



Eplerenone 25 mg film-coated tablets
Eplerenone 50 mg film-coated tablets

Доверие за качествено бъдеще

Spironolacton Actavis®

Spironolactone 25 mg x 30 обвити таблетки

Утвърден във времето



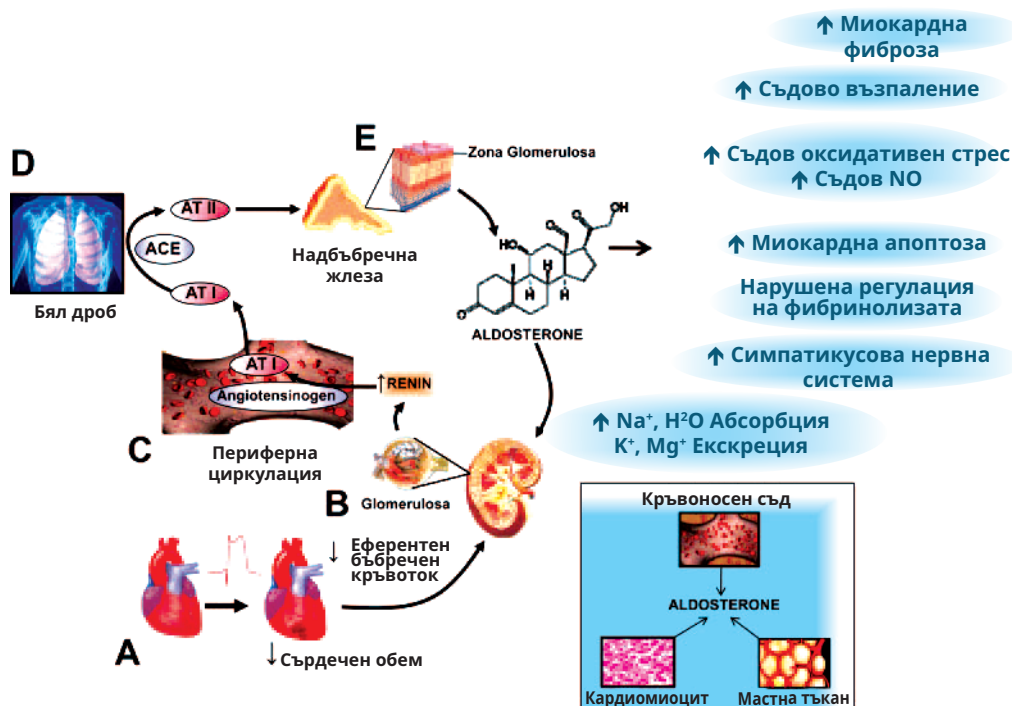
teva

Алдостерон- рецепторните антагонисти потискат негативните ефекти на алдостерон и заедно с намаляване на обемното обременяване водят до отлагане развитието на таргетни органи увреждания⁽¹⁾

Последствия от повишени нива на алдостерон⁽¹⁾

- ✓ Ендотелна дисфункция и нарушена съдова реактивност:
- ✓ Активиране на възпаление
- ✓ Нарушаване на фибринолизата чрез увеличаване експресия на плазминоген активатор инхибитор –1 (PAI-1)
- ✓ Активиране на симпатиковата нервна система
- ✓ Намаляване на барорецепторна чувствителност
- ✓ Увеличена електролитна екскреция (K⁺, Mg⁺)
- ✓ Апоптоза на кардиомиоцитите

Завишените нива на алдостерон водят до редица нежелани ефекти върху сърдечно-съдовата система⁽¹⁾



Ефект на намалената левокамерна функция върху алдостероновата синтеза.

A. Намаляване на сърдечния обем в резултат на ЛК (левокамерна функция) систолна дисфункция води до намаляване на еферентния бъбречен поток.
 B. Това стимулира секрецията на ренин от юктагломерулния апарат на бъбрека. C. В перифирената циркулация, ренина води до освобождаването на ангиотензин I (AT I), който се конвертира в ангиотензин II (AT II) от ангиотензин-гонвертиращия ензим (ACE) в съдовете на пулмоналното кръвообращение.(D).
 E. Ангиотензин II, стимулира клетките на зона гломерулоза в кората на надбъбрека и секрецията на алдостерон. Има наличие на екстадренална секреция на алдостерон в съдове, масна тъкан и миокарда(инсет). Завишените нива на алдостерон, водят до редица нежелани ефекти върху сърдечно-съдовата система.

Ключови фармакологични характеристики на Spironolactone и Eplerenone⁽¹⁾

Характеристики	Spironolactone	Eplerenone
Клинични индикации	Сърдечна недостатъчност (NYHA клас III-IV) и ЛК систолна дисфункция	Сърдечна недостатъчност (NYHA клас III-IV) и ЛК систолна дисфункция
	Есенциална хипертония	Есенциална хипертония*
	Първичен хипералдостеронизъм	
Афинитет на свързване с рецептора (aldosteron=1)	1.1 x10 ⁻¹	5.1x 10 ⁻³
Кръстосана реактивност със стероидните рецептори	ДА	Минимални
Метаболизъм	Хепатален	Цитохром Р450, изоензим СYP3A4
Допълнителен метаболизъм осигуряващ ефекта	ДА	НЕ
Плазмен полуживот (часове)	1.4	4.6
Екскреция	Бъбреци и жлъчен мехур	Бъбреци и гастроинтестинален тракт
Прием	Заедно с храна за максимална абсорбция	Не зависи от прием на храна
Препоръчителна доза, mg/ден	Артериална хипертония - 50-100; Сърдечна недостатъчност - 25-200	Артериална хипертония - 50-100; Сърдечна недостатъчност - 25-50
Лекарствени взаимодействия	Потенциращи хиперкалиемия	Потенциращи хиперкалиемия
	АСЕ-инхибитори	АСЕ-инхибитори
	НСПВС	НСПВС
	Потенциращи хипотония	СYP3A4 инхибитор-увеличават нивата на eplerenone: itraconazole, ribonavir, clarithromycin
	Наркотични вещества Увеличават нивата на digoxin	СYP3A4 индуктори намаляват нивата на eplerenone-Жълт кантарион
Странични ефекти	Хиперкалиемия	Хиперкалиемия
	Гинекомастия, болки в гърдите	Абдоминални болки, диария
	Еректилна дисфункция	
	Дисменорея, аменорея	

* Индикации на Carditrust в България.⁽³⁾

Като допълнение към стандартна терапия, включваща бета-блокери, за намаляване на риска от сърдечно-съдова смъртност и заболяемост при пациенти в стабилизирано състояние с левокамерна дисфункция (LVEF ≤ 40%) и клинични доказателства за сърдечна недостатъчност след наскоро прекаран инфаркт на миокарда

Като допълнение към стандартна оптимална терапия, за намаляване на риска от сърдечно-съдова смъртност и заболяемост при възрастни пациенти със сърдечна недостатъчност клас II (хронична) по New York Heart Association (NYHA) и левокамерна систолна дисфункция (LVEF ≤30%)

Лекарствени дози в ключови рандомизирани изпитвания доказано повлияли болестта при сърдечната недостатъчност с понижена изтласкваща фракция (или след миокарден инфаркт)⁽²⁾

	Начална доза (mg)	Таргетна доза (mg)
АСЕ-I		
Каптоприл ^a	6.25 t.i.d.	50 t.i.d.
Еналаприл	2.5 b.i.d.	10–20 b.i.d.
Лизиноприл ^b	2.5–5.0 o.d.	20–35 o.d.
Рамиприл	2.5 o.d.	10 o.d.
Трандолаприл ^a	0.5 o.d.	4 o.d.
Бета-блокери		
Бизопролол	1.25 o.d.	10 o.d.
Карведилол	3.125 b.i.d.	25 b.i.d.
Метопролол сукцинат (CR/XL)	12.5–25 o.d.	200 o.d.
Небиволол ^c	1.25 o.d.	10 o.d.
ARBs		
Кандесартан	4–8 o.d.	32 o.d.
Валсартан	40 b.i.d.	160 b.i.d.
Лосартан ^{b,c}	50 o.d.	150 o.d.
MRAs		
Еплеренон	25 o.d.	50 o.d.
Спиронолактон	25 o.d.	50 o.d.
ARNI		
Сакубитрил/валсартан	49/51 b.i.d.	97/103 b.i.d.
If-канални блокери		
Ивабрадин	5 b.i.d.	7.5 b.i.d.

^a Обозначава АСЕ-I, за който таргетната доза е взета от изпитвания след миокарден инфаркт.

^b Обозначава лекарства, при които е показано, че по-висока доза намалява морбидността/смъртността в сравнение с по-ниска доза от същото лекарство, но няма голямо рандомизирано плацебо-контролирано изпитване и оптималната доза не е окончателно уточнена.

^c Обозначава лечение, за което не е показано че намалява сърдечно-съдовата или общата смъртност при пациенти със сърдечна недостатъчност (или е показано, че не е по-малостойно от лечение, с което се постига такъв ефект).

^d Максимална доза 50 mg два пъти дневно може да се приложи при пациенти с телесно тегло над 85 kg.

АСЕ = ангиотензин-конвертиращ ензим; ARB = ангиотензин-рецепторен блокери; ARNI = ангиотензин-рецепторен неприлизинов инхибитор; b.i.d. = bis in die (два пъти дневно); MRA = минералкортикоидрецепторен антагонист; o.d. = omne in die (веднъж дневно); t.i.d. = ter in die (три пъти дневно).

1. Aldosterone Receptor Antagonists Effective but Often Forgotten Bradley A. Maron, MD; Jane A. Leopold, MD. *Ahajournals.org* by on March 15, 2019

2. *European Heart Journal* (2016) 37, 2129–2200

3. КХП Carditrust

Отпуска се по лекарско предписание.

КХП Carditrust 25 mg, 50 mg - 20.10.2020

КХП Spironolacton Actavis - 01.07.2020

За допълнителна информация

Тева Фарма ЕАД

ул. Люба Величкова № 9, гр. София 1407, България

Тел.: +359 (2) 489 95 85, Факс: +359 (2) 489 95 86

IAL: 54454/10.12.2020



Eplerenone 25 mg film-coated tablets
Eplerenone 50 mg film-coated tablets

