

Edema em crianças

A dose diária inicial é de aproximadamente 3,3 mg por Kg de peso administrada em dose fracionada. A dosagem deverá ser ajustada com base na resposta e tolerabilidade do paciente. Se necessário pode ser preparada uma suspensão triturando os comprimidos de espironolactona com algumas gotas de glicerina e acrescentando líquido com sabor. Tal suspensão é estável por um mês quando mantida em local refrigerado.

Diagnóstico e tratamento do aldosteronismo primário

A espironolactona pode ser empregada como uma medida diagnóstica inicial para estabelecer evidência de aldosteronismo primário enquanto o paciente estiver em dieta normal.

Teste a longo prazo

A espironolactona é administrada em uma dosagem diária de 400mg por 3 ou 4 semanas. Correção da hipopotassemia e da hipertensão revela evidência presuntiva para o diagnóstico de hiperaldosteronismo primário.

Teste de curto prazo

A espironolactona é administrada em uma dosagem diária de 400mg por 4 dias. Se o potássio sérico se eleva durante a administração de espironolactona, porém, diminui quando é descontinuado, o diagnóstico presuntivo de hiperaldosteronismo primário deve ser considerado. Quando o diagnóstico de hiperaldosteronismo for bem estabelecido por testes mais definitivos, espironolactona pode ser administrada em doses diárias de 100 a 400mg como preparação para a cirurgia. Para pacientes considerados não aptos para cirurgia, espironolactona pode ser empregada como terapia de manutenção a longo prazo, com o uso da menor dose efetiva individualizada para cada paciente.

Hipertensão maligna

Somente como terapia auxiliar e quando houver excesso de secreção de aldosterona, hipopotassemia e alcalose metabólica. A dose inicial é de 100mg/dia, aumentada quando necessário a intervalos de duas semanas para até 400mg/dia. A terapia inicial pode incluir também a combinação de outras drogas anti-hipertensivas à espironolactona. Não reduzir automaticamente a dose dos outros medicamentos como recomendado na hipertensão essencial.

Hipopotassemia/ hipomagnesemia

A dosagem de 25mg a 100mg por dia é útil no tratamento da hipopotassemia e/ou hipomagnesemia induzida por diuréticos, quando suplementos orais de potássio ou magnésio forem considerados inadequados.

SUPERDOSAGEM

Superdosagem aguda poderá ser manifestada por náusea, vômitos, sonolência, confusão mental, erupção cutânea maculopapular ou eritematosa ou diarreia. Podem ocorrer desequilíbrios eletrolíticos e desidratação. Deverão ser tomadas medidas sintomáticas e de suporte. Induzir o vômito ou realizar esvaziamento gástrico por lavagem. Não existe nenhum antídoto específico. Tratar a depleção dos fluidos, o desequilíbrio eletrolítico e a hipertensão através de procedimentos estabelecidos.

Hipopotassemia pode ser tratada pela rápida administração de glicose (20 a 50%) e insulina regular, usando 0,25 a 0,5 unidades de insulina por grama de glicose. Diuréticos excretadores de potássio e resinas de troca iônica podem ser administrados, de forma repetida, caso necessário. O uso de espironolactona deve ser descontinuado e a ingestão de potássio (incluindo fontes alimentares) restrita.

PACIENTES IDOSOS

Não foram descritos cuidados especiais em pacientes idosos quando do uso deste medicamento.

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA

Farm. Resp.:
Dr^a Maria Geisa P. de Lima e Silva
CRF-SP nº 8.082 - Reg. MS nº 1.0583.0285

Nature's Plus Farmacéutica Ltda.

Rodovia SP-101, km 08
Hortolândia/SP - CEP 13186-901
CNPJ: 45.992.062/0001-65
INDÚSTRIA BRASILEIRA

Fabricado por:

EMS S/A.
Rua Com. Carlo Mário Gardano, 450
S. B. do Campo/SP - CEP 09720-470

"Lote, fabricação e validade: vide cartucho"

 **0800-19194**
www.ems.com.br

087849

espironolactona



FORMA FARMACÉUTICA E APRESENTAÇÕES

Comprimidos de 25 mg embalagem de 15, 30, 60 e 450 comprimidos.
Comprimidos de 50 mg embalagem de 15, 30, 60, 450 e 500 comprimidos.
Comprimidos de 100 mg embalagem de 15, 16, 30, 60 e 450 comprimidos.

USO ADULTO E PEDIÁTRICO

USO ORAL

COMPOSIÇÃO

Cada comprimido de 25 mg contém:
espironolactona 25 mg
excipientes* qsp 1 com
* (sulfato de cálcio dihidratado, estearato de magnésio, povidona, amido).

Cada comprimido de 50 mg contém:
espironolactona 50 mg
excipientes* qsp 1 com
* (sulfato de cálcio dihidratado, estearato de magnésio, povidona, amido).

Cada comprimido de 100 mg contém:
espironolactona 100 mg
excipientes* qsp 1 com
* (sulfato de cálcio dihidratado, estearato de magnésio, povidona, amido).

INFORMAÇÕES AO PACIENTE

Ação esperada do medicamento: A espironolactona possui ação diurética, indicado para tratamento de hipertensão.

Cuidados de armazenamento: Manter à temperatura ambiente (15°C a 30°C). Proteger da luz e manter em lugar seco.

Prazo de validade: Verifique o prazo de validade na embalagem. Antes de usar observe o aspecto do medicamento. Nunca utilize medicamentos com prazo de validade vencido.

Gravidez e lactação: Informe seu médico a ocorrência de gravidez na vigência do tratamento ou após o seu término. Informe ao médico se está amamentando.

Cuidados de administração: Siga a orientação do seu médico, respeitando sempre os horários, as doses e a duração do tratamento.

Interrupção do tratamento: Não interromper o tratamento sem o conhecimento do seu médico. Os bons resultados do tratamento só serão alcançados se não houver interrupção do mesmo.

Reações adversas: Informar ao médico o aparecimento de reações, tais como náuseas, sonolência, tontura, cansaço, dor de cabeça, dor nos seios, mal-estar, urticária, febre, confusão mental, impotência, distúrbios menstruais. Informe seu médico o aparecimento de reações diferentes ou desagradáveis.

TODO MEDICAMENTO DEVE SER MANTIDO FORA DO ALCANCE DAS CRIANÇAS.

Ingestão concomitante com outras substâncias: A espironolactona pode interagir com outros medicamentos quando administrado concomitantemente, portanto, informe seu médico sobre outra medicação que estiver utilizando.

Contra-indicações e precauções: A espironolactona é contra-indicada a pacientes que apresentam hipersensibilidade a qualquer componente da fórmula.

Como espironolactona pode causar reações como sonolência e tontura, durante o tratamento o paciente não deve dirigir veículos, ou operar máquinas, pois sua habilidade e atenção podem estar prejudicadas.

Informe seu médico sobre qualquer medicamento que esteja usando, antes do início, ou durante o tratamento.

NÃO TOMAR MEDICAMENTO SEM O CONHECIMENTO DO SEU MÉDICO. PODE SER PERIGOSO PARA A SAÚDE.

INFORMAÇÕES TÉCNICAS

CARACTERÍSTICAS

A espironolactona é um pó branco ou amarelo claro e inodoro ou levemente com odor característico. É praticamente insolúvel em água e acetato de etila; livremente solúvel em clorofórmio; levemente solúvel em éter, álcool metílico e óleos fixos. Tem peso molecular de 416,57 e fórmula química de C₂₄H₃₂O₄S.

FARMACODINÂMICA

A espironolactona é um antagonista específico da aldosterona, atuando principalmente através da ligação competitiva nos receptores de troca de sódio e potássio aldosterona-dependente localizados no túbulo contornado renal distal. A espironolactona age como um diurético poupador de potássio causando aumento nas quantidades de sódio e água a serem excretadas enquanto o potássio e magnésio são conservados.

BU-1090 / LAETUS 156



FARMACOCINÉTICA

A espirolactona é extensivamente metabolizada no fígado com uma biodisponibilidade que excede 90%. A administração concomitante com alimento aumenta a biodisponibilidade da espirolactona, por aumentar a absorção e possivelmente diminuir o efeito de 1ª passagem da espirolactona.

Canrenone e 7- α - (tiometil) espirolactona são os principais metabólitos ativos. Tanto a espirolactona quanto o canrenone estão mais de 90% ligados às proteínas plasmáticas.

A espirolactona tem um início de ação diurética gradual com o efeito máximo sendo alcançado no 3º dia da terapia. A diurese continua por 2 ou 3 dias após o final da administração do mesmo.

Administrando 100 mg de espirolactona por dia durante 15 dias em voluntários sãos (metabolizadores lentos) o tempo para atingir o pico da concentração plasmática (T_{max}), pico da concentração plasmática (C_{max}), e meia vida de eliminação (T_{1/2}) para espirolactona é 2,6 horas, 80 ng/ml, e aproximadamente 1,4 horas, respectivamente. Para os metabólitos 7- α - (tiometil) espirolactona e o canrenone, T_{max} é 3,2 horas e 4,3 horas, C_{max} 391 ng/ml e 181 ng/ml, e T_{1/2} 13,8 horas e 16,5 horas, respectivamente.

A eliminação dos metabólitos ocorre principalmente através da urina e secundariamente através de excreção biliar nas fezes.

INDICAÇÕES

A espirolactona é indicada na hipertensão essencial, distúrbios edematosos, tais como: edema e ascite da insuficiência cardíaca congestiva; cirrose hepática; síndrome nefrótica; edema idiopático, como terapia auxiliar na hipertensão maligna; na hipopotassemia quando outras medidas forem impróprias ou inadequadas; profilaxia da hipopotassemia em pacientes tomando digitálicos ou quando outras medidas forem inadequadas ou impróprias. Diagnóstico e tratamento do aldosteronismo primário. Tratamento pré-operatório de pacientes com hiperaldosteronismo primário.

CONTRA-INDICAÇÕES

É contra- indicada na insuficiência renal aguda, diminuição significativa da função renal, anúria e hiperpotassemia, doença de Addison ou hipersensibilidade aos componentes da formulação.

PRECAUÇÕES E ADVERTÊNCIAS

Uma vez que a espirolactona é um diurético poupador de potássio, a administração de suplementos de potássio de outros agentes poupadores de potássio não é recomendável porque pode induzir à hiperpotassemia.

É aconselhável realizar uma periódica avaliação dos eletrólitos séricos, tendo em vista a possibilidade de hiperpotassemia, hiponatremia e uma possível elevação transitória da uréia plasmática especialmente em pacientes com distúrbios pré-existentes da função renal, para os quais a relação risco/benefício deve ser considerada. Acidose metabólica hiperclorêmica reversível, principalmente na associação com hiperpotassemia, tem sido relatada em alguns pacientes com cirrose hepática descompensada, mesmo quando a função renal é normal.

Uso durante a gravidez e lactação: A espirolactona e seus metabólitos podem atravessar a barreira placentária. Por esta razão, o uso de espirolactona em mulheres grávidas requer a avaliação de seus benefícios bem como dos riscos que possam acarretar à mãe ou ao feto.

O canrenone, um metabólito ativo da espirolactona, aparece no leite materno. Caso o uso de aldactone durante o período da amamentação for considerado essencial, um método alternativo de alimentação para a criança deve ser instituído.

Efeito na capacidade de dirigir e operar máquinas: Sonolência e vertigem ocorrem em alguns pacientes. É recomendada precaução ao dirigir ou operar máquinas até que a resposta inicial ao tratamento seja determinada.

Efeito mutagênico ou carcinogênico: Estudos feitos em animais demonstraram que a espirolactona pode produzir tumores em ratos quando administrada em altas doses durante longo período de tratamento. Estes tumores não foram observados em macacos quando administradas altas doses diárias durante mais de 52 semanas. Não há certeza do significado desses achados com respeito ao uso clínico. Tem se demonstrado que a disponibilidade e metabolismo da espirolactona em ratos são marcadamente diferentes do ser humano. A espirolactona não apresentou efeitos teratogênicos em camundongos. Os coelhos que receberam o medicamento apresentaram índice de contracepção reduzido, índice de reabsorção elevado e baixo número de nascimentos com vida. Não foram observados nenhum efeito embriotóxico em ratos quando administradas altas doses de espirolactona, mas foram reportadas hipoprolactinemia dose relacionada, diminuição ventral da próstata e do peso da vesícula seminal em machos, e aumento da secreção do hormônio luteinizante, peso uterino e ovariano, em fêmeas. Feminização da genitália externa de fetos machos, foram relatadas em outros estudos com ratos.

Em animais, incidência de leucose mielóide/dose dependente (acima de 20mg/Kg peso) foi observada em ratos alimentados com doses diárias de canrenoato de potássio por um período de um ano. A espirolactona é também metabolizada em canrenoato. Não foi observado aumento da incidência de leucose em estudos de toxicidade crônica em ratos com espirolactona em doses superiores a 500mg/Kg/dia. A dose de espirolactona recomendada em humanos é de 1,4 - 5,7mg/Kg/dia.

Nos estudos de carcinogenicidade por via oral a longo prazo (dois anos) do canrenoato de potássio, foram observados no rato: leucemia mielocítica, tumores hepáticos, tireoidianos, testiculares e mamários.

O canrenoato de potássio não produziu efeito mutagênico nos testes que empregaram bactérias e leveduras. Produziu efeito mutagênico positivo em vários testes *in vitro* em células de mamíferos após ativação do metabolismo.

Em uma experimentação *in vivo* efetuada em sistema de mamíferos, o canrenoato de potássio não foi mutagênico.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Têm sido relatados casos de hiperpotassemia severa em pacientes que fazem uso de diuréticos poupadores de potássio, incluindo espirolactona, e inibidores da ECA.

A espirolactona potencializa o efeito de outros diuréticos e anti-hipertensivos quando administrados concomitantemente. A dose dessas drogas deverá ser reduzida quando espirolactona for incluído ao tratamento.

Devem ser tomados cuidados com a administração em pacientes submetidos à anestesia enquanto estes estiverem sendo tratados com espirolactona, pois a mesma reduz a resposta vascular da norepinefrina.

A espirolactona tem demonstrado aumentar a meia vida da digoxina.

O ácido acetilsalicílico atenua o efeito diurético da espirolactona por bloquear a secreção do canrenone no túbulo renal. A indometacina e ácido mefenâmico têm mostrado inibir a secreção do canrenoato.

A espirolactona aumenta o metabolismo da antipirina.

A espirolactona poderá interferir na análise dos exames de concentração plasmática de digoxina.

Interação alimentar

A administração concomitante com alimento aumenta a biodisponibilidade da espirolactona, por aumentar a absorção e possivelmente diminuir o efeito de primeira passagem da espirolactona.

ALTERAÇÕES EM EXAMES LABORATORIAIS

Não existem dados na literatura que indiquem que espirolactona pode alterar exames laboratoriais.

REAÇÕES ADVERSAS/COLATERAIS

Ginecomastia pode se desenvolver em associação com o uso da espirolactona, e o médico deve estar alerta para sua possível instalação.

O desenvolvimento da ginecomastia tanto parece estar relacionado com a posologia como com a duração da terapêutica, e é normalmente reversível quando o uso de espirolactona é descontinuado. Em raras ocasiões, algum aumento das mamas pode persistir.

Dos efeitos adversos reportados em experiência pós-marketing com espirolactona, os seguintes foram relatados com frequência \geq 1%: distúrbios gastrointestinais, náusea, sonolência, tontura, febre hepática anormal, insuficiência renal aguda, trombocitopenia, leucopenia (incluindo agranulocitose), cansaço, dor de cabeça, erupção cutânea, alopecia, hipertricosose (crescimento de cabelo normal), dor e neoplasma nos seios, mal estar, hiperpotassemia, distúrbios eletrolíticos, alterações na libido, urticária, confusão mental, febre, ataxia, impotência, distúrbios menstruais. Tem sido observado carcinoma mamário em pacientes tomando espirolactona, todavia uma relação de causa e efeito não pôde ser estabelecida.

POSOLOGIA

Hipertensão essencial

Dose usual: 50 a 100mg por dia, que nos casos resistentes ou severos pode ser gradualmente aumentada em intervalos de duas semanas até 200mg/dia. A dose diária pode ser administrada em doses fracionadas ou em dose única.

O tratamento deve ser mantido por no mínimo duas semanas, visto que uma resposta adequada pode não ocorrer antes deste período de tempo. A dose deverá ser, posteriormente, reajustada de acordo com a resposta do paciente.

Doenças acompanhadas por edema

A dose diária pode ser administrada tanto em doses fracionadas como em dose única.

Insuficiência cardíaca congestiva

Dose usual: 100mg/dia. Em casos resistentes ou severos, a dosagem pode ser gradualmente aumentada até 200mg/dia. Quando o edema estiver controlado, a dose habitual de manutenção deve ser determinada para cada paciente.

Cirrose hepática

Se a relação urinária sódio/potássio (Na⁺ / K⁻) for maior que 1 (um), a dose usual é de 100mg/dia. Se esta relação for menor do que 1 (um), a dose recomendada é de 200 a 400mg/dia. A dose de manutenção deve ser determinada para cada paciente.

Síndrome nefrótica

Habitualmente 100 a 200mg/dia. A espirolactona não é medicamento antiinflamatório, não tendo sido demonstrado afetar o processo patológico básico, e seu uso é aconselhado somente se os glicocorticóides isoladamente administrados não forem suficientemente eficazes.

Edema idiopático

A dose habitual é de 100mg por dia.



APROVAÇÃO DE ARTE FINAL	
ÁREA	DATA
Desenv. Embalagem	_____
Depto. Marketing	_____
Desenv. Galênico	_____
Registro de Produto	_____
Desenv. Visto	_____

