



Thuốc bán theo đơn

Lifezar®

Losartan potassium
Viên nén 50 mg

Chất đối kháng thụ thể Angiotensin II / Thuốc điều trị cao huyết áp

THÀNH PHẦN

Mỗi viên nén chứa:

Losartan potassium 50 mg

Tá dược: Microcrystalline Cellulose, Lactose Monohydrate, Hydroxypropyl Cellulose, Tinh bột, Magnesium Stearate, Opadry.

ĐẶC TÍNH ĐƯỢC LÝ

A. TÁC ĐỘNG ĐƯỢC LÝ

Angiotensin II (được tạo thành từ angiotensin I), là một chất co mạch mạnh, đó là hormone có hoạt tính khởi phát của hệ renin-angiotensin và là một thành phần quan trọng trong sinh lý bệnh học của bệnh cao huyết áp. Angiotensin II cũng kích thích vỏ thượng thận tiết aldosterone. Losartan và chất chuyển hóa chính có hoạt tính chẹn tác dụng co mạch và tiết aldosterone của angiotensin II bằng cách ngăn cản chọn lọc sự gắn kết của angiotensin II và thụ thể AT₁ có trong nhiều mô (như cơ trơn mạch máu, tuyến thượng thận). Thụ thể AT₂ cũng được tìm thấy ở nhiều mô nhưng không rõ thụ thể này có liên quan gì đến điều hòa tim mạch hay không. Cả losartan và chất chuyển hóa chính có hoạt tính đều không biểu lộ tác dụng chủ vận cục bộ ở thụ thể AT₁ và đều có ái lực với thụ thể AT₁ lớn hơn nhiều (khoảng 1000 lần) so với thụ thể AT₂. Các nghiên cứu kết hợp in vitro cho thấy losartan là một chất ức chế cạnh tranh thuận nghịch của thụ thể AT₁. Chất chuyển hóa có hoạt tính của thuốc mạnh hơn từ 10 đến 40 lần so với losartan, tính theo trọng lượng và là một chất ức chế không cạnh tranh, thuận nghịch của thụ thể. Cả losartan và chất chuyển hóa có hoạt tính của nó đều không ức chế ACE (kininase II, là men chuyển angiotensin I thành angiotensin II và phân huỷ bradykinin); cũng như không kết hợp hoặc ức chế các thụ thể hormone khác hoặc các kênh ion được biết là quan trọng trong điều hòa tim mạch.

B. ĐƯỢC ĐỘNG HỌC

Sau khi uống, losartan được hấp thu tốt và chuyển hóa lần đầu qua gan, tạo thành một chất chuyển hóa có hoạt tính (E-3174) và các chất chuyển hóa khác không có hoạt tính khác. Sinh khả dụng của viên losartan là khoảng 33%. Nồng độ đỉnh trung bình của losartan và các chất chuyển hóa có hoạt tính đạt được tương ứng sau 1 giờ và 3-4 giờ. Không có sự khác biệt có ý nghĩa lâm sàng trên nồng độ losartan trong huyết tương khi thuốc được sử dụng chung với thức ăn.

Cả losartan và chất chuyển hóa kết hợp với protein huyết tương hơn 99%, chủ yếu là với albumin. Thể tích phân phối của losartan tương đối thấp, 34 lít.

Nồng độ trong huyết tương của chất chuyển hóa có hoạt tính cao hơn losartan ở tất cả các liều, C_{max} và AUC của E-3174 khoảng 2 và 5-8 lần cao hơn giá trị tương ứng của losartan.

Sau khi uống, nồng độ trong huyết tương của losartan và chất chuyển hóa có hoạt tính giảm nhanh, với thời gian bán huỷ tương ứng khoảng 2 giờ (1,5 – 2,5 giờ) và 6-9 giờ. Do thời gian bán huỷ ngắn, cả losartan và chất chuyển hóa có hoạt tính không tích lũy đáng kể trong huyết tương khi sử dụng liều 100 mg một lần trong ngày.

Độ thanh thải huyết tương của losartan và chất chuyển hóa có hoạt tính tương ứng khoảng 600mL/phút và 50 mL/phút. Losartan được chuyển hóa chủ yếu ở gan. Khoảng 35% liều dùng được bài tiết qua nước tiểu ở dạng không đổi và dạng chuyển hóa. Chỉ 4% liều sử dụng được bài tiết dưới dạng không đổi qua thận. Độ thanh thải thận của losartan là 74 mL/phút. Khoảng 6% liều sử dụng được bài tiết qua nước tiểu dưới dạng chuyển hóa có hoạt tính với độ thanh thải thận 26 mL/phút. Losartan và các chất chuyển hóa cũng được bài tiết qua mật, với 58% liều uống vào được tìm thấy trong phân.

CHỈ ĐỊNH

Điều trị cao huyết áp. Thuốc có thể sử dụng một mình hoặc kết hợp với các thuốc điều trị cao huyết áp khác.

LIỀU LƯỢNG VÀ CÁCH DÙNG

Liều dùng phải được tính tùy theo mỗi bệnh nhân và điều chỉnh tùy theo đáp ứng huyết áp.

Liều khởi đầu thông thường cho người lớn: 50 mg một lần mỗi ngày
Điều chỉnh liều đến 25 mg một lần mỗi ngày cho những bệnh nhân có thể bị mất nước nội mạch, bao gồm những bệnh nhân có sử dụng thuốc lợi tiểu hoặc bị suy gan.

Liều duy trì thông thường: 25-100 mg uống một lần, hoặc chia làm hai lần mỗi ngày

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

Mẫn cảm với bất kỳ thành phần nào của thuốc

Phụ nữ mang thai - Do sử dụng cho phụ nữ mang thai trong 3 tháng giữa và 3 tháng cuối của thai kỳ, các thuốc tác động trên hệ renin - angiotensin (như losartan) có thể gây tổn thương và thậm chí làm chết thai nhi đang phát triển. Ngưng sử dụng losartan ngay khi phát hiện mang thai.

THẬN TRỌNG

Hạ huyết áp triệu chứng có thể xảy ra ở những bệnh nhân bị mất nước nội mạch (ví dụ những bệnh nhân điều trị với thuốc lợi tiểu liều cao). Những trường hợp này nên được điều trị trước khi sử dụng losartan hoặc sử dụng liều khởi đầu thấp hơn.

Theo các dữ liệu dược động học chứng minh nồng độ losartan trong huyết tương gia tăng đáng kể ở những bệnh nhân bị xơ gan, liều thấp hơn nên được xem xét cho bệnh nhân có tiền sử bị suy gan.

Losartan có thể làm tăng ure huyết và creatinine huyết thanh ở những bệnh nhân bị hẹp động mạch thận hai bên hoặc hẹp động mạch của người chỉ có một thận. Những thay đổi này trong chức năng thận có thể hồi phục khi ngưng điều trị.

Hiện chưa biết losartan có được bài tiết qua sữa mẹ hay không. Do thuốc có thể gây những tác dụng bất lợi cho trẻ bú mẹ, nên cân nhắc ngưng thuốc hay ngưng cho con bú mẹ dựa trên tầm quan trọng của việc điều trị cho người mẹ.

TÁC DỤNG PHỤ

Phần lớn các tác dụng không mong muốn đều nhẹ và mất dần với thời gian
Thường gặp, ADR > 1/100
Tim mạch: hạ huyết áp
Thần kinh trung ương: mất ngủ, choáng váng
Nội tiết - Chuyển hóa: tăng kali huyết
Tiêu hóa: tiêu chảy, khó tiêu
Huyết học: hạ nhẹ hemoglobin và hematocrit
Thần kinh cơ - Xương: đau lưng, đau chân, đau cơ
Thận: hạ acid uric huyết (khi dùng liều cao)
Hô hấp: ho (ít hơn khi dùng các chất ức chế ACE), sung huyết mũi, viêm xoang

Thông báo cho bác sĩ biết các tác dụng không mong muốn trong khi dùng thuốc.

QUÁ LIỀU VÀ CÁCH XỬ TRÍ

Dữ liệu về quá liều ở người còn hạn chế. Biểu hiện về quá liều hay gặp nhất có lẽ là hạ huyết áp và nhịp tim nhanh; cũng có thể gặp nhịp tim chậm do kích thích thần kinh đối giao cảm (dây thần kinh phế vị). Nếu hạ huyết áp triệu chứng xảy ra, phải điều trị hỗ trợ.
Cả losartan và chất chuyển hóa có hoạt tính đều không thể loại bỏ được bằng thẩm phân máu.

TƯƠNG TÁC THUỐC

Sử dụng cùng lúc losartan và cimetidine làm tăng khoảng 18% AUC của losartan nhưng không ảnh hưởng đến dược động học của chất chuyển hóa có hoạt tính.

Sử dụng cùng lúc losartan và phenobarbital làm giảm khoảng 20% AUC của losartan và chất chuyển hóa có hoạt tính.

Losartan không ảnh hưởng đến dược động học hoặc dược lực học của warfarin, digoxin dùng đường uống hoặc tiêm tĩnh mạch, và ketoconazole.

TRÌNH BÀY

Hộp 3 vỉ x 10 viên

Hộp 1 vỉ x 5 viên

BẢO QUẢN

Ở nơi khô nhiệt độ không quá 30°C

HẠN DÙNG

36 tháng kể từ ngày sản xuất.

ĐỂ XA TẮM TAY TRẺ EM

THUỐC NÀY CHỈ SỬ DỤNG THEO SỰ KÊ ĐƠN CỦA BÁC SĨ
ĐỌC KỸ HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG TRƯỚC KHI DÙNG
NEU CẦN THÊM THÔNG TIN XIN HỎI Ý KIẾN BÁC SĨ

Sản xuất tại

CÔNG TY TNHH UNITED INTERNATIONAL PHARMA

WHO-GMP, GLP, GSP

Số 16 VSIP II, Đường số 7, Khu Công Nghiệp Việt Nam-Singapore II,
Phường Hoà Phú, Thành Phố Thủ Dầu Một, Tỉnh Bình Dương, Việt Nam

ĐT: 08-39621000, Fax: 08-39621010

®Đăng kí nhãn hiệu United Laboratories, Inc.