

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

СПИРОНОЛАКТОН

Регистрационный номер:	ЛП-003702
Торговое наименование:	Спиронолактон
Международное непатентованное наименование:	спиронолактон
Лекарственная форма:	таблетки
Состав на одну таблетку:	
Активное вещество:	спиронолактон 25,0 мг.
Вспомогательные вещества:	
Лактозы моногидрат (сахар молочный)	117,0 мг
Крахмал кукурузный	50,0 мг
Повидон-К25	5,0 мг
Кремния диоксид коллоидный	1,0 мг
Магния стеарат	2,0 мг

Описание: круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или белого с желтоватым оттенком цвета с риской с одной стороны и фаской с двух сторон, с характерным запахом.

Фармакотерапевтическая группа:

диуретическое калийсберегающее средство.

Код АТХ: С03DA01

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика

Калийсберегающий диуретик, действие которого обусловлено антагонизмом альдостерона (минералокортикостероидный гормон коры надпочечников). Альдостерон способствует обратному всасыванию ионов натрия в почечных канальцах и усиливает выведение ионов калия. Спиронолактон – конкурентный антагонист альдостерона по влиянию на дистальные отделы нефрона (конкурирует за места связывания на цитоплазматических белковых рецепторах, снижает синтез пермеаз в альдостеронзависимом участке собирательных трубочек и дистальных канальцев), повышает выведение ионов натрия, хлора и воды и уменьшает выведение ионов калия и мочевины, снижает кислотность мочи. Усиление диуреза вызывает антигипертензивный эффект, который непостоянен. Диуретический эффект проявляется на 2-5 день лечения.

Фармакокинетика

При приеме внутрь быстро и полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта. Биодоступно – 100%. Максимальная концентрация при ежедневном приеме 100 мг в течение 15 дней – 80 нг/мг, время, необходимое для достижения максимальной концентрации после очередного утреннего приема – 2,6 ч.

После всасывания метаболизируется в печени до нескольких активных серосодержащих метаболитов (80%), в том числе канренона (20%), максимальная концентрация которого определяется через 2-4 ч. после приема внутрь. Связь с белками плазмы крови – 98% (канренона – 90%). Плохо проникает в органы и ткани, но проникает через плацентарный барьер, а канренон - в грудное молоко. Объем распределения – 0,05 л/кг.

Выводится почками (50% - в виде метаболитов, 10% - в неизмененном виде), частично - через кишечник. Выведение канренона (главным образом почками) двухфазное, период полувыведения в первой фазе – 2-3 ч, во второй – 12-96 ч.

При циррозе печени и хронической сердечной недостаточности период полувыведения возрастает без признаков кумуляции (ее вероятность увеличивается на фоне хронической почечной недостаточности и гиперкалиемии). Период полувыведения – 13-24 ч.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

- эссенциальная гипертензия (в составе комбинированной терапии);

- отёчный синдром при хронической сердечной недостаточности (может применяться в монотерапии и в составе комбинированной терапии);

- состояния, при которых может обнаруживаться вторичный гиперальдостеронизм, включая цирроз печени, сопровождающийся асцитом и/или отёками, нефротический синдром, а также другие состояния, сопровождающиеся отёками;

- гипокалиемия/гипомагниемия (в качестве вспомогательного средства для её профилактики во время лечения диуретиками при невозможности применения других способов коррекции содержания калия);

- первичный гиперальдостеронизм (синдром Конна) - для короткого предоперационного курса лечения;

- для установления диагноза первичного гиперальдостеронизма;

- тяжелая хроническая сердечная недостаточность (III-IV функциональный класс по классификации NYHA) на фоне стандартной терапии.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- повышенная чувствительность к спиронолактону и любому из компонентов препарата.

- болезнь Аддисона;

- гиперкалиемия;

- гипонатриемия;

- тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 10 мл/мин);

- анурия;

- дефицит лактозы, непереносимость лактазы, синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции;

- беременность;

- период лактации (грудное вскармливание);

- детский возраст до 3 лет (твердая лекарственная форма);

- одновременное применение эплеренона и других калийсберегающих диуретиков, препаратов калия (риск развития гиперкалиемии).

С осторожностью

Атриовентрикулярная блокада (возможность усиления в связи с развитием гиперкалиемии); сахарный диабет (при подтвержденной или предполагаемой хронической почечной недостаточности); диабетическая нефропатия; дисменорея; гиперкальциемия; метаболический ацидоз; печеночная недостаточность, цирроз печени; хирургические вмешательства; гинекомастия и одновременный приём лекарственных препаратов, вызывающих гинекомастию; проведение местной и общей анестезии; пожилой возраст.

ПРИМЕНЕНИЕ ПРИ БЕРЕМЕННОСТИ И В ПЕРИОД ГРУДНОГО ВСКАРМЛИВАНИЯ

Применение препарата во время беременности и в период грудного вскармливания противопоказано. При необходимости применения в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Внутрь. Одновременно с приемом пищи.

При эссенциальной гипертензии:

Суточная доза для взрослых обычно составляет 50-100 мг однократно и может быть увеличена до 200 мг, при этом увеличивать дозу следует постепенно, 1 раз в 2 недели.

Чтобы добиться адекватного ответа на терапию, препарат необходимо принимать не менее 2 недель. При необходимости проводят коррекцию дозы.

При идиопатическом гиперальдостеронизме: 100-400 мг/сут.

При выраженном гиперальдостеронизме и гипокалиемии:

Суточная доза составляет 300 мг/сут (максимально 400 мг) за 2-3 приёма, при улучшении состояния дозу постепенно снижают до 25 мг/сут.

При гипокалиемии и/или гипомагниемии, вызванных терапией диуретиками:

назначают препарат в дозе 25-100 мг/сут. однократно или в несколько приёмов. Максимальная суточная доза 400 мг, если препараты калия для приема внутрь или другие методы восполнения его дефицита неэффективны.

При диагностике и лечении первичного гиперальдостеронизма в качестве диагностического средства при коротком диагностическом тесте:

препарат назначают в течение 4 дней по 400 мг/сут, распределив суточную дозу на несколько приёмов в день. При увеличении содержания калия в крови во время приёма препарата и снижении после отмены его, можно предполагать наличие первичного гиперальдостеронизма.

При длительном диагностическом тесте:

препарат назначают в той же дозе в течение 3-4 недель. При достижении коррекции гипокалиемии и артериальной гипертензии можно предполагать наличие первичного гиперальдостеронизма.

Короткий курс предоперационной терапии первичного гиперальдостеронизма:

после того, как диагноз гиперальдостеронизма установлен с помощью более точных диагностических методов, Спиронолактон следует принимать по 100-400 мг/сут. разделив на 1-4 приёма в сутки в течение всего периода подготовки к хирургическому вмешательству. Если операция не показана, то Спиронолактон применяется для проведения длительной поддерживающей терапии, при этом применяется наименьшая эффективная доза, которая подбирается индивидуально для каждого пациента.

Отеки на фоне нефротического синдрома:

Суточная доза для взрослых обычно составляет 100-200 мг. Не выявлено влияния спиронолактона на основной патологический процесс, и поэтому применение данного препарата рекомендуется только в тех случаях, когда другие виды терапии оказываются неэффективны.

При отёчном синдроме на фоне хронической сердечной недостаточности:

препарат назначают ежедневно, в течение 5 дней по 100-200 мг/сут в 2-3 приёма.

В зависимости от эффекта, суточную дозу уменьшают до 25 мг. Поддерживающая доза подбирается индивидуально. Максимальная доза 200 мг/сут.

Отеки на фоне цирроза печени:

Если в моче соотношение ионов натрия и калия (Na⁺/K⁺) превышают 1,0, то суточная доза для взрослых обычно составляет 100 мг. Если соотношение меньше 1,0, то суточная доза для взрослых обычно равна 200-400 мг. Поддерживающая доза подбирается индивидуально.

При отеках у детей:

Начальная доза составляет 1-3,3 мг/кг массы тела или 30-90 мг/м²/сут. в 1-4 приёма.

Через 5 дней дозу корректируют и при необходимости увеличивают в 3 раза по сравнению с первоначальной. Применение у пожилых пациентов:

Рекомендуется начинать лечение с минимальной дозы и титровать ее до достижения максимально необходимой дозы под контролем функции печени/почек. Тяжелая хроническая сердечная недостаточность (III-IV функциональный класс по классификации NYHA) на фоне стандартной терапии:

Лечение начинают с 25 мг 1 раз в сутки, если калий сыворотки крови менее 5,0 мг-экв/л и креатинина крови менее 2,5 мг/л. Пациентам, которые хорошо переносят дозу 25 мг 1 раз/сутки дозу возможно увеличить до 50 мг 1 раз/сутки. Лечение проводят под контролем содержания калия и креатинина крови через одну неделю после начала терапии или увеличения дозы, затем ежемесячно в течение первых 3-х месяцев, затем ежеквартально в течение года, а затем каждые 6 месяцев.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, изъязвления и кровотечения желудочно-кишечного тракта, гастрит, кишечная колика, боль в животе, диарея или запор, нарушение функции печени.

Со стороны нервной системы: атаксия, заторможенность, головокружение, головная боль, сонливость, летаргия, спутанность сознания, мышечный спазм.

Со стороны эндокринной системы: при длительном применении – гинекомастия, нарушение эрекции у мужчин, снижение потенции; у женщин – дисменорея, аменорея, метроррагия в климактерическом периоде, гирсутизм, гипертрихоз, огрубление голоса, боли в области молочных желёз, карцинома молочной железы.

Со стороны мочевыделительной системы: острая почечная недостаточность.

Со стороны органов кроветворения: агранулоцитоз, тромбоцитопения, мегалобластоз.

Аллергические реакции: лекарственная лихорадка, крапивница, макулопапулёзная и эритематозная сыпь, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Со стороны кожных покровов: алопеция, кожный зуд.

Со стороны лабораторных показателей: повышение концентрации мочевины, гиперкреатининемия, гиперурикемия, нарушение водно-электролитного обмена и кислотно-основного состояния (метаболический гипохлоремический ацидоз или алкалоз).

Прочие: судороги икрожных мышц, мышечный спазм.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Симптомы: тошнота, рвота, головокружение, снижение артериального давления, диарея, кожная сыпь, гиперкалиемия (парестезия, миастения, аритмии, слабость), гипонатриемия (сухость в полости рта, жажда, сонливость), гиперкальциемия, дегидратация, повышение концентрации мочевины.

Лечение: промывание желудка, симптоматическая терапия дегидратации и артериальной гипотензии.

При гиперкалиемии необходимо нормализовать водно-электролитный обмен с помощью калийвыводящих диуретиков, быстрого парентерального введения раствора декстрозы (глюкозы) (5-20% растворы) с инсулином из расчёта 0,25-0,5 ЕД на 1 г декстрозы (глюкозы); при необходимости возможно повторное введение декстрозы (глюкозы). В тяжёлых случаях проводят гемодиализ.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ ПРЕПАРАТАМИ

Снижает эффект антикоагулянтов, непрямых антикоагулянтов (гепарина, производных кумарина, индандиона) и токсичность сердечных гликозидов (т.к. нормализация содержания калия в крови препятствует развитию токсичности).

Усиливает метаболизм феназола (антипирина).

Снижает чувствительность сосудов к норэпинефрину (требует соблюдения осторожности при проведении анестезии).

Юридический адрес: 445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Песочная, д. 11

Адрес места производства (адрес для переписки, в том числе для приема претензий):

445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6

Тел./факс: (84862) 3-41-09

Увеличивает период полувыведения дигоксина - возможна интоксикация дигоксином.

Усиливает токсическое действие лития из-за снижения его клиренса.

Ускоряет метаболизм и выведение карбеноксолона. Карбеноксолон способствует задержке натрия спиронолактоном.

Глюкокортикостероидные препараты и диуретики (производные бензотиазина, фуросемид, этакриновая кислота) усиливают и ускоряют диуретический и натрийуретический эффект.

Усиливает действие диуретических и гипотензивных лекарственных средств.

Нестероидные противовоспалительные препараты снижают диуретический и натрийуретический эффекты, увеличивается риск развития гиперкалиемии.

Глюкокортикостероидные препараты усиливают диуретический и натрийурический эффект при гипоальбуминемии и/или гипонатриемии.

Возрастает риск развития гиперкалиемии при приёме с препаратами калия, калиевыми добавками и калийсберегающими диуретиками, ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента (ацидоз), антагонистами рецепторов ангиотензина II, блокаторами альдостерона, индометацина, циклоспорина. Салицилаты, индометацин снижают диуретический эффект.

Хлорид аммония, колестирамин способствуют развитию гиперкалиемического метаболического ацидоза. Флуорокортизон вызывает парадоксальное усиление канальцевой секреции калия.

Снижает эффект митотана.

Усиливает эффект трипторелина, бусерелина, гонадорелина.

Этанол, барбитураты, наркотические вещества усиливают ортостатическую гипотензию.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Возможно временное повышение концентрации азота мочевины в сыворотке крови, особенно при сниженной функции почек и гиперкалиемии. Возможен обратимый гиперхлоремический метаболический ацидоз.

При нарушениях функции почек и печени, а также в пожилом возрасте, необходим регулярный контроль показателей электролитов сыворотки крови и функции почек.

Препарат затрудняет определение дигоксина, кортизола и адреналина в крови.

Несмотря на отсутствие прямого воздействия на углеводный обмен, наличие сахарного диабета, особенно с диабетической нефропатией, требует особой осторожности из-за возможности развития гиперкалиемии.

При лечении нестероидными противовоспалительными препаратами следует контролировать функцию почек и показатели электролитов крови. Следует избегать употребления пищи, богатой калием.

Во время лечения употребление алкоголя противопоказано.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами
В начальном периоде лечения запрещается управлять транспортными средствами и заниматься другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций. Длительность ограничений устанавливается в индивидуальном порядке.

ФОРМА ВЫПУСКА

Таблетки 25 мг.

По 10, 20 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 10, 20, 30, 40, 50 или 100 таблеток в банки из полиэтилентерефталата для лекарственных средств, укупоренные крышками навинчиваемыми с контролем первого вскрытия или системой «нажать-вернуть» из полипропилена или полиэтилена, или банки полипропиленовые для лекарственных средств, укупоренные крышками натягиваемыми с контролем первого вскрытия из полиэтилена высокого давления.

Одну банку или 1, 2, 3, 4 или 5 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в картонную упаковку (пачку).

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года. Не использовать препарат после истечения срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.