

Фуросемид

раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Состав

1 мл раствора содержит активного вещества фуросемида - 10 мг; вспомогательные вещества: раствор натрия едкого 1 М, натрия хлорид, вода для инъекций.

Описание - Прозрачная бесцветная или слегка окрашенная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа - диуретическое средство

Фармакодинамика:

быстродействующий диуретик с выраженным мочегонным эффектом. Нарушает реабсорбцию ионов натрия, хлора в толстом сегменте восходящей петли Генле. Фуросемид оказывает выраженное диуретическое, натрийуретическое, хлоруретическое действие. Кроме того, увеличивает выведение ионов калия, кальция, магния.

При сердечной недостаточности быстро приводит к снижению преднагрузки на сердце посредством расширения крупных вен. Оказывает гипотензивное действие вследствие увеличения выведения натрия хлорида и снижения реакции гладкой мускулатуры сосудов на вазоконстрикторные воздействия, и в результате уменьшения объема циркулирующей крови.

При внутривенном введении действие фуросемида развивается через 15-20 минут и достигает максимума к концу первого часа; диуретический эффект продолжается в течение 3 часов, при сниженной функции почек - до 8 ч.

В период действия выведение ионов натрия значительно возрастает, однако после его прекращения скорость выведения уменьшается ниже исходного уровня (синдром "рикошета" или "отмены"). Феномен обусловлен резкой активацией ренин-ангиотензинового и других антинатрийуретических нейрогуморальных звеньев регуляции в ответ на массивный диурез.

Фармакокинетика:

время достижения максимальной концентрации при внутривенном введении - 30 мин. Относительный объем распределения - 0,2 л/кг. Фуросемид на 98 % связывается с белками плазмы крови, в основном, с альбуминами. Проникает через плацентарный барьер, выделяется с грудным молоком.

Метаболизируется в печени с образованием 4-хлор-5-сульфамоил-антраниловой кислоты. Секретируется в просвет почечных канальцев через существующую в проксимальном отделе нефрона систему транспорта анионов. Период полувыведения фуросемида после внутривенного введения составляет от 0,5 до 1 ч. Биодоступность - 60-70 %. Выводится преимущественно (88 %) почками в неизменном виде и в виде метаболитов; через кишечник - 12 %. Клиренс - 1,5-3 мл/мин/кг. При почечной недостаточности выведение фуросемида замедляется, а

период полувыведения увеличивается; при выраженной почечной недостаточности конечный период полувыведения может увеличиваться до 24 ч.

При гемодиализе и перитонеальном диализе фуросемид выводится незначительно.

При печеночной недостаточности период полувыведения фуросемида увеличивается на 30-90 %, главным образом, вследствие увеличения объема распределения. Фармакокинетические показатели у этой категории пациентов могут сильно варьировать.

При хронической сердечной недостаточности, тяжелой степени артериальной гипертензии и у пациентов пожилого возраста выведение фуросемида замедляется вследствие снижения функции почек.

После внутривенного введения фуросемида новорожденным малой массы диуретический эффект начинает развиваться через 15-20 мин, достигает максимума через 1-2 ч, а возвращение объема мочи к исходному наблюдается через 6-16 ч.

Повторное введение фуросемида в полной дозе детям раннего возраста не рекомендуется производить раньше, чем через 24 ч, а у недоношенных детей интервал лучше увеличить до 48 ч.

Показания:

Отечный синдром различного генеза (при хронической сердечной недостаточности, циррозе печени (синдром портальной гипертензии); отечный синдром почечного генеза (при нефротическом синдроме на первом плане стоит лечение основного заболевания), острая сердечная недостаточность, особенно при отеке легких (применяется в сочетании с другими лечебными мероприятиями); отек головного мозга; тяжелые формы артериальной гипертензии; гипертонический криз; проведение форсированного диуреза при отравлениях химическими соединениями, выводящимися почками в неизменном виде.

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к фуросемиду, острый гломерулонефрит, острая почечная недостаточность с анурией (величина клубочковой фильтрации менее 3-5 мл/мин), тяжелая печеночная недостаточность, печеночная кома и прекома, стеноз мочеиспускательного канала, обструкция мочевыводящих путей камнем, прекоматозные состояния, гипергликемическая кома, гиперурикемия, подагра, декомпенсированный митральный или аортальный стеноз, повышение центрального венозного давления (свыше 10 мм рт. ст.), идиопатический гипертрофический субаортальный стеноз, артериальная гипотензия, острый инфаркт миокарда, панкреатит, нарушение водноэлектролитного обмена и кислотно-щелочного равновесия (гипокалиемия, алкалоз, гиповолемия, гипонатриемия, гипохлоремия, гипокальциемия, гипомагниемия), дигиталисная интоксикация.

С осторожностью:

При состояниях, при которых чрезмерное снижение артериального давления является особенно опасным (стенозирующие поражения коронарных и/или мозговых

артерий); при остром инфаркте миокарда (увеличивается риск развития кардиогенного шока); при нарушении оттока мочи (доброкачественная гиперплазия предстательной железы, сужение мочеиспускательного канала или гидронефроз); при гипопротеинемии (риск развития ототоксичности); при сахарном диабете (снижение толерантности к глюкозе); при системной красной волчанке.

Одновременное применение респиридона с фуросемидом у пожилых пациентов на фоне цереброваскулярной деменции, ассоциировалось с высокой смертностью. При применении фуросемида у недоношенных грудных детей возможно развитие нефрокальциноза/нефролитиаза и тромбофлебита. В связи с этим необходимо провести мониторинг функции почек и выполнить ультрасонографию почек.

Беременность и лактация:

Фуросемид проникает через плацентарный барьер, поэтому препарат не должен назначаться при беременности. Если по жизненным показаниям фуросемид назначается беременным, то необходимо тщательное наблюдение за состоянием плода.

При необходимости применения препарата в период лактации на время лечения следует прекратить грудное вскармливание, так как фуросемид секретируется с грудным молоком, а также может подавлять лактацию.

Способ применения и дозы:

Фуросемид назначают внутривенно (медленно струйно), при невозможности - внутримышечно (эффективность значительно ниже) в течение 7-10 дней и более. Дозу подбирают индивидуально. Рекомендуется применять наименьшие дозы препарата, достаточные для достижения необходимого терапевтического эффекта.

Внутривенное введение фуросемида проводится тогда, когда прием препарата внутрь невозможен или имеется нарушение всасывания препарата в тонком кишечнике или в urgentных ситуациях, либо при выраженном отежном синдроме.

Препарат вводят в дозах 20-60 мг 1-2 раза в сутки; при отсутствии диуретического ответа каждые 2 ч вводят в увеличенной на 50 % дозе до достижения адекватного диуреза. Средняя суточная доза для внутривенного введения у детей - 1 мг/кг массы тела, но не более 20 мг/сут.

Максимальная суточная доза фуросемида у взрослых - 1500 мг/сут, скорость введения не должна превышать 4 мг/мин, а у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью - не более 2,5 мг/мин.

После наступления необходимого эффекта переходят на прием препарата внутрь.

Побочные эффекты:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение артериального давления (АД), коллапс, тахикардия, аритмия, снижение объема циркулирующей крови, тромбофлебит, ортостатическая гипотензия.

Со стороны нервной системы: головокружение, головная боль, мышечная слабость, судороги икроножных мышц (тетания), парестезии, апатия, адинамия, слабость, вялость, сонливость, спутанность сознания.

Со стороны органов чувств: нарушения зрения и слуха.

Со стороны желудочно-кишечного тракта, печени: анорексия, сухость во рту, жажда, тошнота, рвота, диарея или запор, холестатическая желтуха, панкреатит (обострение)

Со стороны мочеполовой системы: олигурия, острая задержка мочи (у больных с аденомой предстательной железы), интерстициальный нефрит, гематурия, импотенция, кальциноз почек у недоношенных детей.

Аллергические реакции: пурпура, крапивница, эксфолиативный дерматит, мультиформная эритема, васкулит, некротизирующий ангиит, кожный зуд, озноб, лихорадка, фотосенсибилизация, анафилактический шок.

Со стороны органов кроветворения: лейкопения, тромбоцитопения, агранулоцитоз, апластическая анемия.

Со стороны водно-электролитного обмена: гиповолемия, дегидратация (риск развития тромбоза и тромбоэмболии), гипокалиемия, гипонатриемия, гипохлоремия, гипокальциемия, гипомагниемия, метаболический алкалоз.

Лабораторные показатели: гипергликемия, гиперхолестеринемия, гиперурикемия, глюкозурия, гиперкальциурия.

Передозировка:

Симптомы: снижение АД, коллапс, шок, гиповолемия, дегидратация, гемоконцентрация, аритмии (в т.ч. атриовентрикулярная блокада, фибрилляция желудочков), острая почечная недостаточность с анурией, тромбоз, тромбоэмболия, сонливость, спутанность сознания, вялый паралич, апатия.

Лечение: коррекция водно-солевого баланса и кислотно-основного состояния, восполнение объема циркулирующей крови, симптоматическое лечение. Специфического антидота нет.

Взаимодействие:

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 лекарственных средств, аллопуринола.

Прессорные амины и фуросемид взаимно снижают эффективность.

Лекарственные средства, блокирующие кальциевую секрецию, повышают концентрацию фуросемида в сыворотке крови.

При одновременном применении глюкокортикостероидов, амфотерицина В повышается риск развития гипокалиемии, с сердечными гликозидами - возрастает риск развития дигиталисной интоксикации вследствие гипокалиемии (для высоко- и низкополярных) и удлинения периода полувыведения (для низкополярных).

Снижает почечный клиренс препаратов лития и повышает вероятность развития интоксикации.

Иестероидные противовоспалительные препараты, сукральфат снижают диуретический эффект вследствие ингибирования синтеза простагландина, нарушения уровня ренина в плазме крови и выведения альдостерона.

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

Одновременный прием больших доз салицилатов на фоне терапии фуросемидом увеличивает риск проявления их токсичности (вследствие конкурентного почечного выведения).

Внутривенно вводимый фуросемид имеет слегка щелочную реакцию, поэтому его нельзя смешивать с лекарственными препаратами с pH менее 5,5.

Особые указания:

На фоне курсового лечения необходимо периодически контролировать артериальное давление, содержание электролитов плазмы крови, кислотно-основного состояния, остаточного азота, креатинина, мочевой кислоты, функции печени и проводить, при необходимости, соответствующую коррекцию лечения (с большей кратностью у больных с частыми рвотами и на фоне парентерально вводимых жидкостей).

Пациенты с повышенной чувствительностью к сульфаниламидам и производным сульфонилмочевины могут иметь перекрестную чувствительность к фуросемиду.

Больным, получающим высокие дозы фуросемида, во избежание развития гипонатриемии и метаболического алкалоза нецелесообразно ограничивать потребление поваренной соли.

Для профилактики гипокалиемии рекомендуется одновременное назначение препаратов калия и калийсберегающих диуретиков (прежде всего спиронолактона), а также придерживаться диеты, богатой калием.

Повышенный риск развития нарушений водно-электролитного баланса отмечается у больных с почечной недостаточностью.

Подбор режима дозирования больным с асцитом на фоне цирроза печени нужно проводить в стационарных условиях (нарушения водно-электролитного баланса могут повлечь развитие печеночной комы).

Данной категории больных показан регулярный контроль за содержанием электролитов плазмы крови.

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

Выделяется с молоком у женщин в период лактации, в связи с чем, целесообразно прекращение кормления.

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

У больных в бессознательном состоянии, с аденомой предстательной железы, сужением мочеточников или гидронефрозом, необходим контроль за мочеотделением, в связи с возможностью острой задержки мочи.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами:

В период лечения необходимо воздерживаться от управления транспортными средствами и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска/дозировка:

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 10 мг/мл.