Верошпирон



Код АТХ:

- C03DA01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Спиронолактон

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки белого или почти белого цвета, круглые, плоские, с фаской, с маркировкой "VEROSPIRON" на одной стороне, с характерным запахом.

	1 таб.
спиронолактон	25 мг

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный - 1.2 мг, магния стеарат - 2 мг, тальк - 5.8 мг, крахмал кукурузный - 70 мг, лактозы моногидрат - 146 мг.

20 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.

Капсулы твердые желатиновые, размер №3, с непрозрачной крышечкой желтого цвета и непрозрачным корпусом белого цвета; содержимое капсул - мелкозернистая гранулированная порошкообразная смесь белого цвета.

	1 капс.
спиронолактон	50 мг

Вспомогательные вещества: натрия лаурилсульфат - 2.5 мг, магния стеарат - 2.5 мг, крахмал кукурузный - 42.5 мг, лактозы моногидрат - 127.5 мг.

Состав твердой желатиновой капсулы: крышечка - краситель хинолиновый желтый (Е104) - 0.48%, титана диоксид (Е171) - 2%, желатин - до 100%; корпус - титана диоксид (Е171) - 2%, желатин - до 100%.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Капсулы твердые желатиновые, размер №0, с непрозрачной крышечкой оранжевого цвета и непрозрачным корпусом желтого цвета; содержимое капсул - мелкозернистая гранулированная порошкообразная смесь белого цвета.

	1 капс.
спиронолактон	100 мг

Вспомогательные вещества: натрия лаурилсульфат - 5 мг, магния стеарат - 5 мг, крахмал кукурузный - 85 мг, лактозы моногидрат - 255 мг.

Состав твердой желатиновой капсулы: крышечка - краситель солнечный закат желтый (E110) - 0.04%, титана диоксид (E171) - 2%, желатин - до 100%; корпус - краситель солнечный закат желтый (E110) - 0.04%, титана диоксид (E171) - 2%, краситель хинолиновый желтый (E104) - 0.5%, желатин - до 100%.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Органотропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Калийсберегающий диуретик, конкурентный антагонист альдостерона пролонгированного действия (минералокортикоидный гормон коры надпочечников).

В дистальных отделах нефрона спиронолактон препятствует задержке альдостероном натрия и воды и подавляет калийвыводящий эффект альдостерона, снижает синтез пермеаз в альдостеронзависимом участке собирательных трубочек и дистальных канальцев. Связываясь с рецепторами альдостерона, увеличивает экскрецию ионов натрия, хлора и воды с мочой, уменьшает выведение ионов калия и мочевины, снижает кислотность мочи.

Гипотензивный эффект обусловлен диуретическим эффектом. Диуретический эффект проявляется на 2-5 день лечения.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь быстро и полностью всасывается из ЖКТ. Биодоступность составляет около 100%, а прием пищи увеличивает ее до 100%. После ежедневного приема в дозе 100 мг спиронолактона в течение 15 дней C_{max} составляет 80 нг/мл, время достижения C_{max} после очередного утреннего приема - 2-6 ч.

Распределение

Связывание с белками плазмы составляет 98%.

Спиронолактон плохо проникает в органы и ткани, при этом сам спиронолактон и его метаболиты проникают через плацентарный барьер, а канренон - в грудное молоко. V_d - 0.05 л/кг.

Метаболизм

В процессе биотрансформации в печени образуются активные серосодержащие метаболиты 7-альфа-тиометилспиронолактон и канренон. Канренон достигает своей C_{max} через 2-4 ч, его связывание с белками плазмы составляет 90%.

Выведение

$T_{1/2}$ - 13-24 ч.Выводится преимущественно почками (50% - в виде метаболитов, 10% - в неизменном виде) и частично - через кишечник. Выведение канренона (главным образом почками) двухфазное, $T_{1/2}$ в первой фазе - 2-3 ч, во второй - 12-96 ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

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

Показания к применению:

— эссенциальная гипертензия (в составе комбинированной терапии);

— отечный синдром при хронической сердечной недостаточности (может применяться в виде монотерапии и в

комбинации со стандартной терапией);

— состояния, при которых может обнаруживаться вторичный гиперальдостеронизм, в т.ч. цирроз печени, сопровождающийся асцитом и/или отеками, нефротический синдром и другие состояния, сопровождающиеся отеками;

— гипокалиемия/гипомагниемия (в качестве вспомогательного средства для ее профилактики во время лечения диуретиками и при невозможности применения других способов коррекции уровня калия);

— первичный гиперальдостеронизм (синдром Конна) - для короткого предоперационного курса лечения;

— для установления диагноза первичного гиперальдостеронизма.

Относится к болезням:

- Гипертензия
- Нефрит
- Сердечная недостаточность
- Цирроз печени

Противопоказания:

— болезнь Аддисона;

— гиперкалиемия;

— гипонатриемия;

— почечная недостаточность тяжелой степени (КК менее 10 мл/мин);

— анурия;

— непереносимость лактозы, дефицит лактазы, синдром нарушения всасывания глюкозы/галактозы;

— беременность;

— период лактации (грудное вскармливание);

— детский возраст до 3 лет;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует назначать препарат при гиперкальциемии, метаболическом ацидозе, AV-блокаде (гиперкалиемия способствует ее усилению), сахарном диабете (при подтвержденной или предполагаемой хронической почечной недостаточности), диабетической нефропатии, хирургических вмешательствах, приеме лекарственных средств, вызывающих гинекомастию, проведении местной и общей анестезии, нарушениях менструального цикла, увеличении молочных желез, печеночной недостаточности, циррозе печени, а также пациентам пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

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 коррекцию дозы.

При *идиопатическом гиперальдостеронизме* препарат назначают в дозе 100-400 мг/сут.

При *выраженном гиперальдостеронизме и гипокалиемии* суточная доза составляет 300 мг (максимально 400 мг) за 2-3 приема, при улучшении состояния дозу постепенно снижают до 25 мг/сут.

При *гипокалиемии и/или гипомагниемии, вызванных терапией диуретиками*, Верошпирон назначают в дозе 25-100 мг/сут, однократно или в несколько приемов. Максимальная суточная доза составляет 400 мг, если пероральные препараты калия или другие методы восполнения его дефицита неэффективны.

При *диагностике и лечении первичного гиперальдостеронизма* в качестве *диагностического средства при коротком диагностическом тесте* Верошпирон назначают в течение 4 дней по 400 мг/сут, распределив суточную дозу на несколько приемов в день. При увеличении концентрации калия в крови во время приема препарата и снижении после отмены его можно предполагать наличие первичного гиперальдостеронизма. 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.

После того как диагноз гиперальдостеронизма установлен с помощью более точных диагностических методов, в качестве *короткого курса предоперационной терапии первичного гиперальдостеронизма* Верошпирон следует принимать в суточной дозе 100-400 мг, разделив ее на 1-4 приема в течение всего периода подготовки к хирургической операции. Если операция не показана, то Верошпирон применяется для проведения длительной поддерживающей терапии, при этом используется наименьшая эффективная доза, которая подбирается индивидуально для каждого пациента.

При лечении *отеков на фоне нефротического синдрома* суточная доза для **взрослых** обычно составляет 100-200 мг. Не выявлено влияния спиронолактона на основной патологический процесс, и потому применение данного препарата рекомендуется только в тех случаях, когда другие виды терапии оказываются неэффективны.

При *отечном синдроме на фоне хронической сердечной недостаточности* препарат назначают ежедневно в течение 5 дней по 100-200 мг/сут в 2-3 приема, в комбинации с "петлевым" или тиазидным диуретиком. В зависимости от эффекта суточную дозу уменьшают до 25 мг. Поддерживающая доза подбирается индивидуально. Максимальная суточная доза составляет 200 мг.

При *отеках на фоне цирроза печени* суточная доза Верошпирона для **взрослых** обычно составляет 100 мг, если соотношение ионов натрия и калия (Na^+/K^+) в моче превышает 1.0. Если соотношение меньше 1.0, то суточная доза обычно равна 200-400 мг. Поддерживающую дозу подбирают индивидуально.

При *отеках* у **детей** начальная доза составляет 1-3.3 мг/кг массы тела или 30-90 мг/м^2/сут в 1-4 приема. Через 5 дней проводят коррекцию дозы и при необходимости ее увеличивают в 3 раза по сравнению с первоначальной.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, изъязвления и кровотечения из ЖКТ, гастрит, кишечная колика, боль в животе, запор, нарушение функции печени.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: атаксия, заторможенность, головокружение, головная боль, сонливость, летаргия, спутанность сознания.

Со стороны системы органов кроветворения: агранулоцитоз, тромбоцитопения, мегалобластоз.

Со стороны обмена веществ: гиперурикемия, гиперкреатининемия, повышение концентрации мочевины, гиперкалиемия, гипонатриемия, метаболический гиперхлоремический ацидоз или алкалоз.

Со стороны эндокринной системы: огрубение голоса, у мужчин - гинекомастия (вероятность развития зависит от дозы, длительности лечения и обычно носит обратимый характер и после отмены Верошпирона исчезает, лишь в редких случаях грудная железа остается несколько увеличенной), снижение потенции и эрекции; у женщин - нарушения менструального цикла, дисменорея, аменорея, метроррагия в климактерическом периоде, гирсутизм, боли в области молочных желез, карцинома молочной железы (наличие связи с приемом препарата не установлено).

Аллергические реакции: крапивница; редко - макуло-папулезная и эритематозная сыпь, лекарственная лихорадка, зуд.

Дерматологические реакции: алопеция, гипертрихоз.

Со стороны мочевыделительной системы: острая почечная недостаточность.

Со стороны костно-мышечной системы: мышечный спазм, судороги икроножных мышц.

Передозировка:

Симптомы: тошнота, рвота, головокружение, снижение АД, диарея, кожная сыпь, гиперкалиемия (парестезии, мышечная слабость, аритмии), гипонатриемия (сухость во рту, жажда, сонливость), гиперкальциемия, дегидратация, увеличение концентрации мочевины.

Лечение: промывание желудка, симптоматическое лечение дегидратации и артериальной гипотензии. При гиперкалиемии необходимо нормализовать водно-электролитный обмен с помощью калийвыводящих диуретиков, быстрого парентерального введения раствора декстрозы (5-20% растворы) с инсулином из расчета 0.25-0.5 ЕД на 1 г декстрозы; при необходимости возможно повторное введение декстрозы. В тяжелых случаях проводят гемодиализ.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение Верошпирона противопоказано при беременности и в период лактации.

При необходимости применения препарата в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Верошпирон снижает эффект антикоагулянтов, непрямых антикоагулянтов (гепарина, производных кумарина, индандиона) и токсичность сердечных гликозидов (т.к. нормализация уровня калия в крови препятствует развитию токсичности).

Усиливает метаболизм феназола.

Снижает чувствительность сосудов к норэпинефрину (требует соблюдения осторожности при проведении анестезии).

Увеличивает $T_{1/2}$ дигоксина, поэтому возможна интоксикация дигоксином.

Усиливает токсическое действие лития из-за снижения его клиренса.

Ускоряет метаболизм и выведение карбеноксолона.

Карбеноксолон способствует задержке натрия спиронолактоном.

ГКС и диуретики (производные бензотиазина, фуросемид, этакриновая кислота) усиливают и ускоряют диуретический и натрийуретический эффекты.

Усиливает действие диуретических и гипотензивных лекарственных средств.

ГКС усиливают диуретический и натриурический эффект при гипоальбуминемии и/или гипонатриемии.

Возрастает риск развития гиперкалиемии при приеме Верошпирона с препаратами калия, калиевыми добавками и калийсберегающими диуретиками, ингибиторами АПФ (ацидоз), антагонистами ангиотензина II, блокаторами альдостерона, индометацином, циклоспорином.

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 и меры предосторожности:

При применении Верошпирона возможно временное повышение уровня азота мочевины в сыворотке крови, особенно при сниженной функции почек и гиперкалиемии. Также возможно развитие обратимого гиперхлоремического метаболического ацидоза.

При назначении Верошпирона пациентам с нарушениями функции почек и печени, пациентам пожилого возраста необходим регулярный контроль электролитов сыворотки крови и функции почек.

Прием Верошпирона затрудняет определение концентрации дигоксина, кортизола и адреналина в крови.

Несмотря на отсутствие прямого воздействия на углеводный обмен, наличие сахарного диабета, особенно с диабетической нефропатией, требует особой осторожности при назначении Верошпирона из-за возможности развития гиперкалиемии.

При лечении НПВС на фоне приема Верошпирона следует контролировать функцию почек и уровень электролитов крови.

Во время лечения Верошпироном следует избегать употребления пищи, богатой калием.

Во время лечения употребление алкоголя противопоказано.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В начальном периоде лечения запрещается управлять автомобилем и заниматься видами деятельности, требующими

повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций. Длительность ограничений устанавливается в индивидуальном порядке.

При нарушениях функции почек

Препарат противопоказан при почечной недостаточности тяжелой степени (КК менее 10 мл/мин). С осторожностью следует назначать препарат при диабетической нефропатии.

При назначении Верошпирона пациентам с нарушениями функции почек необходим регулярный контроль электролитов сыворотки крови и функции почек.

При нарушениях функции печени

С осторожностью следует назначать препарат при печеночной недостаточности, циррозе печени.

При назначении Верошпирона пациентам с нарушениями печени,необходим регулярный контроль электролитов сыворотки крови и функции почек.

Условия хранения:

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

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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