Эпленор



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой от желтого до коричневато-желтого цвета, ромбовидные, двояковыпуклые, с гравировкой "E50" на одной из сторон.

	1 таб.
эплеренон	50 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 76.4 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 39.2 мг, кросповидон - 5.1 мг, натрия лаурилсульфат - 1.7 мг, тальк - 1.7 мг, магния стеарат - 0.9 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай II 85F23987 оранжевый - 6 мг (поливиниловый спирт - 2.4 мг, титана диоксид (E 171) - 1.3044 мг, макрогол-3350 - 1.212 мг, тальк - 0.888 мг, краситель железа оксид желтый (E 172) 0.186 мг, краситель железа оксид красный (E 172) - 0.0096 мг).

10 шт. - блистеры из ПВХ/ПВДХ/алюминиевой фольги (3) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Калийсберегающий диуретик. Эплеренон обладает относительной селективностью в отношении минералокортикоидных рецепторов у человека по сравнению с глюкокортикоидными, прогестероновыми и андрогенными рецепторами и препятствует их связыванию с альдостероном - ключевым гормоном РААС, который участвует в регуляции АД и патогенезе сердечно-сосудистых заболеваний.

Эплеренон вызывает стойкое увеличение уровней ренина в плазме крови и альдостерона в сыворотке крови. В последствие, секреция ренина подавляется альдостероном по механизму обратной связи. При этом повышение активности ренина или уровня циркулирующего альдостерона не влияет на эффекты эплеренона.

У пациентов с хронической сердечной недостаточностью II-IV функционального класса по классификации NYHA добавление эплеренона к стандартной терапии приводило к прогнозируемому дозозависимому увеличению уровня альдостерона. В исследовании по изучению функции сердца и почек у пациентов также было установлено значительное увеличение уровня альдостерона в результате терапии эплереноном. Эти данные подтверждают блокаду минералокортикоидных рецепторов.

Фармакокинетика

Абсолютная биодоступность эплеренона не известна. C_{max} достигается примерно через 2 ч. C_{max} и AUC линейно зависят от дозы в диапазоне от 10 до 100 мг и нелинейно - в дозе более 100 мг. Равновесное состояние достигается в течение 2 дней. Прием пищи не влияет на абсорбцию.

Эплеренон примерно на 50% связывается с белками плазмы крови, преимущественно с кислыми альфа1-гликопротеинами. Расчетный V_d в равновесном состоянии составляет 50 (±7) л. Эплеренон не связывается с эритроцитами.

Эплеренон метаболизируется, главным образом, при участии изофермента CYP3A4. Активные метаболиты эплеренона в плазме крови человека не идентифицированы.

В неизмененном виде с мочой и калом выводится менее 5% дозы эплеренона. После однократного приема внутрь меченого препарата около 32% дозы выводилось с калом и около 67% - с мочой. $T_{1/2}$ эплеренона составляет около 3-5 ч, клиренс из плазмы крови - примерно 10 л/ч.

По сравнению с пациентами контрольной группы у больных с тяжелой почечной недостаточностью выявлено увеличение AUC и C_{max} в равновесном состоянии на 38% и 24% соответственно, а у больных, находящихся на гемодиализе - их снижение на 26% и 3%. Корреляции между клиренсом эплеренона из плазмы крови и КК не обнаружено. Эплеренон не удаляется при гемодиализе.

У пациентов с умеренным нарушением функции печени (класс B по шкале Чайлд-Пью) C_{max} и AUC эплеренона в равновесном состоянии были увеличены на 3.6% и 42% соответственно, по сравнению со здоровыми добровольцами.

Фармакокинетику эплеренона в дозе 50 мг изучали у больных с сердечной недостаточностью (класс II-IV по классификации NYHA). AUC и C_{max} в равновесном состоянии у больных с сердечной недостаточностью были соответственно на 38 и 30% выше, чем у здоровых добровольцев, подобранных по возрасту, массе тела и полу. Было установлено, что клиренс эплеренона у больных с сердечной недостаточностью сходен с таковым у здоровых пожилых людей.

Показания к применению:

В качестве дополнительного средства к стандартной терапии (в т.ч. с применением бета-адреноблокаторов) с целью снижения риска развития сердечно-сосудистых заболеваний и смертности при стабильной дисфункции левого желудочка (фракция выброса <40%) и клинических признаках сердечной недостаточности после недавно перенесенного инфаркта миокарда.

Относится к болезням:

- Сердечная недостаточность

Противопоказания:

Концентрация калия в сыворотке крови в начале лечения > 5.0 ммоль/л; умеренная или выраженная почечная недостаточность (КК < 50 мл/мин); тяжелая печеночная недостаточность (класс C по шкале Чайлд-Пью); одновременный прием калийсберегающих диуретиков, препаратов калия или мощных ингибиторов CYP3A4, например, итраконазола, кетоконазола, ритонавира, нелфинавира, кларитромицина, телитромицина и нефазодона; детский и подростковый возраст до 18 лет; повышенная чувствительность к эплеренону.

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь. Начальная доза - 25 мг 1 раз/сут. Увеличение дозы проводится постепенно под контролем содержания калия в крови. Рекомендуемая поддерживающая доза - 50 мг 1 раз/сут.

При одновременном применении препаратов, оказывающих слабое или умеренно выраженное ингибирующее действие на CYP3A4, например, амиодарона, дилтиазема и верапамила, доза эплеренона не должна превышать 25 мг 1 раз/сут.

Побочное действие:

Со стороны обмена веществ: часто - гиперкалиемия; нечасто - дегидратация, гиперхолестеринемия, гипертриглицеридемия, гипонатриемия.

Со стороны нервной системы: часто - головокружение; нечасто - головная боль, бессонница.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - снижение АД; нечасто - фибрилляция предсердий, инфаркт миокарда, левожелудочковая недостаточность, ортостатическая гипотония, тромбоз артерий нижних конечностей.

Со стороны пищеварительной системы: часто - диарея, тошнота; нечастые - метеоризм, рвота.

Со стороны системы кроветворения: нечасто - эозинофилия.

Со стороны дыхательной системы: нечасто - фарингит.

Со стороны кожных покровов: нечасто - повышенная потливость, зуд.

Со стороны костно-мышечной системы: нечасто - боль в спине, судороги в икроножных мышцах ног.

Со стороны почек и мочевыводящих путей: часто - нарушение функции почек; нечастые - пиелонефрит.

Общие реакции: нечасто - астения, недомогание.

Лабораторные показатели: нечасто - повышение уровня остаточного азота мочевины, креатинина.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Сведений о применении при беременности нет. Применять с осторожностью и только в тех случаях, когда ожидаемая польза для матери значительно превышает возможный риск для плода/ребенка.

Неизвестно, выделяется ли эплеренон с грудным молоком у человека. При необходимости применения в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Диагнозы

- Аневризма аорты
- Аритмии
- Артериальная гипертензия
- Атеросклероз

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью следует применять у пациентов с сахарным диабетом 2 типа и микроальбуминурией; одновременно с ингибиторами АПФ или антагонистов рецепторов ангиотензина II, дигоксином и варфарином в дозах, близких к максимальным терапевтическим.

При лечении эплереноном может развиться гиперкалиемия, которая обусловлена его механизмом действия. В начале лечения и при изменении дозы препарата у всех пациентов следует контролировать концентрацию калия в сыворотке крови. В дальнейшем периодический контроль концентрации калия рекомендуется проводить пациентам с повышенным риском развития гиперкалиемии, например, пожилым больным с почечной недостаточностью и сахарным диабетом. Учитывая повышенный риск развития гиперкалиемии, назначение препаратов калия после начала лечения эплереноном не рекомендуется. Снижение дозы эплеренона приводит к снижению концентрации калия в сыворотке крови.

У пациентов с нарушением функции почек, в т.ч. диабетической микроальбуминурией, рекомендуется регулярно контролировать концентрацию калия в сыворотке крови. Риск развития гиперкалиемии увеличивается при снижении функции почек. Эплеренон не удаляется при гемодиализе.

У пациентов с легким или умеренным нарушением функции печени (класс А и В по шкале Чайлд-Пью) увеличения концентрации калия в сыворотке крови более 5.5 ммоль/л выявлено не было. У таких пациентов следует контролировать уровень электролитов.

Одновременное применение эплеренона с мощными индукторами CYP3A4 не рекомендуется.

Во время лечения эплереноном следует избегать применения циклоспорина, такролимуса, препаратов, содержащих литий.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Эплеренон не вызывает сонливости или нарушения когнитивной функции, однако необходимо учитывать возможность появления головокружения.

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