

Состав

действующее вещество: spironolactone;

1 таблетка содержит: спиронолактона 100 мг;

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

Лекарственная форма

Таблетки.

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

Фармакотерапевтическая группа

Калийсберегающие диуретики. Код АТХ C03D A01.

Фармакодинамика

Действующее вещество препарата – 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

Абсорбция спиронолактона из желудочно-кишечного тракта быстрая и полная. Он в значительной степени связывается с белками плазмы крови (приблизительно 90 %). Спиронолактон подвергается быстрому метаболизму. Его активными метаболитами являются 7 α -тиометилспиронолактон и канренон. Несмотря на то, что период полувыведения самого спиронолактона короткий (1,3 часа), периоды полувыведения его активных метаболитов длительные (от 2,8 до 11,2 часа). Метаболиты экскретируются главным образом с мочой; малая часть экскретируется с калом. Спиронолактон и его метаболиты проникают через плаценту и в грудное молоко.

После применения 100 мг спиронолактона в день на протяжении 15 дней здоровыми добровольцами, показатели времени до достижения пиковой концентрации в плазме крови (t_{max}), пиковой концентрации в плазме крови (C_{max}) и периода полувыведения ($t_{1/2}$) спиронолактона составили: 2,6 часа, 80

нг/мл и примерно 1,4 часа соответственно. Для 7 α -тиометилспиронолактона и канренона эти показатели составили соответственно 3,2 и 4,3 часа; 391 нг/мл и 181 нг/мл; 13,8 и 16,5 часа.

Влияние на почки единичной дозы спиронолактона достигает пика через 7 часов и сохраняется минимум в течение 24 часов.

Показания

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

Противопоказания

1. Гиперчувствительность к действующему веществу или к другим компонентам препарата.
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 препаратами калия – из-за возможности развития гиперкалиемии.
6. Беременность и период кормления грудью.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Одновременное применение препарата с другими лекарственными средствами может вызывать:

- с антигипертензивными средствами (особенно ганглиоблокаторы, нифедипин, нимодипин) – чрезмерное снижение артериального давления; при одновременном применении следует уменьшить дозу антигипертензивных средств с последующей ее коррекцией в случае необходимости;
- с аммония хлоридом, холестирамином – повышение риска развития гиперкалиемии и гиперхлоремического метаболического ацидоза;
- с калийсберегающими диуретиками, препаратами калия, ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента (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 антипирином – усиливается его метаболизм в печени;
- с глюкокортикостероидами, адренокортикотропным гормоном (АКТГ) – усиление диуретического, натрийуретического действия спиронолактона и парадоксальное усиление экскреции калия;
- с α - и β -адреномиметиками, карбеноксолоном – ослабление действия спиронолактона;
- с антипсихотическими средствами, трициклическими антидепрессантами – усиление действия спиронолактона;
- с барбитуратами, наркотическими препаратами, этанолом – ортостатическую гипотензию;
- 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 препараты;
- с непрямыми антикоагулянтами (производные кумарина), митотаном, прессорными аминами (эпинефрин), сердечными гликозидами – ослабление действия последних;

- с трипторелином, бусерелином, гонадорелином – усиление действия последних.

Особенности применения

Применение препарата, 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. Препарат нужно 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 препаратом следует прекратить.

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

Препарат следует 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 препарата, поскольку, по данным исследований, длительное применение спиронолактона животным в максимальных дозах способствовало развитию карциномы и миелоидной лейкемии.

Во время применения препарата не следует употреблять спиртные напитки.

Препарат содержит лактозу, поэтому пациентам с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, недостаточностью лактазы или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции нельзя применять препарат.

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

В начальный период лечения, продолжительность которого индивидуальна, противопоказано управлять автотранспортом или другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Препарат противопоказан в период беременности или кормления грудью. При необходимости применения препарата следует прекратить кормление грудью.

Способ применения и дозы

Препарат применяют внутрь взрослым и детям.

Суточную дозу препарата принимают в 1 или 2 приема после еды. Применение суточной дозы в 1 прием или первый прием препарата при двукратном применении рекомендуется утром.

Продолжительность курса лечения индивидуальна, в некоторых случаях она может достигать нескольких лет, при этом необходимо применять препарат в наименьшей эффективной суточной дозе при условии постоянного контроля электролитного состава сыворотки крови и показателей функции почек.

Взрослым.

Первичный гиперальдостеронизм.

При подготовке к операции препарат применять в дозе 100 – 400 мг в сутки. В случае невозможности оперативного лечения препарат 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 необходимости применения меньших доз препарата следует применять таблетки Спиронолактон-Дарница в соответствующей дозе. При длительном лечении рекомендуется применять препарат в комбинации с другими диуретиками для уменьшения побочных эффектов.

Застойная сердечная недостаточность, отеки, обусловленные нефротическим синдромом.

Препарат 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 препарат можно применять в комбинации с другими диуретиками, которые действуют в более проксимальных отделах почечных канальцев. В этом случае следует провести коррекцию дозы спиронолактона.

Эссенциальная артериальная гипертензия.

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

Цирроз печени, сопровождающийся отеками и/или асцитом.

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

Гипокалиемия.

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

Детям.

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

Пациентам пожилого возраста.

Препарат рекомендуется применять в более низких дозах с последующим постепенным увеличением до достижения максимального эффекта. Следует принимать во внимание, что у этой категории больных имеют место печеночные и почечные нарушения, которые могут влиять на метаболизм и выведение препарата.

Дети

Препарат 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: применением диуретиков, выводящих калий, парентеральным введением глюкозы с инсулином, в сложных случаях – проведением гемодиализа. 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, гиперкреатинемия, 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, алопеция, волчаночноподобный синдром, гиперемия, кольцевидная эритема, экзема, синдром Стивенса – Джонсона.

Общие: астения, повышенная утомляемость.

Срок годности

2 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](#).