение во II и III триместрах беременности препаратов, действующих на ренин-ангиотензивную систему, могут вызывать серьезные повреждения или даже гибель развивающегося плода, поэтому при установлении беременности прием Козаара должен быть сразу прекращен. У плода почечная перфузия, зависящая от развития системы ренин-ангиотензин, появляется во II триместре; риск для плода возрастает, если Козаар назначают во II или III триместре беременности.Не рекомендуется принимать Козаар в период лактации. Опыта применения лозартана в период грудного вскармливания нет, и неизвестно, выделяется ли лозартан с грудным молоком. Т.к. многие лекарственные средства выделяются с грудным молоком и могут оказывать неблагоприятное воздействие на грудных детей, с учетом необходимости приема препарата для матери следует принять решение о прекращении грудного вскармливания или об отмене препарата.

Побочные действия

В контролируемых клинических исследованиях препарата у пациентов с эссенциальной артериальной гипертензией единственным побочным эффектом, связанным с приемом препарата, было головокружение, которое наблюдалось чаще, чем при назначении плацебо и возникало у ≥1% пациентов, получавших Козаар. Кроме этого, у ≤ 1% пациентов отмечались ортостатические реакции, зависящие от дозы препарата. Редко сообщалось о возникновении сыпи, но частота ее возникновения была меньше, чем при приеме плацебо.Контролируемые клинические исследования показали, что Козаар в основном хорошо переносится пациентами с гипертрофией левого желудочка, пациентами с сахарным диабетом типа 2 и протеинурией. Наиболее частыми побочными эффектами, связанными с приемом препарата, были системное и несистемное головокружение, астения /слабость, снижение АД и гиперкалиемия.В ходе этих исследований следующие побочные эффекты на фоне приема Козаара (n=2085) и плацебо (n=535) встречались у ≥ 1% пациентов:Со стороны организма в целом: боль в области желудка 1.7% (плацебо 1.7%); слабость и утомляемость 3.8% (плацебо 3.9%), боль в груди 1.1% (плацебо 2.6%), отек 1.7% (плацебо 1.9%)Со стороны сердечно-сосудистой системы: учащение сердцебиения 1% (плацебо 0.4%); тахикардия 1% (плацебо 1.7%).Со стороны пищеварительной системы: диарея 1.9% (плацебо 1.9%); диспепсия 1.1% (плацебо 1.5%); тошнота 1.8% (плацебо 2.8%).Со стороны костно- мышечной системы: боль в спине 1.6% (плацебо 1.1%); мышечные судороги 1% (плацебо 1.1%).Со стороны ЦНС: головокружение 4.1% (плацебо 2.4%); головная боль 14.1% (плацебо 17.2%); бессонница 1.1% (плацебо 0.7%).Со стороны дыхательной системы: кашель 3.1

(плацебо 2.6%); отек слизистой оболочки носа 1.3% (плацебо 1.1%); фарингиты 1.5% (плацебо 2.6%); синусит 1% (плацебо 1.3%); инфекции верхних отделов дыхательных путей 6.5% (плацебо 5.6%).Следующие нежелательные реакции были отмечены в широкой клинической практике.Аллергические реакции: у пациентов, принимавших лозартан, редко наблюдался ангионевротический отек, включая отек гортани, голосовой щели, вызывающие обструкцию дыхательных путей, и/или отек лица, губ, глотки и/или языка. Некоторые из этих пациентов имели указания в анамнезе на перенесенный ангионевротический отек при приеме ингибиторов АПФ. Редко сообщалось о возникновении васкулита, включая пурпуру Шенлейн-Геноха.Со стороны пищеварительной системы: гепатит (редко), нарушение функции печени.Со стороны системы кроветворения: анемия, тромбоцитопения.Со стороны костно-мышечной системы: миалгия; артралгия; редко - рабдомиолиз.Со стороны ЦНС: мигрень, редко - дисгевзия.Со стороны дыхательной системы: кашель. Дерматологические реакции: крапивница, зуд, гиперемия кожи.Со стороны лабораторных показателей: при проведении контролируемых клинических исследований у пациентов с эссенциальной артериальной гипертензией клинически значимые изменения стандартных лабораторных показателей редко были связаны с приемом Козаара. У 1.5% больных отмечалась гиперкалиемия (калий сыворотки крови >5.5 мэкв/л). В исследовании у пациентов с сахарным диабетом типа 2 с протеинурией гиперкалиемия развилась у 9.9% пацентов леченных Козааром и у 3.4% пациентов, леченных плацебо. Повышенный уровень АЛТ отмечался в редких случаях и обычно возвращался к норме после отмены терапии.В целом Козаар переносится хорошо, побочные эффекты носят легкий и преходящий характер и не требуют отмены препарата. Суммарная частота побочных эффектов Козаара сравнима с данным показателем при приеме плацебо.

Передозировка

Сведения о передозировке ограничены. Наиболее вероятные симптомы передозировки: выраженное снижение АД и тахикардия; брадикардия может возникнуть вследствие парасимпатической стимуляции.Лечение: симптоматическая терапия. Лозартан и его активный метаболит не удаляются из кровотока при гемодиализе.

Взаимодействие с другими препаратами

Не отмечалось клинически значимого взаимодействия препарата с такими лекарственными средствами, как гидрохлоротиазид, дигоксин, варфарин, циметидин, фенобарбитал, кетоконазол и эритромицин.Рифампин и флуконазол уменьшают уровень активного метаболита. Клиническое значение данных взаимодействий не изучено.Как и при использовании других средств, блокирующих образование ангиотензина II и его эффекты, сопутствующее назначение калийсберегающих диуретиков (спиронолактон, триамтерен, амилорид), калиевых добавок и солей, содержащих калий, может привести к увеличению уровня калия в сыворотке крови. Как и при использовании других средств, влияющих на выведение натрия, лечение лозартаном может сопровождаться снижением экскреции и повышением сывороточной концентрации лития, поэтому при одновременном лечении с препаратами лития следует контролировать его сывороточную концентрацию.НПВС, включая селективные ингибиторы ЦОГ-2, могут снижать эффект диуретиков и других гипотензивных препаратов. Поэтому гипотензивный эффект антагонистов рецепторов ангиотензина II может быть ослаблен при одновременном применении НПВС, включая селективные ингибиторы ЦОГ-2.У некоторых пациентов с нарушениями функции почек, которые получали лечение НПВС, включая селективные ингибиторы ЦОГ-2, одновременное назначение антагонистов рецепторов ангиотензина II может вызвать дальнейшее ухудшение функции почек. Обычно данный эффект обратим.Флуконазол, ингибитор изофермента 2C9 цитохрома P450, снижает плазменные концентрации активного метаболита и повышает концентрации лозартана, однако, фармакодинамическая значимость этого феномена не установлена. Показано, что у лиц, не метаболизирующих лозартан в активный метаболит, имеется очень редкий и специфичный дефект изофермента 2C9 цитохрома P450.

Особые указания

Возможно проявление такого симптома повышенной чувствительности как ангионевротический отек.У пациентов со сниженным ОЦК (например, получающих лечение большими дозами диуретиков) может возникать симптоматическая артериальная гипотензия. Коррекцию таких состояний необходимо проводить до назначения Козаара или начинать лечение с более низкой дозы.Нарушение водно-электролитного баланса является характерным для пациентов с почечной недостаточностью с сахарным диабетом или без сахарного диабета, поэтому при назначении препарата этой категории пациентов следует соблюдать особую осторожность. В клинических исследованиях, в которых участвовали пациенты с сахарным диабетом 2 типа с протеинурией, число случаев гиперкалиемии было выше в группе, получавшей Козаар, чем в группе, получавшей плацебо. Нескольким пациентам пришлось прекратить терапию в связи с возникшей гиперкалиемией.Во время лечения препаратом Козаар пациенты не должны принимать препараты калия или содержащие калий заменители поваренной соли без предварительного согласования с врачом.Данные фармакокинетических исследований указывают на то, что концентрация лозартана в плазме крови больных с циррозом печени значительно увеличивается, поэтому пациентам с заболеванием печени в анамнезе следует назначать препарат в более низкой дозе.Вследствие ингибирования ренин-ангиотензиновой системы у некоторых восприимчивых пациентов отмечались изменения функции почек, включая почечную недостаточность; данные изменения могут исчезать после прекращения терапии.Некоторые препараты, оказывающие воздействие на ренин-ангиотензиновую систему, могут увеличивать уровень мочевины крови и сывороточного креатинина у пациентов с двусторонним стенозом почечных артерий или стенозом артерии единственной почки. Сообщалось о возникновении подобных эффектов при приеме Козаара; изменения функции почек могут исчезать при прекращении терапии.У пациентов с зависимой от активности ренин-ангиотензин-альдостероновой системы функцией почек (т.е. с тяжелой хронической сердечной недостаточностью) лечение ингибиторами АПФ в некоторых случаях сопровождалось развитием олигоурии и/или нарастающей азотемии, и острой почечной недостаточности (редко), и/или состояний с летальным исходом. О подобных исходах сообщалось и при лечении данной категории пациентов Козааром. Клинические исследования не выявили каких-либо особенностей в отношении безопасности и эффективности лозартана у пациентов пожилого возраста. Использование в педиатрииБезопасность и эффективность препарата у детей до 18 лет не установлены.

Условия хранения

В сухом месте