

Состав

действующее вещество: torasemide;

1 мл раствора для инъекций содержит торасемида 5 мг;

вспомогательные вещества: полиэтиленгликоль 400, трометамин, натрия гидроксид, вода для инъекций.

Лекарственная форма

Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачный, бесцветный раствор.

Фармакотерапевтическая группа

Мочегонные препараты. Высокоактивные диуретики. Код АТХ C03C A04.

Фармакодинамика

Торасемид действует как салуретик, действие связано с угнетением ренальной абсорбции ионов натрия и хлора в восходящей части петли Генле. У человека диуретический эффект быстро достигает своего максимума в течение первых 2-3 часов после внутривенного и перорального применения соответственно и остается постоянным в течение почти 12 часов. У здоровых добровольцев в диапазоне доз 5-100 мг наблюдалось пропорциональное логарифму дозы увеличение диуреза. Увеличение диуреза наблюдалось даже в тех случаях, когда другие мочегонные средства, например дистально действующие эффективные диуретики тиазидового ряда, уже не оказывали нужного эффекта, например, при почечной недостаточности. Благодаря такому механизму действия торасемид приводит к уменьшению отеков. В случае сердечной недостаточности торасемид уменьшает проявления заболевания и улучшает функционирование миокарда за счет уменьшения пред- и постнагрузки. После перорального применения антигипертензивное действие торасемида развивается постепенно, начиная с первой недели после начала лечения. Максимум антигипертензивного действия достигается не позже чем через 12 недель. Торасемид снижает артериальное давление за счет снижения общего периферического сопротивления сосудов. Это влияние объясняется нормализацией нарушенного электролитного баланса, главным образом за счет уменьшения повышенной активности свободных ионов кальция в клетках мышц артериальных сосудов, что было выявлено у больных, страдающих артериальной гипертензией. Вероятно, это влияние снижает

повышенную восприимчивость сосудов к эндогенным вазопрессорным веществам, например катехоламинам.

Фармакокинетика

После перорального применения торасемид быстро и полностью всасывается в течение 1-2 часов. Биодоступность составляет примерно 80-90 %; при условии полного всасывания максимальное значение эффекта первого прохождения составляет 10-20 %. Прием пищи не влияет на всасывание торасемида.

Связывание торасемида с белками плазмы составляет более 99 %, метаболитов M_1 , M_3 , и M_5 – 86 %, 95 % и 97 % соответственно. У человека торасемид метаболизируется с образованием трех метаболитов - M_1 , M_2 и M_5 .

Доказательств существования других метаболитов нет. Метаболиты M_1 и M_5 образуются в результате окисления метальной группы, находящейся на фенольном кольце, до карбоновой кислоты. Метаболит M_3 образуется в результате гидроксилирования кольца. Кинетика торасемида и его метаболитов характеризуется линейной зависимостью, это означает, что максимальная концентрация в сыворотке и площадь под кривой содержания в сыворотке увеличивается пропорционально дозировке. Конечное время полувыведения ($t_{1/2}$) торасемида и его метаболитов у здоровых добровольцев составляет 3-4 часа.

Общий клиренс торасемида составляет 40 мл/мин, ренальный клиренс - примерно 10 мл/мин. Основной метаболит M_5 диуретического эффекта не имеет, а на долю действующих метаболитов M_1 и M_3 , взятых вместе, приходится около 10 % фармакодинамического действия. При почечной недостаточности общий клиренс и период полувыведения торасемида не изменяются, а период полувыведения M_3 и M_5 удлиняется. Однако фармакодинамические характеристики остаются неизменными, а степень тяжести почечной недостаточности на продолжительность действия не влияет. У больных с нарушением функции печени или сердечной недостаточностью периоды полувыведения торасемида и метаболита M_5 незначительно увеличиваются, а количество вещества, выводимого с мочой, соответствует количеству, которое выводится у здоровых людей, поэтому кумуляции торасемида и его метаболитов ожидать не следует. Торасемид и его метаболиты практически не выводятся при гемодиализе и гемофильтрации.

Показания

Лечение отеков и / или выпотов, вызванных сердечной недостаточностью, если необходимо внутривенное применение лекарственного средства, например, в случае отека легких вследствие острой сердечной недостаточности.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к действующему веществу, препаратам сульфонилмочевины и к одному из вспомогательных веществ препарата. Почечная недостаточность с анурией. Печеночная кома или прекома. Артериальная гипотензия. Гиповолемия. Гипонатриемия. Гипокалиемия. Острое нарушение мочеиспускания, например, вследствие гипертрофии предстательной железы. Период кормления грудью.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Торасемид усиливает действие других антигипертензивных средств, в частности ингибиторов ангиотензинпревращающего фермента, что может привести к чрезмерному снижению артериального давления при их совместном применении. При одновременном применении торасемида с препаратами дигиталиса дефицит калия, вызванный применением диуретика, может привести к повышению или усилению побочного действия обоих препаратов. Торасемид может снижать эффективность противодиабетических средств. Пробенецид и нестероидные противовоспалительные препараты могут тормозить диуретическое и антигипертензивное действие торасемида. При лечении салицилатами в высоких дозах торасемид может повысить их токсическое действие на центральную нервную систему. Торасемид, особенно в высоких дозах, может усилить ототоксическое и нефротоксическое действие аминогликозидных антибиотиков, например канамицина, гентамицина, тобрамицина и цитостатических средств - производных платины, а также нефротоксическое действие цефалоспоринов. Торасемид может усиливать действие теофиллина, а также влияние курареподобных лекарственных средств на релаксацию мышц. Слабительные средства, а также минерало- и глюкокортикоиды могут усилить потерю калия, обусловленную торасемидом. При одновременном применении торасемида и препаратов лития возможно повышение концентрации лития в плазме, что может вызвать усиление влияния и побочных действий лития. Торасемид может снижать сосудосуживающее действие катехоламинов, например эпинефрина и норэпинефрина. При одновременном применении с холестерамином может снижаться всасывание торасемида и соответственно его ожидаемая эффективность.

Особенности применения

Перед началом применения препарата необходимо устранить существующую гипокалиемию, гипонатриемию или гиповолемию.

При длительном применении торасемида рекомендуется осуществлять регулярный контроль электролитного баланса, в частности калия в сыворотке крови, особенно у пациентов, одновременно принимающих гликозиды наперстянки, ГКС, минералокортикостероидов или слабительные средства. Кроме этого, необходимо регулярно контролировать содержание глюкозы, мочевой кислоты, креатинина и липидов в крови. Торасемид следует с особой осторожностью применять пациентам, страдающим заболеваниями печени, сопровождающиеся циррозом печени и асцитом, поскольку внезапные изменения водно-электролитного баланса могут привести к печеночной коме. Терапию с применением торасемида (как и других мочегонных средств) пациентам этой группы необходимо проводить в условиях стационара. Для предупреждения гипокалиемии и метаболического ацидоза препарат следует назначать вместе с препаратами-антагонистами альдостерона или препаратами, способствующими задержке калия в организме. После применения препарата наблюдались случаи ототоксичности (шум в ушах и потеря слуха), которые имели обратимый характер, однако прямой связи с применением препарата не установлено. При применении диуретиков необходимо тщательно контролировать клинические симптомы нарушения электролитного баланса, гиповолемии, экстраренальных азотемии и других нарушений, которые могут проявляться в виде сухости во рту, жажды, слабости, вялости, сонливости, возбуждения, мышечной боли или судом, миастении, гипотонии, олигурии, тахикардии, тошноты, рвоты. Чрезмерный диурез может стать причиной обезвоживания организма, привести к снижению объема циркулирующей крови, тромбообразованию и эмболии, особенно у пациентов пожилого возраста.

Пациентам с нарушениями водно-электролитного баланса необходимо прекратить применение препарата и после устранения нежелательных эффектов восстановить терапию, начиная с других доз.

Вследствие того, что при лечении диуретиком может наблюдаться увеличение содержания глюкозы в крови у пациентов с латентным или явным сахарным диабетом необходимо проводить постоянную тщательную проверку метаболизма углеводов. Также необходим регулярный контроль картины крови (эритроциты, лейкоциты, тромбоциты). Особенно в начале лечения пациентов пожилого возраста необходимо обращать особое внимание на появление симптомов потери электролитов и сгущения крови.

В случае отсутствия достаточного клинического опыта применения не следует назначать торасемид при наличии следующих заболеваний и состояний: подагра; аритмия, например синоатриальная блокада, блокада II и III степени; патологические изменения кислотно-щелочного метаболизма; сопутствующая терапия с применением препаратов лития, аминогликозидов или

цефалоспоринов; патологические изменения картины крови, например тромбоцитопения или анемия у больных без почечной недостаточности нарушение функции почек, вызванные нефротоксичными веществами.

Применение препарата торада может быть причиной получения положительного результата при осуществлении теста на допинг. В этом случае нельзя исключить вредное воздействие препарата на здоровье, если его применять по показаниям, то есть с целью допинга.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Даже при надлежащем применении торасемид может привести к значительному негативному влиянию на способность управлять автотранспортом или работать с другими механизмами. Это во многом касается таких случаев, как начало лечения, повышение дозы препарата, замена препарата или назначение сопутствующей терапии.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность. Достоверные данные о влиянии торасемида на эмбрион и плод у человека отсутствуют. Торасемид проникает через плацентарный барьер.

Поэтому препарат применяют в период беременности только по жизненным показаниям и в минимально возможной эффективной дозе. Диуретики непригодны для стандартной схемы лечения артериальной гипертензии или отеков у беременных, поскольку они способны снижать перфузию плацентарного барьера и вызывать токсическое воздействие на внутриутробное развитие плода. Если торасемид применяют для лечения беременных с сердечной или почечной недостаточностью, то необходимо проводить тщательный мониторинг электролитов и гематокрита, а также тщательно наблюдать за развитием плода.

Период кормления грудью. В настоящее время не установлено, проникает торасемид в грудное молоко у животных или человека. Нельзя исключить риск применения препарата у новорожденных / грудных детей. Поэтому применения препарата в период лактации противопоказано. Если необходимо применять торасемида в этот период, то кормление грудью следует прекратить.

Фертильность.

Исследование влияния торасемида на фертильность у людей не проводилось.

Способ применения и дозы

Взрослые. Лечение необходимо начинать с применения разовой дозы 2 мл торада, что эквивалентно 10 мг торасемида в сутки. Если эффект недостаточен, то разовую дозу можно увеличить до 4 мл препарата торада, что эквивалентно 20 мг торасемида. Если эффект и в этом случае будет недостаточен, можно применить кратковременную (в течение не более 3 суток) терапию с введением суточной дозы 8 мл препарата торада, что эквивалентно 40 мг торасемида.

Острый отек легких. Лечение нужно начинать с введения разовой дозы 4 мл препарата торада, что эквивалентно 20 мг торасемида. В зависимости от эффекта, дозу можно повторить с интервалом в 30 минут. Запрещается превышать максимальную суточную дозу 20 мл препарата торада, что эквивалентно 100 мг торасемида.

Раствор для инъекций вводить внутривенно медленно. Запрещается вводить раствор внутрь артериально. Вводить только чистый раствор. При длительном применении введение надо как можно скорее заменить на пероральное применение, поскольку внутривенное применения препарата не рекомендуется проводить более 7 суток.

Пациенты с печеночной недостаточностью. Лечение этой категории пациентов следует проводить с осторожностью, поскольку возможно повышение концентрации торасемида в плазме крови.

Пациенты пожилого возраста. Лечение этой категории пациентов не требует специального подбора дозы. Однако соответствующих исследований в отношении людей пожилого возраста по сравнению с молодыми пациентами не проводилось.

Дети

Не следует применять торасемида детям и подросткам из-за отсутствия достаточного клинического опыта.

Передозировка

Типичная симптоматика неизвестна. Передозировка может вызвать сильный диурез, в том числе риск чрезмерной потери воды и электролитов, сонливость, аментивный синдром (одна из форм нарушения сознания), симптоматическую артериальную гипотензию, сердечно-сосудистую недостаточность и нарушения со стороны пищеварительного тракта.

Лечение передозировки. Специфический антидот неизвестен. Симптомы интоксикации исчезают, как правило, при снижении дозы и отмене лекарственного средства, а также при соответствующем замещении жидкости и электролитов (следует проводить контроль). Торасемид не выводится из крови с помощью гемодиализа. Лечение при гиповолемии - замещение объема жидкости. Лечение при гипокалиемии - назначение препаратов калия. Лечение сердечно-сосудистой недостаточности - придать больному сидячее положение и, при необходимости, назначить симптоматическую терапию.

Анафилактический шок (неотложные меры). При первом появлении кожных реакций (таких как крапивница или покраснение кожи), возбужденного состояния больного, головной боли, потливости, тошноты, цианоза проводят катетеризацию вены; больному придают горизонтальное положение, обеспечивают свободное поступление воздуха, назначают кислород. При необходимости вводят эпинефрин, растворы, замещающие объем жидкости, глюкокортикоидные гормоны.

Побочные реакции

Для оценки побочных явлений была использована следующая классификация частоты их проявлений: очень часто - $\geq 10\%$; часто - $\geq 1\% - < 10\%$; иногда - $\geq 0,1\% - < 1\%$; редко - $\geq 0,01\% - < 0,1\%$; очень редко - $< 0,01\%$, в том числе единичные случаи.

Метаболизм/электролиты. Часто: интенсификация метаболического алкалоза; спазмы мышц (особенно в начале лечения); повышение концентрации мочевой кислоты и глюкозы в крови, а также холестерина и триглицеридов; гипокалиемия при сопутствующей низкокалорийной диете, при рвоте, диарее, после чрезмерного применения слабительных средств, а также у больных с хронической дисфункцией печени. В зависимости от дозирования и продолжительности лечения возможны нарушения водного и электролитного балансов, например гиповолемия, гипокалиемия и/или гипонатриемия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы. Очень редко: ввиду возможного сгущения крови могут возникать тромбэмболические осложнения, спутанность сознания, артериальная гипотензия, а также нарушения кровообращения и сердечной деятельности, в том числе ишемия сердца и головного мозга, что может приводить, например к аритмии, стенокардии, острому инфаркту миокарда, синкопе.

Со стороны пищеварительного тракта. Часто: нарушения пищеварительного тракта (особенно в начале лечения), в том числе отсутствие аппетита, боль в

желудке, тошнота, рвота, диарея, запор. Очень редко: панкреатит.

Со стороны почек и мочевыводящих путей. Иногда: повышение концентрации креатинина и мочевины крови. У больных с нарушениями мочеиспускания повышенное образование мочи может привести к ее задержке и перерастяжению мочевого пузыря.

Со стороны печени и желчевыводящих путей. Часто: повышение концентрации некоторых печеночных ферментов (гамма-глутамил-транспептидазы) в крови.

Со стороны кожи и иммунной системы. Очень редко: аллергические реакции, например зуд, экзантема, фотосенсибилизация, тяжелые кожные реакции.

Со стороны крови. Очень редко: уменьшение количества тромбоцитов, эритроцитов и/или лейкоцитов.

Общие проявления. Часто: головная боль, головокружение, повышенная утомляемость, общая слабость (особенно в начале лечения). Иногда: сухость во рту, неприятные ощущения в конечностях (парестезии). Очень редко: нарушения зрения, звон в ушах, потеря слуха.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 ° С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 4 мл в ампуле, по 5 ампул в картонной пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ООО «ФАРМЕКС ГРУП».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 08301, Киевская обл., Г. Борисполь, ул. Шевченка, д. 100.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).