

Состав

действующее вещество: spironolactone;

1 таблетка содержит спиронолактона 25 мг;

вспомогательные вещества: крахмал картофельный, лактоза моногидрат, повидон, кальция стеарат.

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства: таблетки плоскоцилиндрической формы с фаской, белого или белого с кремоватым оттенком цвета.

Фармакотерапевтическая группа

Калийсберегающие диуретики. Антагонисты альдостерона. Спиронолактон. Код АТХ C03D A01.

Фармакодинамика

Действующее вещество лекарственного средства – спиронолактон – конкурентный антагонист альдостерона, влияющий на дистальные каналы почек. Вследствие блокады альдостерона подавляет задержку воды и ионов Na^+ и способствует удержанию ионов K^+ , что не только повышает экскрецию ионов Na^+ и Cl^- и снижает экскрецию ионов K^+ с мочой, но и снижает экскрецию ионов H^+ . В результате этого мочегонный эффект имеет также гипотензивное действие.

Фармакокинетика

После приема внутрь лекарственное средство быстро и полностью абсорбируется в пищеварительном тракте. Биодоступность составляет 92–99 %, и она немного возрастает при приеме с пищей.

Максимальная концентрация спиронолактона в сыворотке крови наблюдается через 2,6 часа и составляет 80 нг/мл. Связывание с белками плазмы крови составляет около 90 %. Период полувыведения составляет 1,3 часа.

Спиронолактон метаболизируется в печени. Его активными метаболитами являются 7 α -тиометилспиронолактон и канренон. Антиальдостероновое действие определяет канренон, составляющий примерно 50 % всех метаболитов спиронолактона. Показатели пиковой концентрации в плазме крови и времени ее достижения: для 7 α -тиометилспиронолактона – 391 нг/мл и 3,2 часа, для

канренона – 181 нг/мл и 4,3 часа. Период полувыведения составляет 13,8 часа и 16,5 часа соответственно.

Спинонолактон и его метаболиты проникают в плаценту и в грудное молоко.

Выделяется из организма в виде метаболитов преимущественно путем почечной экскреции, малая часть экскретируется с калом. Для спинонолактона характерен кумулятивный эффект.

Показания

1. Первичный гиперальдостеронизм.
2. Застойная сердечная недостаточность при неэффективности или непереносимости других диуретиков или при необходимости повышения их эффективности.
3. Эссенциальная артериальная гипертензия, главным образом при гипокалиемии, обычно в комбинации с другими антигипертензивными лекарственными средствами.
4. Цирроз печени, сопровождающийся отеками и/или асцитом.
5. Отеки, обусловленные нефротическим синдромом.
6. Гипокалиемия – в случае невозможности применения иной терапии.
7. Профилактика гипокалиемии для пациентов, получающих сердечные гликозиды, в случае, когда другие способы терапии рассматриваются как нецелесообразные или неподходящие.

Противопоказания

1. Повышенная чувствительность к действующему веществу или к другим компонентам лекарственного средства.
2. Острая почечная недостаточность, выраженное нарушение азотовыделительной функции почек (скорость клубочковой фильтрации < 10 мл/мин), анурия.
3. Гиперкалиемия, гипонатриемия.
4. Болезнь Аддисона.
5. Одновременное применение с калийсберегающими диуретиками и лекарственными средствами калия из-за возможности развития гиперкалиемии.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

При одновременном применении спинонолактона с другими лекарственными средствами возможно:

- с антигипертензивными средствами (особенно с ганглиоблокаторами, нитратом, нитроглицеролом) – чрезмерное снижение артериального давления; при одновременном применении следует уменьшить дозу антигипертензивных средств с последующей ее коррекцией в случае необходимости. Поскольку ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента (АПФ) снижают выработку альдостерона, не следует применять лекарственные средства данной группы совместно со спиронолактоном на постоянной основе, особенно пациентам с нарушением функции почек;
- с аммоний хлоридом, холестирамином – повышение риска развития гиперкалиемии и гиперхлоремического метаболического ацидоза;
- с калийсберегающими диуретиками, препаратами калия, ингибиторами АПФ, блокаторами рецепторов ангиотензина II, блокаторами альдостероновых рецепторов, антихолинэстеразными средствами, такролимусом, циклоспорином – увеличение риска развития гиперкалиемии; одновременное применение с калийсберегающими диуретиками и препаратами калия противопоказано из-за возможности развития гиперкалиемии;
- с другими диуретиками – усиление диуретического эффекта;
- с нестероидными противовоспалительными средствами – повышение риска развития гиперкалиемии и почечной недостаточности с сопутствующим снижением диуретического, натрийуретического и антигипертензивного действия спиронолактона; при одновременном применении с ацетилсалициловой кислотой также подавляется синтез простагландинов, с аспирином – усиливается его метаболизм в печени;
- с глюкокортикостероидами, адренокортикотропным гормоном (АКТГ) – усиление диуретического, натрийуретического действия спиронолактона и парадоксальное усиление экскреции калия;
- с α - и β -адреномimetиками, карбеноксолом – ослабление действия спиронолактона;
- с антипсихотическими средствами, трициклическими антидепрессантами – усиление действия спиронолактона;
- с барбитуратами, наркотическими лекарственными средствами, этанолом – возникновение ортостатической гипотензии;
- с терфенадином – увеличение риска развития желудочковой аритмии вследствие гипокалиемии и дисбаланса других электролитов;
- с карбамазепином – увеличение риска развития гипонатриемии;
- с дигоксином – повышение риска развития гликозидной интоксикации вследствие удлинения его периода полувыведения;
- с препаратами лития – повышение риска развития интоксикации вследствие снижения почечного клиренса лития; не следует одновременно применять эти лекарственные средства;

- с непрямыми антикоагулянтами (производные кумарина), митотаном, прессорными аминами (эпинефрин), сердечными гликозидами – ослабление действия последних;
- с гепарином, низкомолекулярным гепарином – возникновение тяжелой гиперкалиемии;
- с трипторелином, бусерелином, гонадорелином – усиление действия последних;
- с комбинацией триметоприм/сульфаметоксазол (антибиотик, так называемый ко-тримоксазол) – возникновение клинически значимой гиперкалиемии;
- с иммунодепрессантами, циклоспорином и такролимусом – повышение риска развития гиперкалиемии, вызванной спиронолактоном;
- с колестирамином, аммония хлоридом – повышение риска развития гиперкалиемии и гиперхлоремического метаболического ацидоза;
- с нитроглицерином, другими нитратами или вазодилататорами – усиление антигипертензивного эффекта спиронолактона;
- с прессорными аминами (норэпинефрин) – снижение сосудистых реакций на норэпинефрин. По этой причине следует соблюдать осторожность при проведении местной или общей анестезии у пациентов, принимающих спиронолактон;
- с антипирином – ускорение метаболизма антипирина;
- с карбеноксолоном – возникновение задержки натрия в организме и, как следствие, снижение эффективности спиронолактона.

Следует избегать одновременного применения карбеноксолона и спиронолактона.

Спиронолактон может усиливать действие аналогов ГнРГ (гонадотропин-рилизинг-гормона): трипторелина, бусерелина, гонадорелина.

Особенности применения

Применение лекарственного средства, особенно больным с нарушением функции почек, может вызвать транзиторное повышение содержания азота мочевины в плазме крови и гиперкалиемию, что может привести к развитию нарушений сердечного ритма и обратимого гиперхлоремического метаболического ацидоза. Лекарственное средство применять с осторожностью больным с нарушением функции почек, печени и пациентам пожилого возраста. Следует периодически определять уровень электролитов в плазме крови и показатели функции почек. В случае развития гиперкалиемии лечение спиронолактоном следует прекратить.

Лекарственное средство применять с осторожностью больным, имеющим заболевания, которые могут вызвать развитие ацидоза и/или гиперкалиемии.

Одновременное применение спиронолактона с лекарственными средствами, вызывающими гиперкалиемию (например, другие калийсберегающие диуретики, ингибиторы АПФ, антагонисты рецепторов ангиотензина II, блокаторы альдостерона, гепарин, низкомолекулярный гепарин, препараты калия, богатая калием диета, употребление заменителей соли, содержащих калий), может привести к развитию тяжелой гиперкалиемии.

Гиперкалиемия может привести к летальному исходу. Критически важно контролировать и корректировать содержание калия у пациентов с тяжелой формой сердечной недостаточности, получающих спиронолактон. Не следует применять лекарственное средство вместе с другими калийсберегающими диуретиками. Пациентам с уровнем калия в сыворотке выше 3,5 мэкв/л противопоказано применение препаратов калия. Рекомендуемая частота определение уровня содержания калия и креатинина – через неделю после начала приема или увеличение дозы спиронолактона, ежемесячно в течение первых 3 месяцев, затем ежеквартально в течение года, после чего – каждые 6 месяцев. При содержании калия в сыворотке крови более 5 мэкв/л или креатинина 4 мг/дл следует временно или полностью прекратить прием спиронолактона.

Лекарственное средство применять с осторожностью больным сахарным диабетом, особенно при наличии диабетической нефропатии.

Терапия спиронолактоном может нарушить процесс определения концентрации кортизола, эпинефрина и дигоксина (радиоиммунологическими методами).

Следует избегать длительного необоснованного применения лекарственного средства, поскольку, по данным исследований, длительное применение спиронолактона животным в максимальных дозах способствовало развитию карциномы и миелоидной лейкемии.

Во время применения лекарственного средства запрещено употреблять спиртные напитки.

СПИРОНОЛАКТОН-ДАРНИЦА содержит лактозу, поэтому пациентам с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, недостаточностью лактазы или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции нельзя применять лекарственное средство.

Пациентам с порфирией, спиронолактон следует применять с осторожностью, поскольку многие лекарственные средства провоцируют обострение порфирии.

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

Во время начального периода приема лекарственного средства, продолжительность которого индивидуальная, противопоказано управление автотранспортом или другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Лекарственное средство противопоказано в период беременности или кормления грудью.

Способ применения и дозы

Лекарственное средство применять внутрь взрослым и детям. Суточную дозу лекарственного средства следует применять в 1 или в 2 приема после еды.

Применение суточной дозы в 1 прием или первый прием лекарственного средства при двукратном применении рекомендуется утром.

Продолжительность курса лечения индивидуальная, в некоторых случаях может достигать нескольких лет, но при этом всегда необходимо применять лекарственное средство в наименьшей эффективной суточной дозе при условии постоянного контроля электролитного состава сыворотки крови и показателей функции почек.

Взрослым.

Первичный гиперальдостеронизм.

При подготовке к операции лекарственное средство применять в дозе 100–400

мг в сутки.

В случае невозможности оперативного лечения спиронолактон можно применять длительно как поддерживающую терапию в наименьшей эффективной дозе, которая определяется индивидуально. В таком случае каждые 14 дней начальную дозу допустимо снижать до достижения минимальной эффективной дозы. При длительном лечении рекомендуется применять лекарственное средство в комбинации с другими диуретиками для уменьшения побочных эффектов.

Застойная сердечная недостаточность, отеки, обусловленные нефротическим синдромом.

Лекарственное средство применять в начальной дозе 100 мг в сутки за 1 или 2 приема. Суточная доза также может колебаться в пределах от 25 до 200 мг. При назначении более высоких доз лекарственное средство можно применять в комбинации с другими диуретиками, действующими в более проксимальных отделах почечных канальцев. В этом случае следует провести коррекцию дозы спиронолактона.

Эссенциальная артериальная гипертензия.

Лекарственное средство применять в начальной дозе 50–100 мг в сутки за 1 или 2 приема в комбинации с другими антигипертензивными лекарственными средствами. Лечение следует продолжать не менее 2 недель, поскольку к концу этого периода достигается максимальный антигипертензивный эффект. Дальнейшая коррекция дозы индивидуальная в зависимости от достигнутого эффекта.

Цирроз печени, сопровождающийся отеками или асцитом.

Если соотношение Na^+/K^+ в моче более 1, лекарственное средство применять в начальной дозе 100 мг в сутки. Максимальная суточная доза – 100 мг/сутки. Если это соотношение меньше 1, лекарственное средство применять в дозе 200 мг в сутки, при этом максимальная суточная доза – 400 мг/сутки.

Гипокалиемия.

Лекарственное средство применять в дозе 25–100 мг в сутки пациентам, которым недостаточно пищевых добавок с калием или других методов калийзаместительной терапии.

Детям.

Лекарственное средство применять в дозе 1–3 мг/кг массы тела в сутки за 1 или 2 приема. Для поддерживающей терапии в комбинации с другими диуретиками суточная доза составляет 1–2 мг/кг массы тела.

При необходимости применения лекарственного средства детям до 3 лет таблетку следует измельчить, растворить и дать выпить ребенку в виде суспензии.

Пациентам пожилого возраста.

Лекарственное средство рекомендуется применять в более низких дозах с последующим постепенным увеличением до достижения максимального эффекта. Следует принимать во внимание, что у данной категории пациентов имеют место печеночные и почечные нарушения, которые могут влиять на метаболизм и выведение лекарственного средства.

Дети

Лекарственное средство применяют в педиатрической практике по назначению врача.

Передозировка

Симптомы: сонливость/усталость, спутанность сознания, электролитные нарушения.

Лечение: симптоматическая терапия. Следует поддерживать водно-электролитный и кислотно-щелочной балансы: применять диуретики, выводящие калий, парентерально вводить глюкозу с инсулином, в сложных случаях – провести гемодиализ. Специфического антидота не существует.

Побочные реакции

Со стороны сердечно-сосудистой системы: артериальная гипотензия, аритмия (у пациентов с почечной недостаточностью и тех, кто получает препараты калия), васкулит.

Со стороны системы крови и лимфатической системы: лейкопения (в том числе агранулоцитоз), тромбоцитопения, мегалобластная или апластическая анемия, эозинофилия.

Со стороны нервной системы и психики: головная боль, сонливость,

головокружение, атаксия, паралич, параплегия, летаргия, заторможенность, спутанность сознания.

Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: изменение тембра голоса.

Со стороны пищеварительного тракта: тошнота, рвота, снижение аппетита, боль в животе и желудке, диарея, запор, кишечные колики, гастрит, язва желудка и двенадцатиперстной кишки, желудочное кровотечение.

Со стороны гепатобилиарной системы: гепатит, нарушение функции печени.

Со стороны мочевыделительной системы: острая почечная недостаточность.

Со стороны опорно-двигательного аппарата и соединительной ткани: остеомалация, спазм мышц, судороги мышц нижних конечностей.

Со стороны обмена веществ и метаболизма: гиперкалиемия, гипонатриемия, гиперкреатининемия, повышение уровня мочевины в плазме крови, гиперурикемия, порфирия, метаболический гиперхлоремический ацидоз или алкалоз, дегидратация.

Со стороны эндокринной системы: гирсутизм.

Со стороны репродуктивной системы и молочных желез: снижение либидо, эректильная дисфункция, гинекомастия, нарушения менструального цикла, дисменорея, аменорея, метроррагия в период менопаузы, набухание и боль молочных желез у женщин, бесплодие (при использовании высоких доз – 450 мг в сутки), доброкачественные опухоли молочных желез.

Со стороны иммунной системы, кожи и подкожной клетчатки: реакции гиперчувствительности, в том числе: высыпания, зуд, крапивница, медикаментозная лихорадка; гипертрихоз, алоpecia, волчаночноподобный синдром, гиперемия, кольцевидная эритема, экзема, синдром Стивенса–Джонсона.

Общие: астения, повышенная утомляемость.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке; по 3 контурные ячейковые упаковки в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ЧАО «Фармацевтическая фирма «Дарница».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 02093, г. Киев, ул. Бориспольская, 13.

Источник инструкции

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