Бритомар



Код АТХ:

- C03CA04

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Торасемид

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки пролонгированного действия белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "SN" на одной стороне.

	1 таб.
торасемид	5 мг

Вспомогательные вещества: камедь гуаровая - 3.4 мг, крахмал кукурузный - 30.77 мг, кремния диоксид коллоидный - 0.42 мг, магния стеарат - 0.25 мг, лактозы моногидрат - до 85 мг.

15 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Таблетки пролонгированного действия белого или почти белого цвета, круглые, двояковыпуклые, с гравировкой "SN" на одной стороне.

	1 таб.
торасемид	10 мг

Вспомогательные вещества: камедь гуаровая - 6.8 мг, крахмал кукурузный - 61.54 мг, кремния диоксид коллоидный - 0.85 мг, магния стеарат - 0.51 мг, лактозы моногидрат - до 170 мг.

15 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
15 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

"Петлевой" диуретик. Основной механизм действия препарата обусловлен обратимым связыванием торасемида с контранспортером натрия/хлора/калия, расположенным в апикальной мембране толстого сегмента восходящей петли Генле, в результате этого снижается или полностью ингибируется реабсорбция ионов натрия и уменьшается осмотическое давление внутриклеточной жидкости и реабсорбция воды.

Торасемид в меньшей степени, чем фуросемид, вызывает гипокалиемию, при этом он проявляет большую активность и его действие более продолжительно.

Диуретический эффект развивается примерно в течение часа после приема препарата внутрь, достигая максимума через 3-6 ч, и продолжается от 8 до 10 ч.

Снижает систолическое и диастолическое АД в положении лежа и стоя.

Фармакокинетика

Препарат Бритомар таблетки пролонгированного действия обеспечивает постепенное высвобождение торасемида, снижая колебания его концентрации в крови, по сравнению с препаратами торасемида в лекарственной форме таблетки с обычным высвобождением.

Всасывание

После приема нескольких доз препарата относительная биодоступность пролонгированной формы, по сравнению с обычной лекарственной формой, составляет около 102%. Активное вещество всасывается из ЖКТ с ограниченным эффектом "первого прохождения" через печень. C_{max} в плазме крови достигается в течение 1.5 ч после приема внутрь. Прием пищи не оказывает значительного влияния на абсорбцию препарата. Нарушение функции почек и/или печени не влияют на всасывание препарата.

Распределение

Более 99% торасемида связывается с белками плазмы крови.

V_d у здоровых добровольцев и у пациентов с легкой и умеренной почечной недостаточностью или хронической сердечной недостаточностью - от 12 до 15 л. У пациентов с циррозом печени V_d увеличивается вдвое.

Метаболизм

Метаболизируется в печени при участии изофермента CYP2C9 с образованием трех метаболитов.

Основной метаболит - это производное карбоновой кислоты, является фармакологически неактивным. Два других метаболита, которые в организме образуются в незначительном количестве, обладают некоторой диуретической активностью, но их концентрация слишком мала, чтобы оказывать какое-либо значимое клиническое действие.

Выведение

$T_{1/2}$ торасемида у здоровых добровольцев составляет 4 ч. Около 80% от принятой во внутрь дозы выводится почками в виде метаболитов и около 20% в неизменном виде (у пациентов с нормальной функцией почек). Общий клиренс торасемида составляет 41 мл/мин и почечный клиренс - около 10 мл/мин, что соответствует примерно 25% от общего.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

У пациентов с хронической сердечной недостаточностью в стадии декомпенсации снижен печеночный и почечный клиренс препарата. У таких пациентов общий клиренс торасемида на 50% меньше, чем у здоровых добровольцев, а $T_{1/2}$ и общая биодоступность соответственно выше.

У пациентов с почечной недостаточностью, почечный клиренс торасемида заметно снижен, но это не отражается на общем клиренсе препарата. Диуретический эффект при почечной недостаточности может быть достигнут применением препарата в высоких дозах. Общий клиренс торасемида и $T_{1/2}$ остаются на том же уровне в случае сниженной функции почек, за счет метаболизма в печени.

У пациентов с циррозом печени V_d, $T_{1/2}$ и почечный клиренс препарата повышены, но общий клиренс остается неизменным.

Фармакокинетический профиль торасемида у пациентов пожилого возраста сходен с таковым у молодых пациентов, за тем исключением, что имеет место снижение почечного клиренса препарата из-за характерного возрастного нарушения снижения функции почек у пожилых пациентов. Общий клиренс и $T_{1/2}$ при этом не меняются.

Показания к применению:

— отечный синдром различного генеза, в т.ч. при хронической сердечной недостаточности, заболеваниях печени и почек;

— артериальная гипертензия.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Сердечная недостаточность

Противопоказания:

— анурия;

— печеночная кома и прекома;

— рефрактерная гипокалиемия; рефрактерная гипонатриемия;

— дегидратация;

— резко выраженные нарушения оттока мочи любой этиологии (включая одностороннее поражение мочевыводящих путей);

— дигиталисная интоксикация;

— острый гломерулонефрит;

— синоатриальная и AV-блокада II и III степени;

— возраст до 18 лет (безопасность и эффективность у детей не изучены);

— беременность;

— непереносимость галактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсорбция;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата;

— у пациентов с аллергией на сульфонамиды (сульфаниламидные противомикробные средства или препараты сульфонилмочевины) может отмечаться перекрестная аллергия на торасемид.

С *осторожностью:*

— артериальная гипотензия;

— гиповолемия (с артериальной гипотензией или без нее);

— нарушения оттока мочи (доброкачественная гиперплазия предстательной железы, сужение мочеиспускательного канала или гидронефроз);

— желудочковая аритмия в анамнезе;

— острый инфаркт миокарда (увеличение риска развития кардиогенного шока);

— диарея;

— панкреатит;

— сахарный диабет (снижение толерантности к глюкозе);

— заболевания печени, осложнившиеся циррозом и асцитом, почечная недостаточность, гепаторенальный синдром;

— подагра, гиперурикемия;

— анемия;

— одновременное применение сердечных гликозидов, амногликозидов или цефалоспоринов, кортикостероидов или адренокортикотропного гормона (АКТГ);

— гипокалемия;

— гипонатриемия;

— период лактации.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь. Таблетки следует проглатывать целиком, не разжевывая, запивая жидкостью. Таблетки можно принимать в любое удобное постоянное время, независимо от приема пищи.

Отечный синдром при хронической сердечной недостаточности: начальная доза составляет, как правило, 10-20 мг 1 раз/сут. При необходимости доза может быть увеличена в 2 раза до получения требуемого эффекта.

Отечный синдром при заболевании почек: начальная доза составляет, как правило, 20 мг 1 раз/сут. При необходимости доза может быть увеличена в 2 раза до получения требуемого эффекта.

Отечный синдром при заболевании печени: начальная доза составляет, как правило, 5-10 мг 1 раз/сут вместе с антагонистами альдостерона или калийсберегающими диуретиками. При необходимости доза препарата Бритомар может быть увеличена в 2 раза до получения требуемого эффекта. Не рекомендуется разовая доза более 40 мг, т.к. ее действие не изучено. Препарат назначают на длительный период или до момента исчезновения отеков.

Артериальная гипертензия: начальная доза составляет, как правило, 5 мг 1 раз/сут. При отсутствии адекватного снижения АД в течение 4-6 недель дозу увеличивают до 10 мг 1 раз/сут. Если эта доза не дает требуемого эффекта, в лечебную схему нужно добавить гипотензивный препарат другой группы.

Пациентам пожилого возраста коррекции дозы не требуется.

В случае пропуска очередной дозы нельзя принимать двойную дозу препарата. Следует сразу же принять забытую дозу. Следующую дозу принимают в обычное время на следующий день.

Побочное действие:

Определение частоты побочных реакций: очень часто (>1/10), часто (>1/100, <1/10), нечасто (>1/1000, <1/100), редко (>1/10 000, <1/1000), очень редко (1/10 000, включая отдельные сообщения); частота неизвестна (невозможно оценить на основе имеющихся данных).

Со стороны обмена веществ: нечасто - гиперхолестеринемия (возрастание уровня холестерина в крови), гипертриглицеридемия (возрастание уровня ТГ в крови), полидипсия (усиленная жажда).

Со стороны нервной системы: часто - головокружение, головная боль, сонливость; нечасто - судороги мышц нижних конечностей; частота неизвестна - спутанность сознания, обморок, парестезии в конечностях (ощущение онемения, "ползания мурашек" и покалывания).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - экстрасистолия (нарушение ритма сердца), тахикардия (увеличение ЧСС), усиленное сердцебиение, покраснение лица; частота неизвестна - чрезмерная артериальная гипотензия, тромбоз глубоких вен (образование сгустков крови), тромбоэмболия, гиповолемия (уменьшение ОЦК).

Со стороны дыхательной системы: нечасто - носовые кровотечения.

Со стороны пищеварительной системы: часто - диарея; нечасто - боль в животе, метеоризм; частота неизвестна - тошнота, рвота, потеря аппетита, панкреатит, диспепсические явления.

Со стороны почек и мочевыводящих путей: часто - увеличение частоты мочеиспускания, полиурия (увеличенное образование мочи), никтурия (учащение мочеиспускания по ночам); нечасто - учащенные позывы к мочеиспусканию; частота неизвестна - задержка мочи (у пациентов с обструкцией мочевыводящих путей), повышение концентрации мочевины и креатинина в крови.

Лабораторные показатели: нечасто - увеличение числа тромбоцитов; частота неизвестна - гипергликемия, гиперурикемия, гипокалиемия, снижение числа эритроцитов, лейкоцитов и тромбоцитов, небольшое повышение активности ЩФ в крови, повышение активности некоторых печеночных ферментов (например, ГГТ), гипонатриемия, гипохлоремия, метаболический алкалоз.

Со стороны органов чувств: частота неизвестна - нарушения зрения, звон в ушах и потеря слуха (носит, как правило, обратимый характер).

Со стороны кожных покровов: частота неизвестна - кожный зуд, сыпь, фотосенсибилизация.

Прочие: нечасто - астения (истощение), слабость, жажда, гиперактивность, нервозность, повышенная утомляемость.

Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются или были замечены любые другие побочные эффекты, пациент должен сообщить об этом врачу.

Передозировка:

Симптомы: чрезмерно повышенный диурез, сопровождающийся снижением ОЦК и нарушением электролитного баланса крови, с последующим выраженным снижением АД, сонливостью и спутанностью сознания, коллапсом. Могут наблюдаться желудочно-кишечные расстройства.

Лечение: специфического антидота нет. Провокация рвоты, промывание желудка, активированный уголь. Лечение симптоматическое, снижение дозы или отмена препарата и одновременно восполнение ОЦК и показателей водно-электролитного баланса и кислотно-основного состояния под контролем сывороточных концентраций электролитов, гематокрита.

Гемодиализ не эффективен, т.к. выведение торасемида и его метаболитов не ускоряется.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Бритомар не рекомендуется при беременности.

Торасемид не обладает тератогенным эффектом и фетотоксичностью, проникает через плацентарный барьер, вызывая нарушения водно-электролитного обмена и тромбоцитопению у плода.

Неизвестно, проникает ли торасемид в грудное молоко. С осторожностью следует назначать Бритомар в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Торасемид повышает токсичность сердечных гликозидов.

При одновременном приеме с минерало- и глюкокортикоидами, слабительными средствами возможно увеличение выведения калия.

Торасемид усиливает действие гипотензивных препаратов.

Торасемид, особенно в высоких дозах, может усилить нефротоксическое и ототоксическое действие аминогликозидов, антибиотиков, препаратов платины, цефалоспоринов.

Торасемид может усиливать действие курареподобных миорелаксантов и теофиллина.

При одновременном применении салицилатов в высоких дозах возможно усиление их токсического действия.

Торасемид ослабляет действие гипогликемических препаратов.

Последовательный или одновременный прием торасемида с ингибиторами АПФ может приводить к кратковременному падению АД. Этого можно избежать, уменьшив начальную дозу ингибитора АПФ или снизив дозу торасемида (или временно отменив его).

НПВС и пробенецид могут уменьшать мочегонное и гипотензивное действие торасемида.

Биодоступность и как следствие, эффективность торасемида может быть снижена при совместной терапии с колестирамином.

Торасемид может повышать токсичность препаратов лития и ототоксичность этакриновой кислоты.

Особые указания и меры предосторожности:

Препарат следует применять строго по назначению врача.

Пациенты с повышенной чувствительностью к сульфаниламидам и производным сульфонилмочевины могут иметь перекрестную чувствительность к препарату Бритомар. У пациентов, особенно в начале лечения препаратом

Бритомар и лиц пожилого возраста, рекомендуется проводить контроль электролитного баланса, объем и концентрацию циркулирующей крови.

При длительном лечении препаратом Бритомар рекомендуется проводить регулярный контроль электролитного баланса (особенно уровня калия), глюкозы, мочевой кислоты, креатинина, липидов и клеточных компонентов крови.

Пациентам, получающим Бритомар в высоких дозах, во избежание развития гипонатриемиии и метаболического алкалоза нецелесообразно ограничивать потребление поваренной соли.

Риск гипокалиемии наибольший у пациентов с циррозом печени, выраженным диурезом, при недостаточном потреблении электролитов с пищей, а также при одновременном лечении кортикостероидами или АКТГ.

Повышенный риск развития нарушений водно-электролитного баланса отмечается у больных с почечной недостаточностью. В ходе курсового лечения необходимо периодически контролировать концентрацию электролитов плазмы крови (в т.ч. натрий, кальций, калий, магний), кислотно-основное состояние, остаточный азот, креатинин, мочевую кислоту и проводить при необходимости соответствующую коррекционную терапию (с большей кратностью у больных с частой рвотой и на фоне парентерально вводимых жидкостей).

У пациентов с развившимися водно-электролитными расстройствами, гиповолемией или преренальной азотемией данные лабораторных анализов могут включать: гипер- или гипонатриемию, гипер- или гипохлоремию, гипер- или гипокалиемию, нарушения кислотно-щелочного баланса и повышение уровня мочевины крови. При возникновении этих расстройств необходимо прекратить прием препарата Бритомар до восстановления нормальных значений, а затем возобновить лечение препаратом Бритомар в меньшей дозе. При появлении или усилении азотемии и олигурии у пациентов с тяжелыми прогрессирующими заболеваниями почек рекомендуется приостановить лечение.

Подбор режима дозирования пациентам с асцитом на фоне цирроза печени следует проводить в стационарных условиях (нарушения водно-электролитного баланса могут повлечь развитие печеночной комы). Данной категории пациентов показан регулярный контроль электролитов плазмы крови.

Для профилактики гипокалиемии рекомендуется применение препаратов калия и калийсберегающих диуретиков (прежде всего спиронолактона), а также соблюдать диету, богатую калием.

Применение препарата Бритомар может вызывать обострение подагры.

У больных сахарным диабетом или со сниженной толерантностью к глюкозе требуется периодический контроль концентрации глюкозы в крови и моче.

У пациентов с гиперплазией предстательной железы, сужением мочеточников необходим контроль диуреза в связи с возможностью острой задержки мочи.

У пациентов с заболеваниями сердечно-сосудистой системы, особенно, принимающих сердечные гликозиды, вызванная диуретиками гипокалиемия может стать причиной развития аритмий.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения пациенты должны избегать занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при остром гломерулонефрите, почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при печеночной коме и прекоме; заболеваниях печени, осложнившихся циррозом и асцитом, гепаторенальном синдроме.

Применение в пожилом возрасте

Пациентам пожилого возраста коррекции дозы не требуется.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, защищенном от света месте при температуре не выше 30°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Britomar