

PRINCIPIO ACTIVO:

Cada tableta contiene:
Losartán Potásico 100 mg
Excipientes C.S.P.

VIA DE ADMINISTRACIÓN:

Oral.

FARMACOCINÉTICA:

- Losartán se absorbe muy bien por el tracto digestivo, pero experimenta un importante metabolismo de primer paso.
- Su biodisponibilidad sistémica es de aproximadamente el 35%. Aproximadamente el 14% de una dosis oral es metabolizada en el hígado.
- En el rango de dosis de 10 a 200 mg, la farmacocinética del losartán y de su metabolito es lineal, si bien la curva dosis-respuesta no lo es: a medida que aumentan las dosis, las reducciones de la presión arterial son proporcionalmente más pequeñas.
- Las concentraciones séricas máximas se obtienen al cabo de una hora para el losartán y de 3-4 horas para su metabolito activo, si bien la AUC del metabolito es unas 4 veces mayor.
- Los alimentos reducen las máximas concentraciones plasmáticas y la AUC del losartán en un 10%. Tanto el losartán como su metabolito activo se unen extensamente a las proteínas del plasma, sobre todo a la albúmina.
- Este fármaco no atraviesa fácilmente la barrera hematoencefálica.
- El losartán es metabolizado a su metabolito activo y a otros metabolitos inactivos por el citocromo P430 hepático en particular por los sistemas CYP2C9 y CYP3A4. Este metabolismo se encuentra reducido en los pacientes con insuficiencia hepática o cirrosis, pacientes en los que el aclaramiento del fármaco disminuye considerablemente, siendo necesarios

reajustes en las dosis.

- Aproximadamente el 35% de una dosis oral se excreta por vía renal: un 4% de la dosis se elimina como losartán sin alterar y el resto en forma de metabolitos. El 60% de la dosis se excreta en las heces. En los pacientes con insuficiencia renal (aclaramiento de creatinina < 30 ml/min) las AUCs del losartán y de su metabolito aumentan un 50%, mientras que en los pacientes bajo hemodiálisis aumentan hasta en un 100%.
- Las semividas de eliminación del losartán y de su metabolito activo son de 2 y 6 horas, respectivamente, en los pacientes sin insuficiencia renal.

MECANISMO DE ACCIÓN:

- Losartán y su metabolito activo son antagonistas específicos y selectivos de los receptores de la angiotensina I.
- El metabolito activo del losartán es 10-40 veces más potente que el mismo losartán como ligando de los receptores AT1, siendo el principal responsable de los efectos farmacológicos del losartán.
- Una vez unidos al receptor, ni el losartán, ni su metabolito, muestran actividad agonista.
- El losartán tiene, además, efectos proteinúricos dosis-dependientes y un modesto efecto uricosúrico.

INDICACIONES:

- Tratamiento de la hipertensión, ya sea solo o en combinación con otros agentes antihipertensivos.
- Tratamiento de la Insuficiencia cardíaca congestiva crónica.
- Infarto de miocardio.

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

- Pacientes con hipersensibilidad al componente.
- El losartán no ha sido estudiado en pacientes con estenosis renal, aunque se puede anticipar que mostrará unos efectos similares a los inhibidores de

la enzima de conversión. Estos fármacos pueden ocasionar azoemia en los pacientes con estenosis renal unilateral o bilateral. Por lo tanto, se recomienda la vigilancia de la función renal durante el tratamiento con losartán.

- De la misma manera, el losartán se debe administrar con precaución en los pacientes con hipovolemia debido a que la depleción del volumen intravascular aumenta el riesgo de hipotensión durante el tratamiento. En estos pacientes, se recomienda iniciar el tratamiento con dosis más bajas.

- El bloqueo de la angiotensina II puede elevar las concentraciones de potasio al bloquear la secreción de aldosterona, pudiendo empeorar una hiperkaliemia existente. Se debe instruir a los pacientes para que no utilicen suplementos de potasio o sales de régimen a base de potasio sin consultar previamente al médico.

- El losartán puede aumentar los efectos hipotensores de los anestésicos generales utilizados en cirugía. Por lo tanto, debe ser administrado con precaución previamente a una intervención quirúrgica. Si durante la anestesia o el procedimiento se desarrollase una hipotensión debida al bloqueo de la angiotensina II, puede ser corregida mediante la expansión de volumen.

EFFECTOS ADVERSOS:

- Los efectos adversos digestivos (diarrea, 2.4% y dispepsia, 1.3%) fueron ligeramente superiores a los del placebo.

- En menos del 1% de los pacientes se observó hipotensión ortostática y síncope y algunos efectos musculoesqueléticos detectados con una frecuencia algo mayor que el placebo fueron mialgia (1.1% vs 0.38% para el losartán y el placebo, respectivamente), calambres musculares (1% vs. 0.9%) dolor de espalda (1.8% vs. 1.2%) y dolor de piernas (1% frente al 0%).

- Los efectos adversos sobre el sistema nervioso central son mareos (3.5%) e insomnio (1.4%) También se han comunicado cefaleas, astenia y fatiga pero estos también fueron observados y con mayor frecuencia en los pacientes tratados con

placebo

- Los efectos sobre el sistema respiratorio que se observaron con mayor frecuencia en los pacientes tratados con losartán fueron congestión nasal (3.4% vs 3.3%), tos (3.4% vs 3.3%) e infecciones del tracto respiratorio superior (7.9% vs 6.9%).

- Se han comunicado varios casos de reacciones anafilácticas y de angioedema en pacientes tratados con losartán, aunque desde el punto de vista teórico, los antagonistas del receptor AT1 no causan la acumulación de cininas.

DOSIFICACIÓN:

- Adultos: las dosis iniciales deben de ser 50 mg una vez al día a menos que el paciente sufra una depleción de volumen. Las dosis de mantenimiento oscilan entre 25 y 100 mg administrados en 1-2 dosis divididas. Los máximos efectos antihipertensivos se observan al cabo de 3 a 6 semanas.

- El uso concomitante de un diurético tiene un efecto más importante que el aumentar las dosis de losartán más allá de los 50 mg/día. Por ejemplo, la adición de 12.5 mg de hidroclorotiazida a 50 mg de losartán resulta en una reducción adicional del 50% de las presiones arteriales sistólica y diastólica, mientras que el pasar de 50 a 100 mg/día de losartán sólo reduce la presión arterial en 3 mm de Hg.

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS:

- Losartán no afecta la farmacocinética de la digoxina, ni de la hidroclorotiazida, ni de la warfarina.

- Por el contrario, el fenobarbital y el ritonavir reducen la AUC del losartán y de su metabolito en un 20%, si bien se desconoce la significancia clínica de esta interacción.

- El uso concomitante del losartán con diuréticos ahorradores de potasio o suplementos de potasio pueden ocasionar un aumento de los niveles plasmáticos de potasio.

- El losartán puede incrementar los efectos antihipertensivos de otros fármacos o diuréticos administrados simultáneamente. Este efecto puede ser aprovechado clínicamente, siendo necesario

el reajuste de la dosis. Cuando se asocia a diuréticos tiazídicos el losartán revierte la pérdida de potasio y el aumento de ácido úrico que suelen ocasionar dichos diuréticos.

- El fluconazol es un potente inhibidor del sistema enzimático hepático CYP2C9 y puede inhibir la conversión del losartán a su metabolito activo, aunque no hay datos clínicos acerca de esta interacción. Un informe sugiere que el losartán puede aumentar los niveles plasmáticos de litio, por lo que se recomienda monitorizar los niveles plasmáticos de este elemento en los pacientes que sean tratados con losartán.

CONSERVACIÓN:

Conservar a temperatura no mayor a 30 °C.

ADVERTENCIA:

Producto de uso delicado. Adminístrese bajo prescripción y vigilancia médica.

Mantener fuera del alcance de los niños.

Venta bajo receta medica.

PRESENTACIÓN:

Caja x 30 Tabletas de 100 mg.

