

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Спиронолактон

Регистрационный номер:

Торговое название: Спиронолактон

Международное непатентованное название: спиронолактон

Лекарственная форма: таблетки

Состав на 1 таблетку: *Активное вещество:* спиронолактон - 25 мг;

Вспомогательные вещества: крахмал картофельный – 13,2 мг, коповидон (коллидон VA-64) – 3,7 мг, кальция стеарат (кальций стеариновокислый) – 1,2 мг, тальк – 3,6 мг, кросповидон (коллидон CL-M) – 5,4 мг, целлюлоза микрокристаллическая - до 120 мг.

Описание: Таблетки от белого до белого с кремовым оттенком цвета, плоскоцилиндрической формы с фаской, почти без запаха или со специфическим запахом.

Фармакотерапевтическая группа: Диуретическое калийсберегающее средство.

Код АТХ [C03DA01]

Фармакологические свойства

Фармакодинамика:

Калийсберегающий диуретик, действие которого обусловлено антагонизмом с альдостероном (минералокортикостероидным гормоном 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 альдостерон-зависимом 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:

Абсорбция - полная. Биодоступность - 100%. Максимальная концентрация при ежедневном приеме 100 мг в течение 15 дней - 80 нг/мл, время, необходимое для достижения мак-

симальной концентрации после очередного утреннего приема - 2.6 ч.

После всасывания метаболизируется в печени до нескольких активных серосодержащих метаболитов, в том числе канренона, максимальная концентрация которого определяется через 2-4 ч. Связь с белками плазмы - 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. Период полувыведения - 13-24 ч.

Выводится почками (50% - в виде метаболитов, 10% - в неизменном виде), частично - через кишечник. Выведение канренона (главным образом почками) двухфазное, период полувыведения в первой фазе - 3-2 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).

Показания к применению:

- эссенциальная гипертензия (в составе комбинированной терапии);
- отечный синдром при хронической сердечной недостаточности (может применяться в виде монотерапии и в комбинации со стандартной терапией);
- состояния, при которых может обнаруживаться вторичный гиперальдостеронизм, включая цирроз печени, сопровождающийся асцитом и/или отеками, нефротический синдром, а также другие состояния, сопровождающиеся отеками;
- гипокалиемия/гипомагниемия (в качестве вспомогательного средства для ее профилактики во время лечения диуретиками при невозможности применения других способов коррекции уровня калия);
- первичный гиперальдостеронизм (синдром Конна) - для короткого предоперационного курса лечения;
- для установления диагноза первичного гиперальдостеронизма.

Противопоказания:

- болезнь Аддисона;
- гиперкалиемия;
- гипонатриемия;
- тяжелая хроническая почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 10 мл/мин);
- анурия;
- непереносимость лактазы, дефицит лактозы, синдром глюкозо-галактозной мальабсорбции;
- беременность;

- период лактации (грудное вскармливание);
- детский возраст до 3 лет;
- повышенная чувствительность к какому-либо из компонентов препарата.

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, хирургические вмешательства, гинекомастия и одновременный прием лекарственных препаратов, вызывающих гинекомастию, проведение местной и общей анестезии, пожилой возраст.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания:

Применение препарата в период беременности и лактации противопоказано.

Способ применения и дозы:

Внутрь.

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 (максимально 400 мг) за 2-3 приема, при улучшении состояния дозу постепенно снижают до 25 мг/сут.

При *гипокалиемии и гипомагниемии, вызванных терапией диуретиками* препарат назначают в дозе 25-100 мг/сут однократно или в несколько приемов. Максимальная суточная доза 400 мг, если пероральные препараты калия 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 в несколько приемов в день. При увеличении концентрации калия в крови во время приема 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.

После того как диагноз гиперальдостеронизма установлен с помощью более точных диагностических методов, в качестве *короткого курса предоперационной терапии первичного гиперальдостеронизма* препарат следует принимать в суточной дозе 100 – 400 мг, разделив на 1 – 4 приема в течении всего периода подготовки к хирургической операции. Если операция не показана, то препарат применяется для проведения длительной поддерживающей терапии, при этом используется наименьшая эффективная доза, которая подбирается индивидуально для каждого пациента.

При лечении *отеков на фоне нефротического синдрома* суточная доза для взрослых составляет 100-200 мг. Не выявлено влияния спиронолактона на основной патологический процесс, и потому применение данного препарата рекомендуется только в случаях, когда другие виды терапии оказываются неэффективны.

При *отечном синдроме на фоне хронической сердечной недостаточности* препарат назначают ежедневно в течение 5 дней по 100-200 мг/сут в 2-3 приема, в комбинации с «петлевым» или тиазидным диуретиком. В зависимости от эффекта суточную дозу уменьшают до 25 мг. Поддерживающая доза подбирается индивидуально. Максимальная суточная доза составляет 200 мг.

При *отеках на фоне цирроза печени* суточная доза для взрослых обычно составляет 100 мг, если соотношение ионов натрия и калия (Na^+/K^+) в моче превышает 1,0. Если соотношение меньше 1,0, то суточная доза 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 приема. Через 5 дней проводят коррекцию дозы и при необходимости ее увеличивают в 3 раза по сравнению с первоначальной.

Побочное действие:

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

Со стороны нервной системы: головокружение; сонливость, летаргия, головная боль, заторможенность, атаксия, мышечные спазмы, спутанность сознания.

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

Со стороны мочевыделительной системы: повышение концентрации мочевины, гиперкреатининемия, гиперурикемия, острая почечная недостаточность.

Со стороны обмена веществ: нарушение водно-электролитного обмена и кислотно-основного состояния (метаболический гипохлоремический ацидоз или алкалоз).

Со стороны органов кроветворения: мегалобластоз, агранулоцитоз, тромбоцитопения.

Аллергические реакции: крапивница, макулопапулезная и эритематозная сыпь, лекарственная лихорадка, зуд.

Дерматологические реакции: алопеция.

Прочие: судороги икроножных мышц, мышечный спазм.

Передозировка:

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

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

При гиперкалиемии необходимо нормализовать водно-электролитный обмен с помощью калийвыводящих диуретиков, быстрого парентерального введения раствора декстрозы (5-20 % растворы) с инсулином из расчета 0.25-0.5 ЕД на 1 г декстрозы; при необходимости возможно повторное введение декстрозы. В тяжелых случаях проводят гемодиализ.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами:

Снижает эффект антикоагулянтов, непрямых антикоагулянтов (гепарина, производных кумарина, индандиона) и токсичность сердечных гликозидов (так как нормализация уровня калия в крови препятствует развитию токсичности).

Усиливает метаболизм феназола (антипирина).

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

Увеличивает период полувыведения дигоксина, поэтому возможна интоксикация дигоксином.

Усиливает токсическое действие лития из-за снижения клиренса.

Ускоряет метаболизм и выведение карбенексолона.

Карбенексолон способствует задержке натрия спиронолактоном.

Глюкокортикостероидные препараты и диуретики (производные бензотиазина, фуросимид, этакриновая кислота) усиливают и ускоряют диуретический и натрийуретический

эффекты.

Усиливает действие диуретических и гипотензивных лекарственных средств.

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

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

Возрастает риск развития гиперкалиемии при приеме с препаратами калия, калиевыми добавками и калийсберегающими диуретиками, ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента (ацидоз), антагонистами ангиотензина II, блокаторами альдостерона, индометацином, циклоспорином.

Салицилаты, индометацин снижают диуретический эффект.

Хлорид аммония, колестирамин способствуют развитию гиперкалиемического метаболического ацидоза.

Флудрокортизон вызывает парадоксальное усиление канальцевой секреции калия.

Снижает эффект митотана.

Усиливает эффект трипторелина, бузерелина, ганадорелина.

Особые указания:

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

При болезнях почек и печени, а также в пожилом возрасте, необходим регулярный контроль 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 уровень электролитов в крови.

Следует избегать пищи, богатой калием.

Во время лечения употребление алкоголя противопоказано.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и 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 20 таблеток в банки полимерные.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку.

Каждую банку или 1, 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Срок годности:

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия хранения:

В сухом, защищенном от света месте, при температуре не более 25 °С.

Хранить в местах, недоступных для детей.

Условия отпуска:

Отпускают по рецепту.

Производитель/организация, принимающая претензии:

Открытое акционерное общество «Акционерное Курганское общество медицинских препаратов и изделий «Синтез» (ОАО «Синтез»)

640008, Россия, г. Курган, проспект Конституции, 7.

Тел./факс. (3522) 48-16-89

e/mail: real@kurgansintez.ru

Интернет-сайт: <http://www.kurgansintez.ru>

Представитель фирмы



В.И.Петухов