Espironolactona

Laboratório
Ems
Referência
ALDACTONE
Apresentação de **Espironolactona**
Comprimidos de 25 mg embalagem de 15, 30, e 450 comprimidos.
Comprimidos de 50 mg embalagem de 15, 30, 450 e 500 comprimidos.
Comprimidos de 100 mg embalagem de 15, 16, 30, 450 comprimidos.
Embalagens Fracionáveis: 60 e 90 comprimidos para as concentrações de 25 mg, 50 mg e 100 mg.
Embalagem Hospitalar: 75 comprimidos para as concentrações de 25 mg, 50 mg e 100 mg

USO ADULTO E PEDIATRICO
USO ORAL

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

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

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

Espironolactona - Indicações
A **Espironolactona** é indicado 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 consideradas 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 de **Espironolactona**
É contraindicado na insuficiência renal aguda, diminuição significativa da função renal, anúria e hiperpotassemia, doença de Addison ou hipersensibilidade aos componentes da formulação.
Advertências
Uma vez que a **Espironolactona** é um diurético poupador de potássio, a administração de suplementos de potássio ou 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 ureia 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 **Espironolactona** e seus metabólitos podem atravessar a barreira placentária. Por esta razão, o uso de **Espironolactona** 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 **Espironolactona**, aparece no leite materno. Caso o uso de**Espironolactona** 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 **Espironolactona** 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 **Espironolactona** em ratos são marcadamente diferentes do ser humano.
A **Espironolactona** 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 foi observado nenhum efeito embriotóxico em ratos quando administradas altas doses de **Espironolactona**, 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 mieloide/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**Espironolactona** é também metabolizada em canrenoato. Não foi observado aumento da incidência de leucose em estudos de toxicidade crônica em ratos com **Espironolactona** em doses superiores a 500mg/Kg/dia. A dose de **Espironolactona** 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 de **Espironolactona**

Têm sido relatados casos de hiperpotassemia severa em pacientes que fazem uso de diuréticos poupadores de potássio, incluindo **Espironolactona**, e inibidores da eca.
A **Espironolactona** potencializa o efeito de outros diuréticos e anti-hipertensivos quando administrados concomitantemente. A dose dessas drogas deverá ser reduzida quando a **Espironolactona** for incluído ao tratamento.
Devem ser tomados cuidados com a administração em pacientes submetidos à anestesia enquanto estes estiverem sendo tratados com **Espironolactona**, pois a mesma reduz a resposta vascular da norepinefrina.
A **Espironolactona** tem demostrado aumentar a meia vida da digoxina.
O ácido acetilsalicílico atenua o efeito diurético da **Espironolactona** por bloquear a secreção do canrenone no túbulo renal. Indometacina e ácido mefenâmico têm mostrado inibir a secreção do canrenoato.
A **Espironolactona** aumenta o metabolismo da antipirina.
A **Espironolactona** poderá interferir na análise dos exames de concentração plasmática de digoxina.

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

ALTERAÇÕES EM EXAMES LABORATORIAIS
Não existem dados na literatura que indiquem que **Espironolactona** pode alterar exames laboratoriais.

Reações adversas / Efeitos colaterais de **Espironolactona**

Ginecomastia pode se desenvolver em associação ao uso da **Espironolactona**, e o médico deve estar alerta para sua possível instalação.
O desenvolvimento da ginecomastia tanto parece estar relacionado com a posologia como com à duração da terapêutica, e é normalmente reversível quando o uso de **Espironolactona** é descontinuado. Em raras ocasiões, algum aumento das mamas pode persistir.
Dos efeitos adversos reportados em experiência pós-marketing com **Espironolactona**, os seguintes foram relatados com frequência 1% : distúrbios gastrintestinais, náusea, sonolência, tontura, função hepática anormal, insuficiência renal aguda, trombocitopenia, leucopenia (incluindo agranulocitose), cansaço, dor de cabeça, erupção cutânea, alopecia, hipertricose (crescimento de cabelo anormal), 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 **Espironolactona**, todavia uma relação de

causa e efeito não pôde ser estabelecida.

Espironolactona - 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 **Espironolactona** não é medicamento anti-inflamatório, não tendo sido demonstrado afetar o processo patológico básico, e seu uso é aconselhado somente se os glicocorticoides isoladamente administrados não forem suficientemente eficazes.

Edema idiopático
A dose habitual é de 100mg por dia.

Edema em crianças
A dose diária inicial é de aproximadamente 3,3mg 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 empregado 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 administrado 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 administrado 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 administrado em doses diárias de 100 a 400mg como preparação para a cirurgia. Para pacientes considerados não aptos para cirurgia, **Espironolactona** pode ser empregado 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 fluídos, o desequilíbrio eletrolítico e a hipotensão através de procedimentos estabelecidos.
Hiperpotassemia 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 excretores 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.

Características farmacológicas

FARMACODINAMICA
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.

FARMACOCINETICA
A **Espironolactona** é extensivamente metabolizado no fígado com uma biodisponibilidade que excede 90%. A administração concomitante com alimento aumenta a biodisponibilidade da **Espironolactona**, por aumentar a absorção e possivelmente diminuir o efeito de 1ª passagem da **Espironolactona**.
Canrenone e 7-a-(tiometil) **Espironolactona** são os principais metabólitos ativos.
Tanto a **Espironolactona** quanto o canrenone estão mais de 90% ligados às proteínas plasmáticas.
A **Espironolactona** 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 **Espironolactona** por dia durante 15 dias em voluntários sãos (metabolizadores lentos) o tempo para atingir o pico da concentração plasmática (Tmáx), pico da concentração plasmática (Cmáx), e meia vida de eliminação (T1/2) para **Espironolactona** é 2,6 horas, 80 ng/ml, e aproximadamente 1,4 horas, respectivamente. Para os metabólitos 7-a-(tiometil) **Espironolactona**e o canrenone, Tmáx é 3,2 horas e 4,3 horas, Cmáx 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.

Uso em idosos, crianças e em outros grupos de risco

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

Espironolactona - Informações

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 metilico e óleos fixos. Tem peso molecular de 416,57 e fórmula química de C24H32O4S.

Dizeres legais

VENDA SOB A PRESCRIÇÃO MÉDICA
Registro M.S. nº 1.0235.0632
Farm. Resp.: Dra. Erika Santos Martins
CRF-SP nº 37.386

EMS S/A
Rua Comendador Carlo Mário Gardano, 450
S. B. do Campo/SP – CEP 09720-470
CNPJ: 57.507.378/0001-01
Indústria Brasileira
“Lote, Fabricação e Validade: vide cartucho”

Espironolactona - Bula para o Paciente

Ação esperada do medicamento: **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. 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: **Espironolactona** pode interagir com outros medicamentos quando administrado concomitantemente, portanto, informe seu médico sobre outra medicação que estiver utilizando.

Contraindicações e precauções: **Espironolactona** é contraindicado 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 TOME MEDICAMENTO SEM O CONHECIMENTO DO SEU MÉDICO. PODE SER PERIGOSO PARA A SAÚDE.

Data da bula

23/07/2013