

VIVITAR 3,5,6

Tabletas

(Espironolactona)

FORMA FARMACÉUTICA Y FORMULACIÓN:

Cada TABLETA contiene:

Espironolactona.....25 mg y 100 mg

Excipiente, c.b.p. 1 tableta.

INDICACIONES TERAPÉUTICAS: VIVITAR está indicado en el tratamiento y prevención de la insuficiencia cardíaca y sus complicaciones. Como coadyuvante en el tratamiento de la hipertensión arterial e isquemia. Prevención de los efectos de remodelación cardiovascular presentes en la hipertensión arterial y en el infarto del miocardio.

Coadyuvante en el tratamiento del síndrome metabólico. También está indicado en el tratamiento del edema refractario asociado a insuficiencia cardíaca, insuficiencia renal secundaria a daño vascular y en ascitis asociada a neoplasias malignas.

En el tratamiento del hiperaldosteronismo primario, síndrome de Bartter, síndrome premenstrual.

Tratamiento del hirsutismo presente en el síndrome de ovario poliquístico.

MECANISMO DE ACCIÓN DE LA ESPIRONOLACTONA:

Efecto antihipertensivo y balance de líquidos: Se ha comprobado que la espironolactona es capaz de producir un descenso tensional en pacientes hipertensos; el descenso es de una intensidad semejante al producido por las tiazidas, no es un efecto muy potente, pues, y existe sinergismo de suma con estas últimas. La optimización de la presión sanguínea es altamente efectiva mejorando los síntomas de la insuficiencia cardíaca. El efecto antihipertensivo de la espironolactona está bien establecido a dosis tan bajas como 50 mg/día. La espironolactona también ha mostrado tener un efecto benéfico sobre el balance neto de los líquidos promoviendo la diuresis, natriuresis y la retención de ión-potasio, mismo, de manera que es útil para restaurar el tenor de potasio en el organismo si se encontrara disminuido por aquellos diuréticos que favorecen su excreción como es el caso de las tiazidas, pudiendo llegarse incluso a una hipercalemia (hiperpotasemia). La espironolactona actúa en las porciones distales de los túbulos renales, disminuyendo la reabsorción del sodio y la secreción de potasio, existe intercambio sodio-potasio y sodio-hidrógeno en los túbulos distales, debido a un antagonismo con respecto a la aldosterona.

Efectos sobre la función autonómica y electrolitos: La espironolactona mejora la frecuencia cardíaca, reduce la dispersión QT, mejora la actividad cardíaca simpática, conserva los niveles totales corporales y del músculo esquelético de potasio y magnesio, disminuye la frecuencia de los complejos ventriculares prematuros y la taquicardia ventricular. Lo que puede explicar la disminución en la incidencia de mortalidad cardíaca observada en algunos estudios.

Remodelación ventricular y síntesis de colágeno: La remodelación cardíaca en la hipertensión arterial esencial se caracteriza por miocitos hipertróficos y aumento de la fibrosis intersticial, la cual resulta de un aumento de la síntesis de colágeno, degradación del colágeno disminuido o sin cambios. El contenido de colágeno en el miocardio juega un papel importante en el desarrollo de la disfunción ventricular izquierda mediante la afectación tanto de la relajación como de la contractilidad.

Por otra parte, la remodelación de las grandes y pequeñas arterias contribuye en el desarrollo y complicaciones de la hipertensión. Los cambios en la estructura de las pequeñas arterias son básicamente de dos tipos: 1) Una remodelación eutrófica interna y 2) Una remodelación hipertrófica, en la cual la media engruesa invadiendo el lumen, resultando en un aumento del área de la media cross-seccional y de la relación media/lumen. El crecimiento, la apoptosis, la inflamación y la fibrosis provocados por la aldosterona contribuyen a la remodelación vascular en la hipertensión. La hipertrofia ventricular es un factor importante de riesgo para el desarrollo de insuficiencia cardíaca y muerte prematura.

La espironolactona al bloquear los receptores de la aldosterona disminuye la remodelación vascular, reduce la hipertrofia ventricular en pacientes hipertensos, disminuye la síntesis de colágeno posinfarto y disminuye la progresión de la remodelación ventricular, mejora la remodelación miocárdica en pacientes con insuficiencia cardíaca crónica o posinfarto, mejora la función diastólica, aumenta la fracción de eyección ventricular.

Efecto sobre la función endotelial e inmune: La espironolactona mejora la función endotelial, aumenta la bioactividad del óxido nítrico, inhibe la conversión vascular de angiotensina I a angiotensina II y retarda la respuesta trombótica al trauma.

Otras acciones farmacológicas: La espironolactona es un antagonista de la aldosterona, pero no un inhibidor de la secreción de esta última ni tampoco modifica la función adrenocortical, de manera que no disminuye los niveles de 17-hidroxycorticoides, 17-cetosteroides ni de aldosterona en la orina; al contrario, la excreción urinaria de aldosterona puede aumentar debido a la depleción de sodio y la reducción del volumen sanguíneo. La espironolactona, aunque es un esteroide, no posee acción estrogénica, aunque algunas veces ha podido producir ginecomastia, tampoco actúa androgénica ni progestacionalmente sobre el metabolismo hidrocarbono ni antagoniza la acción glucocorticoide o antiinflamatoria de los corticosteroides.

En ocasiones produce, en los pacientes tratados, un estado de sedación y ligera depresión del sistema nervioso central.

Farmacocinética: La espironolactona se absorbe rápidamente en el tubo digestivo, tiene una biodisponibilidad aproximadamente de 90%, se une en 90% a las proteínas plasmáticas. En el organismo, esta droga sufre una biotransformación muy completa, en la que intervienen procesos de oxidación de tioacetilación, hidrólisis y conjugación, en una serie de metabolitos que incluyen la canrenona y la tiometilespironolactona 7a, ambos metabolitos activos. El principal metabolito es la tiometilespironolactona 7a. La droga inalterada (en muy pequeña proporción) y sus metabolitos se excretan en la orina y también en heces; la excreción es lenta y se realiza en 5 días, siendo la vida media de unas 20 horas.

Todos los metabolitos atraviesan la barrera placentaria y la canrenona se distribuye en la leche materna.

CONTRAINDICACIONES: La espironolactona no deben emplearse en los casos de insuficiencia renal por el peligro de la hipercalemia (hiperpotasemia) y de la azoemia. Tampoco debe usarse durante el embarazo, enfermedad de Addison, hiperpotasemia o hipersensibilidad a la espironolactona.

PRECAUCIONES GENERALES: No se debe utilizar espironolactona en enfermos con hiperpotasemia o insuficiencia renal grave.

Se debe tener cuidado cuando se use en pacientes con mayor riesgo de hiperpotasemia, como pacientes de edad avanzada, diabéticos o con padecimientos renales o hepáticos.

También se debe usar con cuidado en pacientes con probabilidades de presentar acidosis.

Se debe monitorear periódicamente los electrolitos y el nitrógeno ureico.

RESTRICCIONES DE USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA: No se ha establecido la seguridad del medicamento durante el embarazo, la espironolactona atraviesa la barrera placentaria, sin embargo, no se han documentado problemas en humanos. No obstante se deberá suspender la lactancia cuando se administre espironolactona a la madre.

REACCIONES SECUNDARIAS Y ADVERSAS: Se pueden presentar manifestaciones nerviosas, electrolíticas, trastornos endócrinos y alérgicos.

Las manifestaciones nerviosas consisten en cefalea, somnolencia y ataxia, con dosis elevadas del fármaco, que desaparecen al disminuir las mismas. Los trastornos endócrinos consisten en ginecomastia (muy rara) en el hombre, hirsutismo, voz grave, irregularidades menstruales e impotencia.

Los trastornos alérgicos, muy raros, consisten en erupciones cutáneas, como la urticaria.

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS Y DE OTRO GÉNERO: Si se administra concomitantemente con suplementos de potasio o con otros diuréticos ahorradores de potasio, el paciente corre un mayor riesgo de presentar hiperpotasemia.

También se ha descrito hiperpotasemia en enfermos tratados simultáneamente con IECAs, antagonistas del receptor de la angiotensina II, AINEs, ciclosporina o trilostano.

Los pacientes tratados concomitantemente con AINEs y ciclosporina también aumentan el riesgo de nefrotoxicidad.

El uso concomitante con una tiazida o con clorpromazina puede causar hiponatremia.

La espironolactona reduce las propiedades antiulcerosas de la carbenoxolona. También aumenta los efectos de otros antihipertensivos y disminuye la respuesta cardiovascular a norepinefrina.

ALTERACIONES EN LOS RESULTADOS DE PRUEBAS DE LABORATORIO: Las alteraciones electrolíticas se refieren a la hiponatremia e hipercaliemia, que en general no son serias y ceden al suprimirse la administración del esteroide.

PRECAUCIONES EN RELACIÓN CON EFECTOS DE CARCINOGENÉISIS, MUTAGÉNESIS, TERATOGÉNESIS Y SOBRE LA FERTILIDAD: Se ha reportado cáncer de mama en hombres y mujeres que han tomado espironolactona, sin embargo, su relación causal aún no se ha demostrado.

No se han reportado efectos mutagénicos, teratogénicos ni sobre la fertilidad en humanos con el uso de la espironolactona.

DOSIS Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN: Como coadyuvante para disminuir la incidencia de muerte en insuficiencia cardíaca, se recomienda iniciar con 12.5 y se puede aumentar la dosis hasta 50 mg diarios o cada tercer día por vía oral, además del tratamiento de base indicado.

Hipertensión: 50 a 100 mg al día, en casos severos se puede aumentar la dosis gradualmente cada 2 semanas hasta 200 mg por día.

El tratamiento se debe continuar por dos semanas o más, aun cuando no se haya obtenido la respuesta adecuada, ya que en algunas ocasiones la respuesta se puede presentar en ese tiempo, posteriormente la dosis se debe ajustar de acuerdo a la respuesta del paciente.

Síndrome nefrótico: 100-200 mg/día, su uso sólo es aconsejable si los glucocorticoides no son suficientemente efectivos por sí mismos.

Edema en adultos: 100 mg/día, con ajustes posteriores a las dosis si es necesario, algunos pacientes requieren dosis de hasta 400 mg/día.

En la cirrosis hepática con ascitis y edema, en enfermos con una relación sodio/potasio urinario superior a 1 se administra una dosis inicial de 100 mg/día, mientras que los que tienen una relación inferior a 1 reciben dosis iniciales de 200 a 400 mg/día.

Edema en niños: 3 mg/kg de peso/día, en tomas fraccionadas, la dosis deberá ajustarse de acuerdo a la respuesta del paciente.

Hipopotasemia o hipomagnesemia: 25-100 mg diarios es útil para el tratamiento de la hipopotasemia y/o hipomagnesemia inducida por diuréticos cuando la suplementación de potasio por vía oral se considere inapropiada.

MANIFESTACIONES Y MANEJO DE LA SOBREDOSIFICACIÓN O INGESTA ACCIDENTAL: La sobredosis se puede manifestar por: Náuseas, vómito y somnolencia, confusión mental, erupción cutánea maculopapular o eritematosa y diarrea. También se puede presentar desequilibrio electrolítico y deshidratación, en cuyo caso se deben implementar las medidas sintomáticas y de apoyo, como: Inducción del vómito, lavado gástrico, restablecer el equilibrio hidroelectrolítico.

La hiperpotasemia puede ser tratada mediante la administración rápida de glucosa (20% o 50%) e insulina regular, utilizando 0.25 a 0.5 unidades de insulina por g de glucosa. También se pueden utilizar diuréticos excretadores de potasio o resinas de intercambio iónico, repitiéndolos según sea necesario.

Se debe discontinuar la espironolactona y restringir la ingesta de potasio, incluso de fuentes dietéticas.

RECOMENDACIONES SOBRE ALMACENAMIENTO: Consérvese a temperatura ambiente a no más de 30 °C y en lugar seco.

LEYENDAS DE PROTECCIÓN: Su venta requiere receta médica. No se deje al alcance de los niños. No se administre durante el embarazo y la lactancia.

PRESENTACIONES:

Caja con 30 **tabletas** de 25 mg.

Caja con 30 **tabletas** de 100 mg.

Comercializado por:

LABORATORIOS BAGÓ S.A.

MR **Marca registrada**