Торасемид



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:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки белого или почти белого цвета, круглые, плоскоцилиндрические, с фаской и риской.

	1 таб.
торасемид	10 мг

Вспомогательные вещества: маннитол - 78 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 56 мг, крахмал кукурузный прежелатинизированный - 53.5 мг, кроскармеллоза натрия - 10.5 мг, кремния диоксид коллоидный - 1 мг, магния стеарат - 1 мг.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (6) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (9) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

"Петлевой" диуретик. Основной механизм действия 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 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

После приема внутрь торасемид 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. Нарушение функции почек и/или печени не влияют на всасывание.

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.

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.

$T_{1/2}$ 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.

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. Диуретический эффект при почечной недостаточности может быть достигнут путем применения 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 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:

- 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); гликозидная интоксикация; острый гломерулонефрит; синоатриальная и AV-блокада II и III степени; детский и подростковый возраст до 18 лет; беременность; повышенная чувствительность к торасемиду; аллергия на сульфонамиды (сульфаниламидные противомикробные средства или препараты сульфонилмочевины).

Способ применения и дозы:

Принимают внутрь. В зависимости от показаний доза составляет 5-20 мг 1 раз/сут.

Не рекомендуется разовая доза более 40 мг, т.к. ее действие не изучено. Применяют длительно или до момента исчезновения отеков.

Побочное действие:

Со стороны обмена веществ: нечасто - гиперхолестеринемия, гипертриглицеридемия, полидипсия.

Со стороны нервной системы: часто - головокружение, головная боль, сонливость; нечасто - судороги мышц нижних конечностей; частота неизвестна - спутанность сознания, обморок, парестезии в конечностях.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - экстрасистолия, тахикардия, усиленное сердцебиение, покраснение лица; частота не известна - чрезмерная артериальная гипотензия, тромбоз глубоких вен, тромбоэмболия, гиповолемия.

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, никтурия; 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, слабость, жажда, гиперактивность, нервозность, повышенная утомляемость.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано применение при беременности. С осторожностью следует применять в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Диагнозы

- Аденома предстательной железы
- Баланит, баланопостит, фимоз
- Варикоцеле
- Гидронефроз

Особые указания и меры предосторожности:

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 АКТГ; гипокалемия; гипонатриемия; период лактации.

Пациенты с повышенной чувствительностью к сульфаниламидам и производным сульфонилмочевины могут иметь перекрестную чувствительность к торасемиду.

У пациентов, особенно в начале лечения торасемидом и у лиц пожилого возраста, рекомендуется проводить контроль электролитного баланса, объем и концентрацию циркулирующей крови.

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

Пациентам, получающим торасемид 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 торасемида до восстановления нормальных значений, а затем возобновить лечение торасемидом в меньшей дозе. При появлении или усилении азотемии и олигурии у пациентов с тяжелыми прогрессирующими заболеваниями почек рекомендуется приостановить лечение.

Подбор режима дозирования у пациентов 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 торасемида 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.

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