Инструкция по применению
Эспиро Таблетки покрытые пленочной оболочкой 50 мг 30 шт

Характеристики

Форма выпуска: Таблетки покрытые оболочкой
Страна: Польша
Производитель: Акрихин
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Эплеренон
Количество в упаковке: 30
Дозировка действующего вещества: 50 мг
Срок годности: 36.0



Действующее вещество

Эплеренон

Состав

эплеренон 50 мгВспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 77.34 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 30.76 мг, гипромеллоза 15cP - 2.5 мг, натрия лаурилсульфат - 1.7 мг, кроскармеллоза натрия - 6 мг, магния стеарат - 1.7 мг.Состав оболочки: опадрай II 33G32578 (желтый) - 8 мг (гипромеллоза 6cP (E464) - 3.2 мг, титана диоксид (E171) - 1.82 мг, лактозы моногидрат - 1.68 мг, макрогол 3350 - 0.64 мг, триацетин - 0.48 мг, краситель железа оксид желтый (E172) - 0.18 мг).

Форма выпуска

Таблетки покрытые оболочкой

Фармакокинетика

Калийсберегающий диуретик. Эплеренон обладает высокой селективностью в отношении минералокортикоидных рецепторов у человека в отличие от глюкокортикоидных, прогестероновых и андрогенных рецепторов и препятствует связыванию минералокортикоидных рецепторов с альдостероном - ключевым гормоном РААС, который участвует в регуляции АД и патогенезе сердечно-сосудистых заболеваний.Эплеренон вызывает стойкое увеличение активности ренина в плазме крови и альдостерона в сыворотке крови. Впоследствии, секреция ренина подавляется альдостероном по механизму обратной связи. При этом повышение активности ренина или концентрации циркулирующего альдостерона не влияет на эффекты эплеренона. Существенного влияния эплеренона на ЧСС, длительность интервалов QRS, PR или QT не выявлено у здоровых добровольцев.

Показания

- инфаркт миокарда: в дополнение к стандартной терапии с целью снижения риска сердечно-сосудистой смертности и заболеваемости у пациентов со стабильной дисфункцией левого желудочка (фракция выброса менее 40%) и клиническими признаками сердечной недостаточности после перенесенного инфаркта миокарда;- хроническая сердечная недостаточность: в дополнение к стандартной терапии с целью снижения сердечно-сосудистой смертности и заболеваемости у пациентов с хронической сердечной недостаточностью II функционального класса по классификации NYHA при сниженной фракции выброса левого желудочка (меньше35%).

Способ применения и дозы

Препарат назначают внутрь, независимо от приема пищи.Инфаркт миокардаЛечение следует начинать с дозы 25 мг 1 раз/сут и увеличивать ее до 50 мг 1 раз/сут через 4 недели с учетом концентрации калия в сыворотке крови (см. таблицу 1). Рекомендуемая поддерживающая доза препарата Эспиро составляет 50 мг 1 раз/сут. После временного прекращения приема препарата Эспиро в связи с повышением концентрации калия в сыворотке крови до 6 ммоль/л и более, терапию препаратом Эспиро можно возобновить в дозе 25 мг через день, когда концентрация калия в сыворотке крови составит меньше5 ммоль/л.Концентрацию калия в сыворотке крови следует определять до назначения препарата Эспиро, в течение первой недели и через 1 месяц после начала терапии или при изменении дозы препарата. В дальнейшем также необходимо периодически контролировать концентрацию калия в сыворотке крови.Коррекция начальной дозы у пациентов пожилого возраста не требуется. В связи с возрастным снижением функции почек у пожилых пациентов

повышается риск развития гиперкалиемии, особенно при наличии сопутствующих заболеваний, способствующих увеличению концентраций эплеренона в сыворотке крови, в частности, при нарушении функции печени от легкой до умеренной степени тяжести. Рекомендуется периодически определять концентрацию калия в сыворотке крови (см. таблицу 1).Коррекция начальной дозы у пациентов с нарушениями функции почек легкой степени не требуется. Степень гиперкалиемии увеличивается при ухудшении функции почек. Рекомендуется периодически определять концентрацию калия в сыворотке крови (см. таблицу 1). Эплеренон не удаляется при гемодиализе. У пациентов с нарушением функции почек тяжелой степени (КК меньше30 мл/мин) применение препарата противопоказано.У пациентов с хронической сердечной недостаточностью II функционального класса по классификации NYHA и нарушением функции почек средней степени тяжести (КК 30-60 мл/мин) следует начинать терапию с дозы 25 мг через день с последующей коррекцией дозы в зависимости от концентрации калия в сыворотке крови (см. таблицу 1).Опыта применения препарата Эспиро у пациентов с сердечной недостаточностью после перенесенного инфаркта миокарда и КК меньше50 мл/мин нет. Следует с осторожностью применять препарат Эспиро у таких пациентов.У пациентов с КК меньше50 мл/мин применение препарата Эспиро в дозе 25 мг 1 раз/сут не исследовалось.Коррекция начальной дозы у пациентов с нарушением функции печени от легкой до умеренной степени тяжести не требуется. Учитывая увеличение концентрации эплеренона у таких пациентов, рекомендуется регулярно контролировать концентрацию калия в сыворотке крови, особенно у пожилых пациентов. Применение препарата Эспиро у пациентов с нарушением функции печени тяжелой степени противопоказано.Сопутствующая терапияПри одновременном применении препаратов, оказывающих слабое или умеренно выраженное ингибирующее действие на CYP3A4, например, эритромицина, саквинавира, амиодарона, дилтиазема, верапамила и флуконазола, лечение препаратом Эспиро можно начать с дозы 25 мг 1 раз/сут.

Противопоказания

- клинически значимая гиперкалиемия;- концентрация калия в сыворотке крови в начале лечения более 5 ммоль/л;- умеренная или тяжелая почечная недостаточность (КК меньше30 мл/мин у пациентов с хронической сердечной недостаточностью II функционального класса по классификации NYHA);- печеночная недостаточность тяжелой степени (более 9 баллов по шкале Чайлд-Пью);- одновременный прием калийсберегающих диуретиков, препаратов калия или мощных ингибиторов CYP3A4, например, итраконазола, кетоконазола, ритонавира, нелфинавира, кларитромицина, телитромицина и нефазодона;- концентрация креатинина в плазме крови больше2 мг /дл (или больше177 ммоль/л) у мужчин или больше1.8 мг/дл (или больше159 ммоль/л) у женщин;- недостаточность лактазы, непереносимость лактозы, синдром мальабсорбции глюкозы-галактозы;- детский и подростковый возраст до 18 лет (опыта применения препарата у пациентов данной возрастной группы нет);- повышенная чувствительность к эплеренону или другим компонентам препарата.С осторожностью следует назначать препарат при сахарном диабете 2 типа и микроальбуминурии; одновременном применении эплеренона, ингибиторов АПФ или антагонистов рецепторов ангиотензина II, препаратов, содержащих литий, циклоспорина или такролимуса, дигоксина и варфарина в дозах, близких к максимальным терапевтическим; при нарушениях функции почек (КК меньше50 мл /мин); пациентам пожилого возраста.

Применение при беременности и кормлении грудью

Сведений о применении препарата у беременных женщин нет. При беременности препарат Эспиро следует назначать с осторожностью и только в тех случаях, когда ожидаемая польза для матери значительно превышает потенциальный риск для плода /ребенка.Сведений о выделении эплеренона с грудным молоком после приема внутрь нет. Возможные нежелательные эффекты эплеренона на новорожденных, находящихся на грудном вскармливании, неизвестны, поэтому целесообразно или прекратить кормление грудью, или отменить препарат, в зависимости от его важности для матери.

Побочные действия

Указанные ниже нежелательные эффекты приведены в соответствии со следующей градацией частоты их возникновения согласно классификации Всемирной организации здравоохранения: очень часто (≥10%); часто (≥1%, меньше10%); нечасто (≥0.1%, меньше1%); редко (≥0.01%, меньше0.1%); очень редко (меньше0.01%, включая отдельные сообщения); частота неизвестна (по имеющимся данным установить частоту возникновения не представляется возможным).Со стороны системы кроветворения: нечасто - эозинофилия.Со стороны эндокринной системы: нечасто - гипотиреоз.Со стороны обмена веществ и питания: часто - гиперкалиемия, гиперхолестеринемия, гипертриглицеридемия, дегидратация; нечасто - гипонатриемия.Психические нарушения: нечасто - бессонница.Со стороны нервной системы: часто - головокружение, обморок; нечасто - головная боль, гипестезия.Со стороны сердечно-сосудистой системы: частые - выраженное снижение АД, инфаркт миокарда; нечасто - фибрилляция предсердий, левожелудочковая недостаточность, тахикардия, ортостатическая гипотензия, тромбоз артерий нижних конечностей.Со стороны дыхательной системы: часто - кашель; нечасто - фарингит.Со стороны пищеварительной системы: часто - диарея, тошнота, запор; нечасто - метеоризм, рвота, холецистит.Со стороны кожи и подкожных тканей: часто - кожный зуд; нечасто - повышенная потливость.Со стороны костно-мышечной системы: часто - судороги икроножных мышц, мышечно-скелетные боли; нечасто - боль в спине.Со стороны мочевыделительной системы: часто - нарушение функции почек; нечасто - пиелонефрит.Аллергические реакции: нечасто - кожная сыпь; частота неизвестна - ангионевротический отек.Прочие: нечасто - астения, недомогание, гинекомастия. Лабораторные показатели: нечасто - повышение концентрации остаточного азота мочевины, креатинина, снижение экспрессии рецептора эпидермального фактора роста, повышение концентрации глюкозы в сыворотке крови.

Передозировка

Случаев передозировки эплеренона у человека не описано. Наиболее вероятными проявлениями передозировки могут быть чрезмерное снижение АД и гиперкалиемия. Лечение: при чрезмерном снижении АД необходимо назначить поддерживающее лечение. В случае развития гиперкалиемии показана стандартная терапия. Эплеренон не удаляется при гемодиализе. Установлено, что эплеренон активно связывается с активированным углем.

Взаимодействие с другими препаратами

ФармакодинамическоеВзаимодействиеКалийсберегающие диуретики и препараты калия: учитывая повышенный риск развития гиперкалиемии, эплеренон не следует

назначать пациентам, получающим калийсберегающие диуретики и препараты калия. Калийсберегающие диуретики могут усилить эффекты антигипертензивных препаратов и других диуретиков.Препараты, содержащие литий: взаимодействие эплеренона с препаратами лития не изучалось. Однако у пациентов, получавших препараты лития в сочетании с диуретиками и ингибиторами АПФ, описаны случаи повышения концентрации и интоксикации литием. Если подобная комбинация необходима, целесообразно контролировать концентрацию лития в плазме крови. Циклоспорин, такролимус: циклоспорин и такролимус могут вызвать нарушение функции почек и повысить риск развития гиперкалиемии. Следует избегать одновременного применения эплеренона и циклоспорина или такролимуса. Если во время лечения эплереноном потребуется назначение циклоспорина или такролимуса, рекомендуется регулярно контролировать концентрацию калия в сыворотке крови и функцию почек.НПВС: лечение НПВС может привести к острой почечной недостаточности за счет прямого подавления клубочковой фильтрации, особенно у пациентов группы риска (пожилые пациенты и/или пациенты с дегидратацией). При совместном применении этих средств до начала и во время лечения необходимо обеспечивать адекватный водный режим и контролировать функцию почек. Триметоприм: одновременное применение триметоприма с эплереноном повышает риск развития гиперкалиемии. Рекомендуется контролировать концентрацию калия в сыворотке крови и функцию почек, особенно у пациентов с почечной недостаточностью и у пожилых пациентов.Ингибиторы АПФ и антагонисты рецепторов ангиотензина II: при применении эплеренона с ингибиторами АПФ или антагонистами рецепторов ангиотензина II следует регулярно контролировать концентрацию калия в сыворотке крови. Подобная комбинация может привести к увеличению риска развития гиперкалиемии, особенно у пациентов с нарушением функции почек, в т.ч. у пожилых пациентов. Не следует применять тройную комбинацию ингибитора АПФ и АРАII с эплереноном.Альфа1-адреноблокаторы (празозин, альфузозин): при одновременном применении альфа1-адреноблокаторов с эплереноном может усилиться антигипертензивное действие и/или увеличиться риск развития ортостатической гипотензии, в связи с чем рекомендуется контролировать АД при перемене положения тела.Трициклические антидепрессанты, нейролептики, амифостин, баклофен: при одновременном применении этих средств с эплереноном может усилиться антигипертензивный эффект или увеличиться риск развития ортостатической гипотензии.Глюкокортикоиды, тетракозактид: одновременное применение этих средств с эплереноном может привести к задержке натрия и жидкости.Фармакокинетическое взаимодействиеИсследования in vitro свидетельствуют о том, что эплеренон не ингибирует изоферменты CYP1A2, CYP2C19, CYP2C9, CYP2D6 и CYP3A4. Эплеренон не является субстратом или ингибитором гликопротеина Р.Дигоксин: AUC дигоксина при одновременном применении с

эплереноном увеличивается на 16% (90% ДИ: 4-30%). Необходимо соблюдать осторожность, если дигоксин применяется в дозах, близких к максимальным терапевтическим.Варфарин: клинически значимого фармакокинетического взаимодействия с варфарином не выявлено. Необходимо соблюдать осторожность, если варфарин применяется в дозах, близких к максимальным терапевтическим. Субстраты CYP3A4: в специальных исследованиях признаков фармакокинетического взаимодействия эплеренона с субстратами CYP3A4, например, мидазоламом и цизапридом, выявлено не было.Ингибиторы CYP3A4:- мощные ингибиторы CYP3A4: при применении эплеренона со средствами, ингибирующими CYP3A4, возможно значимое фармакокинетическое взаимодействие. Мощный ингибитор CYP3A4 (кетоконазол 200 мг 2 раза/сут) вызывал увеличение AUC эплеренона на 441%. Одновременное применение эплеренона с мощными ингибиторами CYP3A4, такими как кетоконазол, итраконазол, ритонавир, нелфинавир, кларитромицин, телитромицин и нефазадон, противопоказано;- слабые и умеренные ингибиторы CYP3A4: одновременное применение с эритромицином, саквинавиром, амиодароном, дилтиаземом, верапамилом и флуконазолом сопровождалось значимым фармакокинетическим взаимодействием (степень увеличения AUC варьировала от 98% до 187%). При одновременном применении этих средств с эплереноном доза последнего не должна превышать 25 мг.Индукторы CYP3A4: одновременный прием препаратов, содержащих зверобой продырявленный (мощный индуктор CYP3A4), с эплереноном вызывал снижение AUC последнего на 30%. При применении более мощных индукторов CYP3A4, таких как рифампицин, возможно более выраженное снижение AUC эплеренона. Учитывая возможное снижение эффективности эплеренона, одновременное применение мощных индукторов CYP3A4 (рифампицина, карбамазепина, фенитоина, фенобарбитала, препаратов, содержащих зверобой продырявленный) не рекомендуется.Антациды: на основании фармакокинетического клинического исследования значительного взаимодействия антацидов с эплереноном при их одновременном применении не предполагается.

Особые указания

ГиперкалиемияПри лечении препаратом Эспиро может развиться гиперкалиемия, которая обусловлена его механизмом действия. В начале лечения и при изменении дозы препарата у всех пациентов следует контролировать концентрацию калия в сыворотке крови. В дальнейшем периодический контроль содержания калия рекомендуется проводить у пациентов с повышенным риском развития гиперкалиемии, например, у пожилых пациентов, пациентов с почечной недостаточностью и сахарным диабетом. Учитывая повышенный риск развития гиперкалиемии, назначение препаратов калия после начала лечения препаратом Эспиро не рекомендуется. Снижение дозы препарата Эспиро приводит к снижению концентрации калия в сыворотке крови. В одном исследовании добавление гидрохлоротиазида к эплеренону препятствовало увеличению концентрации калия в сыворотке крови.Нарушение функции почекУ пациентов с нарушением функции почек, в т.ч. диабетической микроальбуминурией, рекомендуется регулярно контролировать концентрацию калия в сыворотке крови. Риск развития гиперкалиемии увеличивается при снижении функции почек. Хотя число пациентов с сахарным диабетом 2 типа и микроальбуминурией в исследованиях было ограниченным, тем не менее, в этой небольшой выборке было отмечено увеличение частоты гиперкалиемии. В связи с этим у таких пациентов лечение следует проводить с осторожностью. Эплеренон не удаляется при гемодиализе. Применение препарата Эспиро противопоказано при почечной недостаточности тяжелой степени.Нарушение функции печениУ пациентов с легким или умеренным нарушением функции печени (5-6 и 7-9 баллов по шкале Чайлд-Пью) увеличения концентрации калия в сыворотке крови более 5.5 ммоль/л выявлено не было. У таких пациентов следует контролировать содержание электролитов. У пациентов с тяжелым нарушением функции печени эплеренон не изучался, поэтому его применение противопоказано. Индукторы CYP3A4Одновременное применение препарата Эспиро с мощными индукторами CYP3A4 не рекомендуется.Циклоспорин, такролимус, препараты, содержащие литийВо время лечения препаратом Эспиро следует избегать назначения этих средств.ЛактозаТаблетки содержат лактозу, поэтому их не следует назначать пациентам с редкими наследственными заболеваниями, такими как непереносимость лактозы, недостаточность лактазы и синдром мальабсорбции глюкозы-галактозы. Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмамиВлияние препарата Эспиро на способность управлять автотранспортом или пользоваться сложной техникой не изучалось. Однако, учитывая возможность препарата вызывать головокружение и обморочные состояния, следует соблюдать осторожность при управлении автотранспортными средствами или использовании сложной техники на фоне приема препарата Эспиро.

Условия хранения

В сухом месте