

COZAAR 50mg



1. Thành phần hoạt chất:

Losartan.....50mg

2. Thuốc này là thuốc gì

Chất đối kháng thụ thể angiotensin II.

3. Chỉ định điều trị:

Tăng huyết áp cho người lớn và trẻ em trên 6 tuổi.

Điều trị bệnh thận ở người lớn có tăng huyết áp kèm đái tháo đường typ 2 và protein niệu > 0,5 g/ngày.

Điều trị suy tim trên bệnh nhân người lớn thất bại điều trị với thuốc ức chế enzym chuyển hoặc chống chỉ định dùng thuốc ức chế enzym chuyển.

Bệnh nhân nên có phân suất tổng máu thất trái $\leq 40\%$, ổn định về mặt lâm sàng và đang trong chế độ điều trị suy tim.

Giảm nguy cơ đột quy ở người lớn có tăng huyết áp và suy thất trái được ghi lại trên điện tâm đồ.

4. Liều dùng và cách dùng:

-Cách dùng: dùng đường uống.

-Liều dùng:

+Điều trị tăng huyết áp

Losartan được sử dụng trong quản lý bệnh tăng huyết áp, đặc biệt trên bệnh nhân xuất hiện ho sau khi dùng thuốc ức chế ACE. Liều dùng tùy thuộc từng người bệnh và phải điều chỉnh theo đáp ứng huyết áp.

Người lớn: Liều khởi đầu của losartan thường dùng cho người lớn là 50 mg mỗi ngày. Liều có thể tăng lên đến 100 mg nếu cần thiết để kiểm soát huyết áp. Có thể dùng liều khởi đầu thấp hơn 25 mg mỗi ngày cho người bệnh có khả năng mất dịch trong lòng mạch như trong trường hợp dùng thuốc lợi tiểu.

Trẻ em: Không nên dùng cho trẻ dưới 6 tuổi hoặc trẻ em có mức lọc cầu thận dưới 30 ml/phút/1,73 m². Liều khởi đầu 0,7 mg/kg/lần/ ngày, liều tối đa 50 mg/ngày.

+Điều trị tăng huyết áp trên bệnh nhân có phì đại thất trái

Liều khởi đầu thông thường là 50 mg mỗi ngày. Nếu không đáp ứng điều trị, nên bổ sung thêm hydrochlorothiazid 12,5 mg mỗi ngày và/ hoặc tăng liều losartan lên 100 mg mỗi ngày sau khi đã tăng liều hydrochlorothiazid lên 25 mg mỗi ngày.

+Điều trị suy tim

Liều khởi đầu thông thường là 12,5 mg mỗi ngày. Liều lượng nên được điều chỉnh mỗi tuần (ví dụ 12,5 mg mỗi ngày, 25 mg mỗi ngày, 50 mg mỗi ngày, 100 mg mỗi ngày cho đến tối đa 150 mg mỗi ngày).

+Điều trị bệnh thận do đái tháo đường

Liều khởi đầu thông thường là 50 mg mỗi ngày. Liều có thể tăng lên đến 100 mg nếu cần thiết để kiểm soát huyết áp.

-Đối tượng đặc biệt

Suy gan: Nên sử dụng liều losartan là 25 mg mỗi ngày. Thuốc chưa được nghiên cứu trên bệnh nhân suy gan nặng.

Suy thận: Không cần điều chỉnh liều khởi đầu.

Giảm thể tích máu: Nên sử dụng liều khởi đầu 25 mg mỗi ngày.

Người già: Nên sử dụng liều khởi đầu 25 mg mỗi ngày với bệnh nhân trên 75 tuổi. Không cần điều chỉnh liều ở người già.

5. **Chống chỉ định:**

Quá mẫn với losartan.

Mang thai 3 tháng giữa và 3 tháng cuối thai kỳ.

Suy gan nặng.

Phối hợp losartan với các sản phẩm chứa aliskiren là chống chỉ định trên bệnh nhân bị đái tháo đường hoặc suy thận (mức lọc cầu thận < 60 ml/phút/1,73 m²).

6. **Tác dụng không mong muốn**

-Thường gặp

Huyết học: thiếu máu.

Thần kinh: chóng mặt. Tai: mất thăng bằng.

Mạch: hạ huyết áp.

Thận và tiết niệu: suy giảm chức năng thận, suy thận.

Toàn thân: suy nhược, mệt mỏi.

Chuyển hóa: tăng kali huyết, tăng urê huyết, tăng creatinin huyết, hạ Glucose huyết.

7. Tương tác thuốc

Các thuốc điều trị tăng huyết áp khác (như thuốc chống trầm cảm 3 vòng, thuốc chống loạn thần, Baclofen và amifostin): Khi phối hợp với losartan có thể làm tăng nguy cơ tụt huyết áp.

Các tác nhân làm tăng nồng độ kali huyết (chế phẩm chứa kali, thuốc lợi tiểu giữ kali hoặc các thuốc khác): Khi phối hợp với losartan sẽ làm tăng nồng độ kali huyết. Bệnh nhân cần được theo dõi nồng độ kali huyết và có biện pháp điều chỉnh kịp thời.

Lithi: khi phối hợp với các thuốc chặn thụ thể angiotensin II như losartan sẽ làm tăng nồng độ lithi trong máu và tăng độc tính của lithi. Cần kiểm soát nồng độ lithi khi sử dụng phối hợp này.

NSAIDs bao gồm thuốc ức chế chọn lọc COX-2: Trên bệnh nhân người già, giảm thể tích hoặc tổn thương chức năng thận, nếu phối hợp NSAIDs với các thuốc ức chế thụ thể angiotensin như losartan có thể dẫn đến suy giảm trầm trọng chức năng thận, bao gồm suy thận cấp. Các tác dụng này thường có hồi phục. Cần kiểm soát chặt chẽ chức năng thận định kỳ trên bệnh nhân có phối hợp này.

Các thuốc ức chế hệ renin-angiotensin khác bao gồm thuốc chặn thụ thể angiotensin khác, thuốc ức chế enzym chuyển hoặc aliskiren: Khi phối hợp với losartan sẽ làm tăng nguy cơ hạ huyết áp, ngất, tăng kali huyết và thay đổi chức năng thận bao gồm suy thận cấp so với việc dùng đơn trị liệu. Cần theo dõi chặt chẽ huyết áp, chức năng thận và nồng độ các ion trong máu trên bệnh nhân có sự phối hợp này.

Không phối hợp aliskiren với losartan trên bệnh nhân đái tháo đường. Tránh sử dụng aliskiren với losartan trên bệnh nhân suy thận (GFR < 60 ml/phút)

8. Dược động học:

-Người bình thường

+Hấp thu

Sau khi uống, losartan hấp thu tốt và chuyển hóa lần đầu qua gan nhờ các enzym cytochrom P450 (CYP2C9 và CYP3A4). Sinh khả dụng của losartan xấp xỉ 33%.

+Phân bố

Cả losartan và chất chuyển hóa có hoạt tính E-3174 đều liên kết nhiều với protein huyết tương (> 99%), chủ yếu là Albumin. Thể tích phân bố của losartan khoảng 34 lít.

+Chuyển hóa

Losartan được chuyển hóa thành chất chuyển hóa acid carboxylic có hoạt tính E-3174 (EXP-3174) cùng với các chất chuyển hóa không có hoạt tính khác. Nồng độ đỉnh trung bình của losartan đạt trong vòng 1 giờ, của chất chuyển hóa có hoạt tính đạt trong vòng 3 - 4 giờ. Khoảng 14% liều losartan đường uống hoặc đường tĩnh mạch được chuyển thành chất chuyển hóa có hoạt tính,

+Thải trừ

Nửa đời thải trừ của losartan khoảng 2 giờ và của chất chuyển hóa E-3174 khoảng 6 - 9 giờ. Độ thanh thải toàn phần trong huyết tương của losartan là khoảng 600 ml/phút và của chất chuyển hóa có hoạt tính là 50 ml/phút; độ thanh thải của chúng ở thận tương ứng khoảng 75 ml/phút và 26 ml/phút. Khi dùng đường uống, khoảng 4% liều dùng được thải trừ nguyên dạng qua nước tiểu và khoảng 6% liều dùng thải trừ qua nước tiểu dưới dạng các chất chuyển hóa có hoạt tính. Theo đường uống, losartan thải trừ 35% qua đường nước tiểu và khoảng 60% qua phân.

-Quần thể đặc biệt

+ Người già

Nồng độ losartan và chất chuyển hóa chính không thay đổi đáng kể.

+Giới tính

Nồng độ losartan huyết thanh cao hơn hai lần ở nữ giới nhưng nồng độ chất chuyển hóa không khác biệt giữa nam và nữ giới.

+Suy gan

Ở người xơ gan nhẹ và vừa, nồng độ losartan và chất chuyển hóa tăng cao tương ứng 5 và 1,7 lần so với ở nam giới khỏe mạnh.

+Suy thận

Nồng độ losartan không thay đổi ở bệnh nhân có mức lọc cầu thận lớn hơn 10 ml/phút. AUC của losartan cao hơn 2 lần ở bệnh nhân lọc máu, nhưng nồng độ

