Торасемид-СЗ



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

Форма выпуска:

Таблетки, 5 мг и 10 мг. По 10 табл. в контурной ячейковой упаковке. По 30 табл. в банке полимерной из ПЭНД с крышкой из ПЭВД или во флаконе полимерном из ПЭНД с крышкой из ПЭВД. Каждую банку, флакон, 2, 3, 6, 10 контурных ячейковых упаковок помещают в картонную пачку.

Состав:

Таблетки	1 табл.
активное вещество:	
торасемид	5 мг
вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (лактопресс) (сахар молочный) — 89,3 мг; крахмал прежелатинизированный (крахмал 1500) — 24,5 мг; кремния диоксид коллоидный (аэросил) — 0,6 мг; магния стеарат — 0,6 мг	

Таблетки	1 табл.
активное вещество:	
торасемид	10 мг
вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (лактопресс) (сахар молочный) — 178,6 мг; крахмал прежелатинизированный (крахмал 1500) — 49 мг; кремния диоксид коллоидный (аэросил) — 1,2 мг; магния стеарат — 1,2 мг	

Описание:

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — диуретическое.

Фармакодинамика

Торасемид является петлевым диуретиком. Максимальный диуретический эффект развивается спустя 2–3 ч после приема препарата внутрь. Основной механизм действия препарата обусловлен обратимым связыванием торасемида с контранспортером ионов натрия/хлора/калия, расположенным в апикальной мембране толстого сегмента восходящей петли Генле, в результате чего снижается или полностью ингибируется реабсорбция ионов натрия и уменьшается осмотическое давление внутриклеточной жидкости и реабсорбция воды. Блокирует альдостероновые рецепторы миокарда; уменьшает фиброз и улучшает диастолическую функцию миокарда.

Торасемид в меньшей степени, чем фуросемид, вызывает гипокалиемию, при этом он проявляет бóльшую активность, и его действие более продолжительно. Применение торасемида является наиболее обоснованным выбором для проведения длительной терапии.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь торасемид быстро и практически полностью всасывается из ЖКТ. Прием пищи не оказывает значительного влияния на абсорбцию препарата. C_{max} торасемида в плазме крови отмечается через 1-2 ч после приема внутрь. Биодоступность составляет 80-90% с незначительными индивидуальными вариациями.

Распределение

Связывание с белками плазмы крови более 99%. Кажущийся V_d составляет 16 л.

Метаболизм

Метаболизируется в печени с помощью изоферментов системы цитохрома Р450. В результате последовательных реакций окисления, гидроксилирования или кольцевого гидроксилирования образуются три метаболита (М1, М3 и М5), которые связываются с белками плазмы крови на 86%, 95% и 97%, соответственно.

Выведение

$T_{1/2}$ торасемида и его метаболитов составляет 3-4 ч и не изменяется при хронической почечной недостаточности. Общий клиренс торасемида составляет 40 мл/мин, почечный клиренс -10 мл/мин. В среднем около 83% от принятой дозы выводится почками: в неизмененном виде (24%) и в виде преимущественно неактивных метаболитов (М1 - 12%, М3 - 3%, М5 - 41%).

Фармакокинетика у особых групп пациентов

При почечной недостаточности $T_{1/2}$ не изменяется, $T_{1/2}$ метаболитов М3 и М5 увеличивается. Торасемид и его метаболиты незначительно выводятся с помощью гемодиализа и гемофильтрации.

При печеночной недостаточности концентрация торасемида в плазме крови повышается вследствие снижения

метаболизма препарата в печени. У пациентов с сердечной или печеночной недостаточностью $T_{1/2}$ торасемида и метаболита M5 незначительно увеличен, кумуляция препарата маловероятна.

Показания к применению:

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

— артериальная гипертензия.

Относится к болезням:

- Артериальная гипертензия
- Гипертензия
- Сердечная недостаточность

Противопоказания:

— почечная недостаточность с анурией;

— печеночная кома и прекома;

— рефрактерная гипокалиемия/рефрактерная гипонатриемия;

— гиповолемия (с артериальной гипотензией или без нее) или дегидратация;

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

— гликозидная интоксикация;

— острый гломерулонефрит;

— декомпенсированный аортальный и митральный стеноз, гипертрофическая обструктивная кардиомиопатия;

— повышение центрального венозного давления (свыше 10 мм рт.ст.);

— гиперурикемия;

— одновременное применение аминогликозидов и цефалоспоринов;

— беременность;

— период грудного вскармливания;

— возраст до 18 лет;

— непереносимость лактозы, дефицит лактазы или глюкозо-галактозная мальабсобция;

— аллергическая реакция на сульфонамиды (сульфаниламидные противомикробные средства или препараты сульфонилмочевины);

— повышенная чувствительность к торасемиду или к любому из компонентов препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при артериальной гипотензии, стенозирующем атеросклерозе церебральных артерий, гипопротеинемии, предрасположенности к гиперурикемии, нарушении оттока мочи (доброкачественная гиперплазия предстательной железы, сужение мочеиспускательного канала или гидронефроз), желудочковой аритмии в анамнезе, остром инфаркте миокарда (увеличение риска развития кардиогенного шока), диарее, панкреатите, сахарном диабете (снижение толерантности к глюкозе), гепаторенальном синдроме, подагре, анемии; одновременном применении сердечных гликозидов, кортикостероидов и АКТГ.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь 1 раз/сут, в любое удобное (но в одно и то же) время, независимо от приема пищи. Таблетки следует проглатывать, не разжевывая и запивая достаточным количеством воды.

Отечный синдром при хронической сердечной недостаточности

Рекомендуемая начальная доза составляет 10-20 мг 1 раз/сут. При необходимости доза может быть увеличена вдвое до получения требуемого эффекта.

Отечный синдром при заболевании почек

Рекомендуемая начальная доза составляет 20 мг 1 раз/сут. При необходимости доза может быть увеличена вдвое до получения требуемого эффекта.

Отечный синдром при заболевании печени

Рекомендуемая начальная доза составляет 5-10 мг 1 раз/сут. При необходимости доза может быть увеличена вдвое до получения требуемого эффекта.

Не рекомендуется превышать максимальную разовую дозу, которая составляет 40 мг (отсутствует опыт применения).

Препарат применяют в течение длительного периода или до исчезновения отеков.

Артериальная гипертензия

Начальная доза составляет 2.5 мг (1/2 таб. по 5 мг) 1 раз/сут. При отсутствии терапевтического эффекта в течение 4 недель дозу увеличивают до 5 мг 1 раз/сут. При отсутствии адекватного снижения АД при приеме в дозе 5 мг 1 раз/сут в течение 4-6 недель дозу увеличивают до 10 мг 1 раз/сут. Если применение препарата в дозе 10 мг/сут не дает требуемого эффекта к лечению добавляют антигипертензивный препарат другой группы.

У **пациентов пожилого возраста** коррекция дозы не требуется.

Побочное действие:

Частота развития побочных эффектов классифицирована согласно рекомендациям Всемирной организации здравоохранения: очень часто - ≥1/10 (>10%); часто - от ≥1/100 до <1/10 (>1% и <10%); нечасто - от ≥1/1000 до <1/100 (>0.1% и <1%); редко - от ≥1/10 000 до <1/1000 (>0.01% и <0.1%); очень редко - <1/10 000 (<0.01%); частота неизвестна - не может быть оценена на основании имеющихся данных.

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

Со стороны органов чувств: частота неизвестна - нарушение зрения, нарушение слуха, шум в ушах и потеря слуха (носит, как правило, обратимый характер) обычно у пациентов с почечной недостаточностью или гипопротеинемией (нефротический синдром).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: нечасто - экстрасистолия, аритмия, тахикардия; частота неизвестна - чрезмерное снижение АД, ортостатическая гипотензия, коллапс, тромбоз глубоких вен, тромбоэмболия, снижение ОЦК.

Со стороны дыхательной системы: нечасто - носовое кровотечение.

Со стороны пищеварительной системы: часто - диарея; нечасто - боль в животе, метеоризм, полидипсия; частота неизвестна - сухость во рту, тошнота, рвота, потеря аппетита, панкреатит, диспепсические расстройства, внутрипеченочный холестаз.

Со стороны мочевыделительной системы: часто - увеличение частоты мочеиспускания, полиурия, никтурия; нечасто - учащенные позывы к мочеиспусканию; частота неизвестна - олигурия, задержка мочи (у пациентов с обструкцией мочевыводящих путей), интерстициальный нефрит, гематурия.

Со стороны репродуктивной системы: частота неизвестна - снижение потенции.

Со стороны кожи и подкожных тканей: частота неизвестна - кожный зуд, сыпь, крапивница, полиморфная эритема, эксфолиативный дерматит, пурпура, васкулит, фотосенсибилизация.

Со стороны костно-мышечной системы: частота неизвестна - мышечная слабость.

Со стороны обмена веществ: частота неизвестна - гипокалиемия, гипонатриемия, гипомагниемия, гипокальциемия, гипохлоремия, метаболический алкалоз, гиповолемия, дегидратация (чаще у пациентов пожилого возраста).

Со стороны лабораторных показателей: нечасто - гиперхолестеринемия, гипертриглицеридемия; частота неизвестна - гиперурикемия, небольшое повышение активности ЩФ в плазме крови, повышение концентрации креатинина и мочевины в плазме крови, повышение активности некоторых печеночных ферментов в плазме крови (например, ГГТ), тромбоцитопения, лейкопения, агранулоцитоз, гипергликемия, снижение толерантности к глюкозе (возможна

манифестация латентно протекающего сахарного диабета).

Прочие: частота неизвестна - апластическая или гемолитическая анемия.

Передозировка:

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

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

Применение при беременности и кормлении грудью:

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

Контролируемых исследований по применению торасемида у беременных женщин не проводилось, препарат не рекомендуется применять при беременности.

Неизвестно, выделяется ли торасемид с грудным молоком. При необходимости применения препарата Торасемид-СЗ в период лактации необходимо прекратить грудное вскармливание.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Повышает концентрацию и риск развития нефро- и ототоксического действия цефалоспоринов, аминогликозидов, хлорамфеникола, этакриновой кислоты, цисплатина, амфотерицина В (вследствие конкурентного почечного выведения).

Повышает эффективность диазоксида и теофиллина, снижает - гипогликемических средств, аллопуринола.

Прессорные амины и торасемид взаимно снижают эффективность друг друга.

Лекарственные средства, блокирующие канальциевую секрецию, повышают концентрацию торасемида в сыворотке крови.

При одновременном применении ГКС, амфотерицина В повышается риск развития гипокалиемии, с сердечными гликозидами - возрастает риск развития гликозидной интоксикации вследствие гипокалиемии (для высоко- и низкополярных) и удлинения $T_{1/2}$ (для низкополярных).

Снижает почечный клиренс препаратов лития и повышает вероятность развития интоксикации.

НПВС, сукральфат снижают диуретический эффект вследствие ингибирования синтеза простагландина, нарушения активности ренина в плазме крови и выведения альдостерона.

Усиливает антигипертензивное действие гипотензивных средств, нервно-мышечную блокаду деполяризующих миорелаксантов (суксаметоний) и ослабляет действие недеполяризующих миорелаксантов (тубокурарин).

Одновременный прием салицилатов в высоких дозах на фоне терапии торасемидом увеличивает риск проявления их токсичности (вследствие конкурентного почечного выведения).

Последовательное или одновременное применение торасемида с ингибиторами АПФ или антагонистами рецепторов ангиотензина II может привести к значительному снижению АД. Этого можно избежать, снизив дозу торасемида или временно отменив его.

Одновременное применение пробенецида или метотрексата может уменьшать эффективность торасемида (одинаковый путь секреции). С другой стороны торасемид может приводить к снижению почечной элиминации этих лекарственных средств.

При одновременном применении циклоспорина и торасемида увеличивается риск развития подагрического артрита вследствие того, что циклоспорин может вызвать нарушение экскреции уратов почками, а торасемид - гиперурикемию.

Сообщалось, что у пациентов с высоким риском развития нефропатии, принимающих торасемид внутрь, при

введении рентгеноконтрастных средств нарушения функций почек наблюдались чаще, чем у пациентов с высоким риском развития нефропатии, которым перед введением рентгеноконтрастных средств проводили в/в гидратацию.

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

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 Торасемид-СЗ.

Пациентам, получающим препарат Торасемид-СЗ в высоких дозах в течение длительного периода, во избежание развития гипонатриемии, метаболического алкалоза и гипокалиемии, рекомендуется диета с достаточным содержанием поваренной соли и применение препаратов калия.

Повышенный риск развития нарушений водно-электролитного баланса отмечается у пациентов 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).

При появлении или усилении азотемии и олигурии у пациентов с тяжелыми прогрессирующими заболеваниями почек, рекомендуется приостановить лечение.

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

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

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

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения пациенты должны воздерживаться от управления транспортными средствами и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций (риск развития головокружения и сонливости).

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей, защищенном от света месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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