

Состав

действующее вещество: торасемид;

1 мл раствора для инъекций содержит торасемида в пересчете на 100 % сухое вещество – 5 мг;

вспомогательные вещества: полиэтиленгликоль (макрогол) 400, трометамол, натрия гидроксид, вода для инъекций.

Лекарственная форма

Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная жидкость, практически не содержит механических включений. pH Торасемида: 8,5–9,5.

Фармакотерапевтическая группа

Мочегонные препараты. Высокоактивные диуретики.

Код АТХ С03С А04.

Фармакодинамика

Торасемид действует как салуретик, его действие связано с угнетением ренальной абсорбции ионов натрия и хлора в восходящей части петли Генле. У человека диуретический эффект быстро достигает своего максимума в течение первых 2–3 часов после внутривенного и перорального применения соответственно и остается постоянным в течение почти 12 часов. У здоровых пробандов в диапазоне доз 5–100 мг наблюдалось пропорциональное логарифму дозы увеличение диуреза (петлевая активность диуретика). Увеличение диуреза наблюдалось даже в тех случаях, когда другие мочегонные средства, например, дистально действующие диуретики тиазидового ряда, уже не оказывали нужного эффекта, например, при почечной недостаточности. Благодаря такому механизму действия торасемид приводит к уменьшению отеков. В случае сердечной недостаточности торасемид уменьшает проявления заболевания и улучшает функционирование миокарда за счет уменьшения пре- и постнагрузки.

Фармакокинетика

Связывание торасемида с белками плазмы крови составляет более 99 %, метаболитов М1, М3 и М5 – 86 %, 95 % и 97 % соответственно. Видимый объем

распределения (V_z) составляет 16 л. В организме человека торасемид метаболизируется с образованием трех метаболитов М1, М3 и М5.

Доказательства существования других метаболитов отсутствуют. Метаболиты М1, М3 и М5 образуются в результате ступенчатого окисления присоединенной к фенильному кольцу метильной группы до карбоновой кислоты, метаболит М3 образуется в результате гидроксирования кольца. У человека не удалось обнаружить метаболиты М2 и М4, которые были найдены в экспериментах на животных.

Фармакокинетика торасемида и его метаболитов характеризуется линейной зависимостью. Это означает, что его максимальная концентрация в сыворотке крови и площадь под кривой содержания в сыворотке крови увеличивается пропорционально дозировке. Конечный период полувыведения ($t_{1/2}$) торасемида и его метаболитов у здоровых людей составляет 3–4 часа. Общий клиренс торасемида составляет 40 мл/мин, ренальный клиренс – примерно 10 мл/мин. У здоровых людей примерно 80 % от введенной дозы выводится в виде торасемида и его метаболитов с мочой с таким средним процентным отношением: торасемид – примерно 24 %, метаболит М1 – примерно 12 %, метаболит М3 – примерно 3 %, метаболит М5 – примерно 41 %. Основным метаболитом М5 диуретического эффекта не имеет, а на действующие метаболиты М1 и М3, взятые вместе, приходится примерно 10 % всего фармакодинамического действия. При почечной недостаточности общий клиренс и период полувыведения торасемида не изменяются, а период полувыведения М3 и М5 продлевается. Однако фармакодинамические характеристики остаются неизменными, а степень тяжести почечной недостаточности на продолжительность действия не влияет. У пациентов с нарушением функции печени или сердечной недостаточностью период полувыведения торасемида и метаболита М5 незначительно увеличивается, а количество вещества, которое выводится с мочой, почти полностью равно количеству выводимого у здоровых людей, поэтому накопление торасемида и его метаболитов не происходит. Торасемид и его метаболиты практически не выводятся при гемодиализе и гемофильтрации.

Показания

Лечение отеков и/или выпотов, вызванных сердечной недостаточностью, если необходимо внутривенное применение лекарственного средства, например, в случае отека легких вследствие острой сердечной недостаточности.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к действующему веществу, препаратов сульфонилмочевины и к одному из вспомогательных веществ препарата. Почечная недостаточность с анурией. Печеночная кома или прекома. Артериальная гипотензия. Гиповолемия. Гипонатриемия. Гипокалиемия. Острое нарушение мочеиспускания, например, вследствие гипертрофии предстательной железы. Период кормления грудью.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Торасемид усиливает действие других антигипертензивных средств, в частности, ингибиторов ангиотензинпревращающего фермента, что может привести к чрезмерному снижению артериального давления при их одновременном применении. При одновременном применении торасемида с препаратами дигиталиса дефицит калия, вызванный применением диуретиков, может привести к повышению и усилению побочного действия обоих препаратов. Торасемид может снижать эффективность противодиабетических средств. Пробенецид и нестероидные противовоспалительные средства (например индометацин, ацетилсалициловая кислота) могут тормозить диуретическое и гипотензивное действие торасемида. При лечении салицилатами в высоких дозах торасемид может повысить их токсическое действие на центральную нервную систему. Торасемид, особенно в высоких дозах, может усилить ототоксическое и нефротоксическое действие аминогликозидных антибиотиков, например, канамицина, гентамицина, тобрамицина и цитостатических средств – активных производных платины, а также нефротоксическое действие цефалоспоринов. Торасемид может усиливать действие теофиллина, а также влияние курареподобных лекарственных средств. Слабительные средства, а также минерало- и глюкокортикоиды могут усилить потерю калия, обусловленную торасемидом. При одновременном применении торасемида и препаратов лития возможно повышение концентрации лития в плазме крови, что может вызвать усиление влияния и усиление побочных эффектов лития. Торасемид может снижать сосудосуживающее действие катехоламинов, например, эпинефрина и норэпинефрина. При одновременном применении с холестирамином может снижаться всасывание торасемида и соответственно его ожидаемая эффективность.

Особенности применения

Перед началом применения препарата необходимо устранить существующую гипокалиемию, гипонатриемию или гиповолемию.

При длительном применении торасемида рекомендуется осуществлять регулярный контроль электролитного баланса, в частности калия в сыворотке крови, особенно у пациентов, одновременно принимающих гликозиды наперстянки, глюкокортикостероиды, минералокортикостероиды или слабительные средства. Кроме этого, необходимо регулярно контролировать содержание глюкозы, мочевой кислоты, креатинина и липидов в крови. Торасемид следует с особой осторожностью применять пациентам, страдающим заболеваниями печени, сопровождающимися циррозом печени и асцитом, поскольку внезапные изменения водно-электролитного баланса могут привести к печеночной коме. Терапию с применением торасемида (как и других мочегонных средств) пациентам этой группы необходимо проводить в условиях стационара. Для предупреждения гипокалиемии и метаболического ацидоза препарат следует назначать с препаратами-антагонистами альдостерона или препаратами, способствующими задержке калия в организме.

После применения торасемида наблюдались случаи ототоксичности (шум в ушах и потеря слуха), которые имели обратимый характер, однако прямой связи с применением препарата не установлено. При назначении диуретиков необходимо тщательно контролировать клинические симптомы нарушения электролитного баланса, гиповолемии, экстраренальной азотемии и других нарушений, которые могут проявляться в виде сухости во рту, жажды, слабости, вялости, сонливости, возбуждения, мышечной боли или судорог, миастении, гипотонии, олигурии, тахикардии, тошноты, рвоты. Чрезмерный диурез может стать причиной обезвоживания организма, привести к снижению объема циркулирующей крови, тромбообразованию и эмболии, особенно у пациентов пожилого возраста.

Пациентам с нарушениями водно-электролитного баланса необходимо прекратить применение препарата и после устранения нежелательных эффектов восстановить терапию, начиная с более низких доз.

Вследствие того, что при лечении торасемидом может наблюдаться увеличение содержания глюкозы в крови, у пациентов с латентным и явным сахарным диабетом необходимо проводить постоянную тщательную проверку метаболизма углеводов. Также необходим регулярный контроль картины крови (эритроциты, лейкоциты, тромбоциты). Особенно в начале лечения пациентам пожилого возраста необходимо обращать особое внимание на появление симптомов потери электролитов и сгущения крови.

В случае отсутствия достаточного клинического опыта применения не следует назначать торасемид при наличии следующих заболеваний и состояний: подагра; аритмии, например, синоатриальная блокада, атриовентрикулярная

блокада II и III степеней; патологические изменения кислотно-щелочного метаболизма; сопутствующая терапия с применением препаратов лития, аминогликозидов или цефалоспоринов; патологические изменения картины крови, например, тромбоцитопения или анемия у больных без почечной недостаточности; нарушения функций почек, вызванные нефротоксичными веществами.

Применение препарата Торасемид может быть причиной получения положительного результата при осуществлении теста на допинг. Невозможно прогнозировать влияние на состояние здоровья, если препарат Торасемид применен неправильно, то есть с целью допинга, – в этом случае нельзя исключить возможный вред для здоровья.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Даже при надлежащем применении торасемид может повлиять на реакцию пациента до такой степени, что это повлечет значительное негативное влияние на способность управлять автотранспортом или выполнять работу с другими механизмами, или выполнять работу без подстраховки. Это во многом касается таких случаев как начало лечения, увеличение дозы препарата, замена лекарственного средства или при назначении сопутствующей терапии. Поэтому во время применения торасемида нужно быть очень осторожным при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность. Достоверные данные о влиянии торасемида на эмбрион и плод у человека отсутствуют. В экспериментах на животных была показана репродуктивная токсичность торасемида. Торасемид проникает через плацентарный барьер. В связи с вышеизложенным торасемид можно применять в период беременности только по жизненным показаниям и в минимально возможной эффективной дозе. Диуретики непригодны для стандартной схемы лечения артериальной гипертензии или отеков у беременных, поскольку они способны снижать перфузию плацентарного барьера и вызывать токсическое воздействие на внутриутробное развитие плода. Если торасемид применять для лечения беременных с сердечной недостаточностью или почечной недостаточностью, то необходимо проводить тщательный мониторинг за электролитами и гематокритом, а также за развитием плода.

Период кормления грудью. В настоящее время не установлено, проникает ли торасемид в грудное молоко у животных или человека. Нельзя исключить риск

применения препарата у новорожденных/грудных детей. Поэтому применение торасемида в период лактации противопоказано. Если необходимо применять торасемид в этот период, то кормление грудью следует прекратить.

Фертильность. Исследование влияния торасемида на фертильность у людей не проводили. В эксперименте на животных не было выявлено такого влияния торасемида.

Способ применения и дозы

Взрослые. Лечение начинать с приема разовой дозы 2 мл препарата Торасемид, что эквивалентно 10 мг торасемида в сутки. Если эффект недостаточен, то разовую дозу можно увеличить до 4 мл препарата Торасемид, что эквивалентно 20 мг торасемида. Если эффект и в этом случае будет недостаточен, можно применить кратковременную (в течение не более 3 суток) терапию с введением суточной дозы 8 мл препарата Торасемид, что эквивалентно 40 мг торасемида.

Острый отек легких. Лечение нужно начинать с внутривенного введения разовой дозы 4 мл препарата Торасемид, что эквивалентно 20 мг торасемида. В зависимости от эффекта эту дозу можно повторить с интервалом в 30 минут. Запрещается превышать максимальную суточную дозу 20 мл препарата Торасемид, что эквивалентно 100 мг торасемида.

Раствор для инъекций вводить внутривенно, медленно. Запрещается вводить раствор внутриартериально! Вводить только чистый раствор. При длительном применении внутривенное введение надо как можно скорее заменить на пероральное применение, поскольку внутривенное применение торасемида не рекомендуется проводить более 7 суток.

Пациенты с печеночной недостаточностью. Лечение этой категории пациентов следует проводить с осторожностью, поскольку возможно повышение концентрации торасемида в плазме крови.

Пациенты пожилого возраста. Лечение этой категории пациентов не требует специального подбора дозы. Однако соответствующих исследований в отношении людей пожилого возраста в сравнении с молодыми пациентами не проводили.

Дети

Применять торасемид детям и подросткам не следует из-за отсутствия достаточного клинического опыта.

Передозировка

Типичная симптоматика неизвестна. Передозировка может вызвать сильный диурез, в том числе риск чрезмерной потери воды и электролитов, сонливость, аментивный синдром (одна из форм нарушения сознания), симптоматическую артериальную гипотензию, сердечно-сосудистую недостаточность и нарушения со стороны пищеварительной системы.

Лечение передозировки. Специфический антидот неизвестен. Симптомы интоксикации исчезают, как правило, при уменьшении дозировки и отмене лекарственного средства и при соответствующем замещении жидкости и электролитов (надо проводить контроль!). Торасемид не выводится из крови с помощью гемодиализа. Лечение в случае гиповолемии: замещение объема жидкости. Лечение в случае гипокалиемии: назначение препаратов калия. Лечение сердечно-сосудистой недостаточности: положение лежа пациента и, в случае необходимости, назначить симптоматическую терапию.

Анафилактический шок (неотложные меры). При первом появлении кожных реакций (таких как, например, крапивница или покраснение кожи), возбужденного состояния больного, головной боли, потливости, тошноты, цианоза следует проводить катетеризацию вены; пациента положить в горизонтальное положение, обеспечить свободное поступление воздуха, назначить кислород. В случае необходимости применять введение эпинефрина, растворов, замещающих объем жидкости, глюкокортикоидных гормонов.

Побочные реакции

Метаболизм/электролиты. Часто: усиление метаболического алкалоза. Спазмы мышц (особенно в начале лечения). Повышение концентрации мочевой кислоты и глюкозы в крови, а также холестерина и триглицеридов. Гипокалиемия при сопутствующей безкалиевой диете, при рвоте, диарее, после чрезмерного применения слабительных средств, а также у пациентов с хронической дисфункцией печени. В зависимости от дозировки и длительности лечения, возможны нарушения водно-электролитного баланса, например, гиповолемия, гипокалиемия и/или гипонатриемия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы. Очень редко: тромбэмболические осложнения, спутанность сознания, артериальная гипотензия, а также расстройства кровообращения и сердечной деятельности, в том числе ишемия сердца и мозга, что может привести, например, к аритмии, стенокардии, острого инфаркта миокарда, синкопе из-за возможной гемоконцентрации.

Со стороны пищеварительной системы. Часто: множественные расстройства пищеварительной системы (особенно в начале лечения), в том числе отсутствие

аппетита, метеоризм, боль в желудке, тошнота, рвота, диарее, запор. Очень редко: панкреатит.

Со стороны почек и мочевыводящих путей. Иногда: повышение концентрации креатинина и мочевины в крови, позыв к мочеиспусканию. Когда происходит значительная потеря воды и электролитов, вызванная избыточным образованием мочи, особенно в начале лечения и у пациентов пожилого возраста, может наблюдаться снижение артериального давления, головная боль, астения и сонливость.

У пациентов с расстройствами мочеиспускания (например, с гипертрофией простаты) повышенное образование мочи может привести к ее задержке и чрезмерного растяжения мочевого пузыря.

Со стороны печени. Часто: повышение концентрации некоторых печеночных ферментов (гамма-глутамил-транспептидазы) в крови.

Со стороны иммунной системы. Очень редко: аллергические реакции, включая зуд, экзантему, фотосенсибилизацию, тяжелые кожные реакции. После внутривенного применения могут наблюдаться острые, потенциально опасные для жизни реакции гиперчувствительности (анафилактический шок).

Со стороны системы крови и кроветворной системы. Очень редко: снижение количества тромбоцитов, эритроцитов и/или лейкоцитов как результат гемоконцентрации.

Общие проявления и реакции в месте введения препарата. Часто: головная боль, головокружение, повышенная утомляемость, общая слабость (особенно в начале лечения). Иногда: сухость во рту, неприятные ощущения в конечностях (парестезия). Очень редко: нарушения зрения, звон в ушах, потеря слуха. Частота неизвестна: местные реакции после инъекций.

Срок годности

2 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Несовместимость. Препарат Торасемид нельзя смешивать с другими лекарственными средствами для проведения внутривенных инъекций и/или инфузий.

Упаковка

По 4 мл в ампуле, по 5 ампул в блистере, по 1 блистеру в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Частное акционерное общество «Лекхим-Харьков».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 61115, Харьковская обл., город Харьков, улица Северина Потоцкого, дом 36

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).