

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ
ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
Спиринолактон Медисорб

Перед применением препарата полностью прочитайте инструкцию. Храните инструкцию вместе с препаратом до окончания приема.

Регистрационный номер: ЛП-004654

Торговое наименование препарата:

Спиринолактон Медисорб

Международное непатентованное наименование: спиринолактон

Лекарственная форма: таблетки

Состав на 1 таблетку:

действующее вещество: спиринолактон 25 мг;
вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (сахар молочный); крахмал картофельный; гипролозола (гидроксипропилцеллюлоза); тальк; повидон (поливинилпирролидон); кальция стеарат.

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

Фармакотерапевтическая группа: диуретическое калийсберегающее средство

Код АТХ: С03ДА01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Спиринолактон является калийсберегающим диуретиком, действие которого обусловлено антагонизмом альдостерона (минералокортикостероидный гормон коры надпочечников). Альдостерон способствует обратному всасыванию ионов натрия в почечных канальцах и усиливает выведение ионов калия. Спиринолактон – 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

Всасывание и распределение

При приеме внутрь быстро и полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта (ЖКТ). Биодоступность – 100%. Связывается с белками плазмы крови примерно на 98% (канренон – 90%). Максимальная концентрация (С_{max}) канренона в плазме крови достигается через 2-4 часа после приема. После ежедневного приема 100 мг в течение 15 дней С_{max} достигает 80 нг/мл, время достижения после очередного утреннего приема – 2-6 ч. Объем распределения – 0,05 л/кг.

Метаболизм

Спиринолактон метаболизируется в печени, превращаясь в активные метаболиты: метаболит, содержащий серу (80%), и частично канренон (20%). Спиринолактон плохо проникает в органы и ткани, но при этом сам и его метаболиты проникают через плацентарный барьер, а канренон – в грудное молоко.

Выведение

Выводится почками (50% – в виде метаболитов, 10% – в неизменном виде) и частично через кишечник. Период полувыведения (Т_{1/2}) спиринолактона 13-24 ч, активных метаболитов – до 15 ч. Выведение канренона (главным образом почками) двухфазное, Т_{1/2} в первой фазе – 2-3 ч, во второй – 12-26 ч.

Фармакокинетика у отдельных групп пациентов

При циррозе печени и сердечной недостаточности продолжительность Т_{1/2} увеличивается без признаков кумуляции, вероятность которой выше при хронической почечной недостаточности и гиперкалиемии.

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 отеками, нефротический синдром, а также другие состояния, сопровождающиеся отёками;
- гипокалиемия/гипомагниемия (в качестве вспомогательного средства для её профилактики во время лечения диуретиками и при невозможности применения других способов коррекции содержания калия);
- первичный гиперальдостеронизм (синдром Конна) – для короткого предоперационного курса лечения;
- для установления диагноза первичного гиперальдостеронизма;
- тяжёлая хроническая сердечная недостаточность (III-IV функционального класса по классификации NYHA) на фоне стандартной терапии.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к спиринолактону или какому-либо другому компоненту препарата; болезнь Аддисона; гиперкалиемия;

гипонатриемия; тяжёлая почечная недостаточность (клиренс креатинина на менее 10 мл/мин); анурия; одновременное применение эплеренона и других калийсберегающих диуретиков, препаратов калия; детский возраст до 3 лет (твёрдая лекарственная форма); беременность; период грудного вскармливания; непереносимость лактозы, дефицит лактазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

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 во время 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 корректировку дозы.

Идиопатический гиперальдостеронизм:

Назначают 100-400 мг/сут.

Выраженный гиперальдостеронизм и гипокалиемии:

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

При гипокалиемии и/или гипомагниемии, вызванных терапевтической 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.

Диагностика и лечение 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 плазме крови во время приёма препарата и снижении после отмены его можно предполагать наличие первичного гиперальдостеронизма.

В качестве диагностического средства 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, препарат следует принимать по 100-400 мг/сут, разделив на 1-4 приёма в сутки в течение всего периода подготовки к хирургической операции. Если операция не показана, то препарат 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/сут. Не выявлено влияния спиринолактона на основной патологический процесс, и поэтому применение данного препарата рекомендуется только в тех случаях, когда другие виды терапии оказываются неэффективными.

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 комбинации с «петлевым» или

тиазидным диуретиком.

В зависимости от эффекта (см. раздел «Фармакокинетика у отдельных групп пациентов»), суточную дозу уменьшают до 25 мг. Поддерживающая доза подбирается индивидуально. Максимальная доза составляет 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.

Отеки у детей:

Начальная доза у детей старше 3 лет 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.

Применения 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 функционального класса 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 можно увеличить до 50 мг 1 раз/сутки. Лечение проводят под контролем содержания калия и креатинина крови через одну неделю после начала терапии или увеличении дозы, затем ежемесячно в течение первых 3-х месяцев, затем ежеквартально в течение года, а затем каждые 6 месяцев.

Побочное действие

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: агранулоцитоз, тромбоцитопения, мегалобластоз; *Нарушения со стороны иммунной системы:* крапивница; *Эндокринные нарушения:* огрубение голоса, нарушения менструального цикла, дисменорея, аменорея, метроррагия в климактерическом периоде, гирсутизм; *Нарушения со стороны нервной системы:* атаксия, заторможенность, головокружение, головная боль, сонливость, летаргия, спутанность сознания; *Желудочно-кишечные нарушения:* тошнота, рвота, диарея, изъязвления и кровотечения из желудочно-кишечного тракта, гастрит, кишечная колика, боль в животе, запор; *Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей:* нарушение функции печени; *Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей:* гипертрихоз, кожный зуд, макулопапулезная и эритематозная кожная сыпь, токсический эпидермальный некролиз, синдром Стивенса-Джонсона; *Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани:* судороги икроножных мышц, мышечный спазм; *Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей:* острая почечная недостаточность; *Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез:* у мужчин – гинекомастия (вероятность развития зависит от дозы, длительности лечения и, обычно, носит обратимый характер и после отмены препарата исчезает, лишь в редких случаях грудная железа остается несколько увеличенной), у женщин – боли в области молочных желез, карцинома молочной железы (наличие связи с приемом препарата не установлена), сексуальная дисфункция; *Общие нарушения и реакции в месте введения:* лекарственная лихорадка, алоpecia; *Лабораторные и инструментальные данные:* гиперурикемия, гиперкреатининемия, повышение концентрации мочевины, нарушение водно-электролитного обмена (гиперкалиемия/гипонатриемия) и кислотно-основного состояния (метаболический гиперхлоремический ацидоз или алкалоз).

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях с целью обеспечения непрерывного мониторинга отношения пользы и риска лекарственного препарата.

Если у Вас возникли какие-либо нежелательные реакции, обратитесь к лечащему врачу, работнику аптеки или производителю. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях.

Передозировка

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

Лечение: промывание желудка, симптоматическое лечение дегидратации и артериальной гипотензии. При гиперкалиемии необходимо нормализовать водно-электролитный баланс 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 можно ввести повторно. В тяжёлых случаях проводят гемодиализ.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

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

Усиливает метаболизм феназона (антипирина).

Снижает чувствительность сосудов к *норэпинефрину* (требует соблюдения осторожности при проведении анестезии), увеличивает период полувыведения *дигоксина* – возможна интоксикация дигоксином. Усиливает токсическое действие *лития* из-за снижения его клиренса. Возможно усиливает действие *недеполяризующих миорелаксантов* (например, тубокурарина); 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 эффекты.

Усиливает действие *диуретических и гипотензивных лекарственных средств*.

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

Этанол, барбитураты, наркотические вещества усиливают риск ортостатической гипотензии. *Глюкокортикостероидные препараты* усиливают диуретический и натрийуретический эффект при гипоальбуминемии и/или гипонатриемии.

Возрастает риск развития гиперкалиемии при приёме с препаратами *калия, калиевыми добавками и калийсберегающими диуретиками, ингибиторами ангиотензинпревращающего фермента (АПФ) (ацидоз), антагонистами рецепторов к ангиотензину II, блокаторами альдостерона, индометацина, циклоспорина.*

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, бусерелина, гонадорелина.*

Особые указания

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

При нарушении функции почек и печени, а также в пожилом возрасте необходим регулярный контроль электролитов в плазме крови и функции почек.

Препарат затрудняет определение дигоксина, кортизола и адреналина в плазме 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 одновременном лечении НПВП следует контролировать функцию почек и содержание электролитов в плазме крови. Следует избегать употребления пищи, богатой калием.

Во время лечения употребление алкоголя противопоказано.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и другими механизмами

В начальный период лечения запрещается управлять транспортными средствами и заниматься другими потенциально опасными видами деятельности, требующими концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций. Длительность ограничений устанавливается в индивидуальном порядке.

Форма выпуска

Таблетки 25 мг

По 10 или 14 таблеток в контурную ячейковую упаковку.

По 20, 30, 50, 60 или 100 таблеток в банки полимерные с крышкой. Каждую банку или 1, 2, 3, 5, 10 контурных ячейковых упаковок по 10 таблеток, или 1, 2, 3, 4 контурных ячейковых упаковок по 14 таблеток вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

В сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте

Срок годности

3 года. Не применять препарат после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель

Акционерное общество «Медисорб»

Юридический адрес:

614113, Россия, г. Пермь, ул. Гальперина, 6

Адрес места осуществления производства:

614113, г. Пермь, ул. Причалная, д. 16

Организация,

принимаящая претензии от потребителей:

АО «Медисорб» 614113,

Россия, г. Пермь, ул. Гальперина, 6

Тел: (342) 259-41-41;

факс (342) 259-41-41.

E-mail: info@medisorb.ru

www.medisorb.ru

