

## LOSARTAN POTÁSSICO

*Anti-hipertensivo*

### Propriedades:

É o primeiro derivado de uma nova geração de medicamentos denominados antagonistas da angiotensina II (ATII), que desenvolve um efeito gradual e prolongado sobre os valores sistó-diastólicos de indivíduos hipertensos. Trata-se de uma substância sintética de estrutura química original-befeniltetrazol, de natureza não peptídica, que pela sua semelhança estrutural compete com o receptor específico da angiotensina II, inibindo, dessa forma, sua ligação com esse agonista endógeno. Sua elevada afinidade e especificidade in vitro e in vivo sobre os receptores AT1 da angiotensina II, localizados preferentemente no músculo liso vascular e em outras estruturas (miocárdio, rim, cérebro, supra-renal), e seu comportamento com agonista puro sem efeito agonista parcial, o destacam como um agente anti-hipertensivo seguro e eficaz.· diferença do seu antecessor, a saralasin (somente para uso intravenoso em infusão contínua), o losartan é ativo por via oral, em doses de 50mg diários em uma tomada única (tendo a mesma potência que 10mg de enalapril). Após a sua administração oral, esse derivado imidazólico benzil-substituído sofre uma biotransformação hepática (efeito de primeira passagem) que reduz significativamente sua absorção sistêmica a 33% e produz um metabólito ativo, o ácido 5-carboxílico, de meia-vida prolongada, que contribui para prolongar a ação anti-hipertensiva durante 24 horas com uma única tomada diária, graças à ação aditiva ou de somação entre o fármaco e seu metabólito ativo. A meia-vida plasmática é de 2,3 horas para o losartan e de 6,7 horas para o metabólito ativo (E-3174), enquanto que a proporção que se liga às proteínas é elevada (>99%).A absorção digestiva do fármaco não é afetada pela presença de alimentos no estômago; depois da administração de uma dose única oral de 50mg, atinge o pico plasmático máximo em 60 minutos, com um volume de distribuição de 34 litros, aproximadamente, sem que seja observado fenômeno de acumulação com a administração contínua e prolongada, inclusive de doses elevadas (100mg). A excreção seguida com losartan marcado com <sup>14</sup>C mostrou 35% de eliminação pela urina e 58% pelas fezes. Os estudos clínicos duplo-cego com losartan em pacientes com hipertensão essencial leve ou moderada mostraram uma boa resposta anti-hipertensiva sistó-diastólica em comparação com betabloqueadores (atenolol), diuréticos (hidroclorotiazida) e antagonistas de cálcio. A tolerância medicamentosa do losartan, assim como sua inocuidade e segurança foram confirmadas pelo uso crônico; destaca-se a menor incidência de tosse (3%) em comparação com a registrada com os inibidores da ECA (10%).Não se registrou efeito

Alcântara - Rua Yolanda Saad Abuzaid, 150, lojas 118/119. Telefone (21) 2601-1130

Centro / Zé Garoto - Rua Coronel Serrado, 1630, lojas 102/103. Telefone (21) 2605-1349



vendas@farmacam.com.br



whatsapp (21) 98493-7033



Facebook.com.br/farmacam



Instagram.com.br/farmacam

rebote nos valores tensionais de pacientes hipertensos que reduziram ou suspenderam o losartan.

### **Ações terapêuticas**

Anti-hipertensivo.

### **Indicações**

Hipertensão arterial essencial leve a moderada. Insuficiência cardíaca congestiva.

### **Contra-indicações**

Crianças. Gravidez e lactação. Hipersensibilidade ao losartan.

### **Dosagem Usual**

A dose média aconselhada é de 50mg em uma tomada diária. Em indivíduos idosos, com mais de 75 anos ou com deterioração das funções hepática ou renal aconselha-se iniciar o tratamento com 25mg. Em indivíduos hipertensos refratários ou que não respondem à dose habitual pode-se chegar a 100mg diários, mas não se obtiveram melhorias com doses maiores.

NOTA: Não é necessário fazer conversão. Respeitar o fator de diluição especificado no laudo.

### **Efeitos Adversos:**

Geralmente apresenta uma ótima tolerância, mas alguns pacientes apresentaram ocasionalmente (<1%) tonturas, exantema cutâneo, hipotensão ortostática, valores elevados de TGP que se normalizam ao suspender o tratamento. · diferença dos inibidores da enzima conversora da angiotensina, a incidência de tosse seca é menor (3% vs. 10%) e equiparável ao placebo.

### **Precauções:**

Aconselha-se empregar com precaução em pacientes com insuficiências renal ou hepática grave, estenose da artéria renal e antecedentes de alergia ou hipersensibilidade. Deve-se ter especial precaução ao iniciar a terapia em pacientes com insuficiência cardíaca, indivíduos desidratados ou com depleção hidrossalina (uso de diuréticos, dietas hipossódicas estritas) pois o losartan pode produzir maior hipotensão arterial. Aconselha-se controlar periodicamente a potassemia em indivíduos idosos ou com transtornos da função renal. Em indivíduos submetidos a cirurgia maior ou durante a anestesia com medicamentos anti-



hipertensivos, pode bloquear a ATII formada como consequência da liberação compensadora de renina e a hipotensão resultante deve ser corrigida com expansores de volume.

#### Interações Medicamentosas:

O emprego de diuréticos poupadores de potássio pode incrementar a potassemia. Não foram registradas interações significativas com o emprego simultâneo de antagonistas de cálcio, betabloqueadores e diuréticos tiazídicos. A combinação com hidroclorotiazida pode potencializar a resposta hipotensiva. A hemodiálise não serve para eliminar o losartan e seu metabólito ativo.

#### Tabela:

<b>Nome Comum</b>	Losartan
<b>Denominação Científica</b>	2-Butyl-4-chloro-1-[ <i>p</i> -( <i>o</i> -1 <i>H</i> -tetrazol-5-ylphenyl)benzyl]imidazole-5-methanol potassium.
<b>Aspecto</b>	Pó branco ou ligeiramente amarelo
<b>Solubilidade</b>	Solúvel em água, metanol e etanol; praticamente insolúvel em clorofórmio.
<b>DL-50 (oral)</b>	2.248mg/Kg em camundongos
<b>Armazenamento</b>	Manter distante do calor, umidade e calor.

#### Referências bibliográficas

The complete drug reference - Martindale 32<sup>nd</sup>