

Склад

діюча речовина: spironolactone;

1 таблетка містить: спіронолактону 100 мг;

допоміжні речовини: крохмаль картопляний, лактоза моногідрат, повідон, кальцію стеарат.

Лікарська форма

Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: таблетки плоскоциліндричної форми з фаскою та рисою, білого або білого з кремуватим відтінком кольору.

Фармакотерапевтична група

Калійзберігаючі діуретики. Код АТХ C03D A01.

Фармакодинаміка

Діюча речовина препарату – спіронолактон – конкурентний антагоніст альдостерону, що впливає на дистальні канальці нирок. Внаслідок блокади альдостерону пригнічує затримку води та іонів Na^+ і сприяє утриманню іонів K^+ , що не тільки підвищує екскрецію іонів Na^+ та Cl^- і знижує екскрецію іонів K^+ з сечею, а й знижує екскрецію іонів H^+ . У результаті цього сечогінний ефект має також гіпотензивну дію.

Фармакокінетика

Абсорбція спіронолактону зі шлунково-кишкового тракту швидка і повна. Він значною мірою зв'язується з білками плазми крові (приблизно 90 %).

Спіронолактон піддається швидкому метаболізму. Його активними метаболітами є 7 α -тіометилспіронолактон і канренон. Незважаючи на те, що період напіввиведення самого спіронолактону короткий (1,3 години), періоди напіввиведення його активних метаболітів триваліші (від 2,8 до 11,2 години). Метаболіти екскретуються, головним чином, із сечею; мала частина екскретується з калом. Спіронолактон і його метаболіти проникають через плаценту і в грудне молоко.

Після застосування 100 мг спіронолактону щодня впродовж 15 днів здоровими добровольцями, показники часу до досягнення пікової концентрації у плазмі крові (t_{max}), пікової концентрації у плазмі крові (C_{max}) і періоду напіввиведення ($t_{1/2}$) спіронолактону становили: 2,6 години, 80 нг/мл і приблизно 1,4 години

відповідно. Для 7 α -тіометилспіронолактону і канренону ці показники склали відповідно 3,2 і 4,3 години; 391 нг/мл і 181 нг/мл; 13,8 та 16,5 години. Вплив на нирки одиничної дози спіронолактону досягає піка через 7 годин і зберігається щонайменше впродовж 24 годин.

Показання

1. Первинний гіперальдостеронізм.
2. Застійна серцева недостатність – при неефективності чи непереносимості інших діуретиків або у разі необхідності підвищення їх ефективності.
3. Есенціальна артеріальна гіпертензія, головним чином при гіпокаліємії – зазвичай у комбінації з іншими антигіпертензивними препаратами.
4. Цироз печінки, що супроводжується набряками та/або асцитом.
5. Набряки, зумовлені нефротичним синдромом.
6. Гіпокаліємія – у разі неможливості застосування іншої терапії.
7. Профілактика гіпокаліємії у пацієнтів, які отримують серцеві глікозиди – у випадку, коли інші способи терапії розглядаються як недоцільні або невідповідні.

Протипоказання

1. Гіперчутливість до діючої речовини або до інших компонентів препарату.
2. Гостра ниркова недостатність, виражене порушення азотовидільної функції нирок (швидкість клубочкової фільтрації <10 мл/хв), анурія.
3. Гіперкаліємія, гіпонатріємія.
4. Хвороба Аддісона.
5. Одночасне застосування з калійзберігаючими діуретиками і препаратами калію – через можливість розвитку гіперкаліємії.
6. Вагітність та період годування груддю.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій

Одночасне застосування препарату з іншими лікарськими засобами може спричиняти:

- з антигіпертензивними засобами (особливо гангліоблокатори, нікардипін, німодипін) – надмірне зниження артеріального тиску; при одночасному застосуванні слід зменшити дозу антигіпертензивних засобів з подальшою її корекцією у разі необхідності;
- з амонію хлоридом, холестираміном – підвищення ризику розвитку гіперкаліємії і гіперхлоремічного метаболічного ацидозу;

- з калійзберігаючими діуретиками, препаратами калію, інгібіторами ангіотензинперетворюючого ферменту (АПФ), блокаторами рецепторів ангіотензину II, блокаторами альдостеронових рецепторів, антихолінестеразними засобами, такролімусом, циклоспорином – збільшення ризику розвитку гіперкаліємії; одночасне застосування з калійзберігаючими діуретиками і препаратами калію протипоказано через можливість розвитку гіперкаліємії;
- з іншими діуретиками – посилення діуретичного ефекту;
- з нестероїдними протизапальними засобами – підвищення ризику розвитку гіперкаліємії та ниркової недостатності із супутнім зниженням діуретичної, натрійуретичної і антигіпертензивної дії спіронолактону; при одночасному застосуванні з ацетилсаліциловою кислотою також пригнічується синтез простагландинів, з антипірином – посилюється його метаболізм у печінці;
- з глюкокортикостероїдами, адренкортикотропним гормоном (АКТГ) – посилення діуретичної, натрійуретичної дії спіронолактону та парадоксальне посилення екскреції калію;
- з α - та β -адреноміметиками, карбеноксолоном – послаблення дії спіронолактону;
- з антипсихотичними засобами, трициклічними антидепресантами – посилення дії спіронолактону;
- з барбітуратами, наркотичними препаратами, етанолом – ортостатичну гіпотензію;
- з терфенадином – збільшення ризику розвитку шлуночкової аритмії внаслідок гіпокаліємії та дисбалансу інших електролітів;
- з карбамазепіном – збільшення ризику розвитку гіпонатріємії;
- з дигоксином – підвищення ризику розвитку глікозидної інтоксикації внаслідок подовження його періоду напіввиведення;
- з препаратами літію – підвищення ризику розвитку інтоксикації внаслідок зниження ниркового кліренсу літію; не слід одночасно застосовувати ці препарати;
- з непрямыми антикоагулянтами (похідні кумарину), мітотаном, пресорними амінами (епінефрин), серцевими глікозидами – послаблення дії останніх;
- з триптореліном, бусереліном, гонадореліном – посилення дії останніх.

Особливості застосування

Особливості застосування.

Застосування препарату, особливо хворим із порушенням функції нирок, може спричинити транзиторне підвищення вмісту азоту сечовини у плазмі крові та гіперкаліємію, що може призвести до розвитку порушень серцевого ритму та оборотного гіперхлоремічного метаболічного ацидозу. Препарат потрібно

застосовувати з обережністю хворим з порушенням функції нирок, печінки та пацієнтам літнього віку. Слід періодично визначати рівень електролітів у плазмі крові та показники функції нирок. У разі розвитку гіперкаліємії лікування препаратом слід припинити.

Препарат потрібно застосовувати з обережністю хворим, у яких наявні захворювання можуть зумовити розвиток ацидозу та/або гіперкаліємії.

Препарат слід застосовувати з обережністю хворим на цукровий діабет, особливо при наявності діабетичної нефропатії.

Терапія спіронолактоном може порушити процес визначення концентрації кортизолу, епінефрину та дигоксину (радіоімунологічними методами).

Слід уникати тривалого необґрунтованого застосування препарату, оскільки, за даними досліджень, тривале застосування спіронолактону тваринам у максимальних дозах сприяло розвитку карциноми та мієлоїдної лейкемії.

Під час застосування препарату не слід вживати спиртні напої.

Препарат містить лактозу, тому пацієнтам із рідкісними спадковими формами непереносимості галактози, недостатністю лактази або синдромом глюкозо-галактозної мальабсорбції не можна застосовувати препарат.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами

У початковий період лікування, тривалість якого індивідуальна, протипоказано керувати автотранспортом або іншими механізмами.

Застосування у період вагітності або годування груддю

Препарат протипоказаний у період вагітності або годування груддю. При необхідності застосування препарату слід припинити годування груддю.

Спосіб застосування та дози

Препарат застосовують внутрішньо дорослим та дітям.

Добову дозу препарату приймають за 1 або 2 прийоми після їди. Застосування добової дози за 1 прийом або перший прийом препарату при дворазовому застосуванні рекомендується вранці.

Тривалість курсу лікування індивідуальна, у деяких випадках вона може сягати кількох років, при цьому необхідно застосовувати препарат у найменшій ефективній добовій дозі за умови постійного контролю електролітного складу сироватки крові та показників функції нирок.

Дорослим.

Первинний гіперальдостеронізм.

При підготовці до операції препарат застосовувати у дозі 100 – 400 мг на добу. У разі неможливості оперативного лікування препарат можна застосовувати тривало як підтримувальну терапію у найменшій ефективній дозі, яка визначається індивідуально.

У цьому випадку кожні 14 днів початкову дозу допустимо знижувати до досягнення мінімальної ефективної дози. При необхідності застосування менших доз препарату слід застосовувати таблетки Спіронолактон-Дарниця у відповідному дозуванні. При тривалому лікуванні рекомендується застосовувати препарат у комбінації з іншими діуретиками для зменшення побічних ефектів.

Застійна серцева недостатність, набряки, зумовлені нефротичним синдромом.

Препарат застосовувати у початковій дозі 100 мг на добу за 1 або 2 прийоми. Добова доза також може коливатись у межах від 25 до 200 мг.

У разі призначення більш високих доз препарат можна застосовувати у комбінації з іншими діуретиками, що діють у більш проксимальних відділах ниркових каналців. У цьому випадку слід провести корекцію дози спіронолактону.

Есенціальна артеріальна гіпертензія.

Препарат застосовувати у початковій дозі 50-100 мг на добу за 1 або 2 прийоми у комбінації з іншими антигіпертензивними препаратами. Лікування слід продовжувати не менше 2 тижнів, оскільки до кінця цього періоду досягається максимальний антигіпертензивний ефект. Подальша корекція дози індивідуальна, залежно від досягнутого ефекту.

Цироз печінки, що супроводжується асцитом або набряками.

Якщо співвідношення Na^+/K^+ у сечі більше 1, препарат застосовувати у початковій дозі 100 мг на добу. Максимальна добова доза – 100 мг/добу. Якщо це співвідношення менше 1, препарат застосовувати у дозі 200 мг на добу, при цьому максимальна добова доза – 400 мг/добу.

Гіпокаліємія.

Препарат застосовувати у дозі 25-100 мг на добу пацієнтам, яким недостатньо харчових добавок з калієм або інших методів калійзамісної терапії.

Дітям.

Препарат застосовувати у дозі 1-3 мг/кг маси тіла на добу за 1 або 2 прийоми. У разі підтримувальної терапії у комбінації з іншими діуретиками добова доза становить 1-2 мг/кг маси тіла.

Пацієнтам літнього віку.

Препарат рекомендується застосовувати у нижчих дозах з наступним поступовим збільшенням до досягнення максимального ефекту. Слід брати до уваги, що у цієї категорії хворих мають місце печінкові та ниркові порушення, які можуть впливати на метаболізм препарату та його екскрецію.

Діти

Препарат застосовують у педіатричній практиці за призначенням лікаря.

Передозування

Симптоми: сонливість/млявість, сплутаність свідомості, електролітні порушення.

Лікування: симптоматична терапія. Слід підтримувати водно-електролітний і кислотно-лужний баланси: застосуванням діуретиків, що виводять калій, парентеральним введенням глюкози з інсуліном, у складних випадках – проведенням гемодіалізу. Специфічного антидоту не існує.

Побічні реакції

З боку серцево-судинної системи: артеріальна гіпотензія, аритмія (у пацієнтів з нирковою недостатністю і тих, хто отримує препарати калію), васкуліт.

З боку системи крові та лімфатичної системи: лейкопенія (у тому числі агранулоцитоз), тромбоцитопенія, мегалобластна або апластична анемія, еозинофілія.

З боку нервової системи та психіки: головний біль, сонливість, запаморочення, атаксія, параліч, параплегія, летаргія, загальмованість, сплутаність свідомості.

З боку дихальної системи, органів грудної клітки та середостіння: зміна тембру голосу.

З боку травного тракту: нудота, блювання, зниження апетиту, біль у животі та шлунку, діарея, запор, кишкові коліки, гастрит, виразка шлунка та дванадцятипалої кишки, шлункова кровотеча.

З боку гепатобіліарної системи: гепатит, порушення функції печінки.

З боку сечовидільної системи: гостра ниркова недостатність.

З боку опорно-рухового апарату та сполучної тканини: остеомалія, спазм м'язів, судоми м'язів нижніх кінцівок.

З боку обміну речовин та метаболізму: гіперкаліємія, гіпонатріємія, гіперкреатинемія, підвищення рівня сечовини у плазмі крові, гіперурикемія, порфірія, метаболічний гіперхлоремічний ацидоз або алкалоз, дегідратація.

З боку ендокринної системи: гірсутизм.

З боку репродуктивної системи та молочних залоз: зниження лібідо, еректильна дисфункція, гінекомастія, порушення менструального циклу, дисменорея, аменорея, метрорагія у період менопаузи, набухання та біль молочних залоз у жінок, безпліддя (у разі використання високих доз – 450 мг на добу), доброякісні пухлини молочних залоз.

З боку імунної системи, шкіри та підшкірної клітковини: реакції гіперчутливості, у тому числі: висипання, свербіж, кропив'янка, медикаментозна гарячка; гіпертрихоз, алопеція, вовчакоподібний синдром, гіперемія, кільцеподібна еритема, екзема, синдром Стівенса – Джонсона.

Загальні: астенія, підвищена втомлюваність.

Термін придатності

2 роки.

Умови зберігання

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка

По 10 таблеток у контурній чарунковій упаковці; по 3 контурні чарункові упаковки у пачці.

Категорія відпуску

За рецептом.

Виробник

ПрАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності

Україна, 02093, м. Київ, вул. Бориспільська, 13.

Джерело інструкції

Інструкцію лікарського засобу взято з офіційного джерела — [Державного реєстру лікарських засобів України](#).