



УТВЕРЖДАЮ  
Заместитель директора  
Департамента лекарственных  
средств и медицинских изделий  
Министерства здравоохранения  
и социального развития  
Кыргызской Республики  
Кагаздиев Н.М.   
« 09 » августа 2021г



## ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

### ДИАКАРБ®

#### Торговое наименование

Диакарб®

#### Международное непатентованное название

Ацетазоламид

#### Лекарственная форма

Таблетки

#### Состав

Одна таблетка содержит

*активное вещество:* ацетазоламид 250 мг

*вспомогательные вещества:* микрокристаллическая целлюлоза, повидон, натриевая соль кроскармеллозы, кремния диоксид коллоидный, магния стеарат.

#### Описание

Таблетки белого цвета, круглые, двояковыпуклые.

#### Фармакотерапевтическая группа

Противоглаукомные препараты и миотики. Ингибиторы карбоангидразы. Ацетазоламид.

Код АТХ: S01EC01

#### Фармакологические свойства

##### *Фармакодинамика*

Ацетазоламид является ингибитором карбоангидразы. Механизм этого действия основан на угнетении обмена ионов  $\text{Na}^+$  на ионы  $\text{H}^+$  из угольной кислоты. Карбоангидраза катализирует реакцию, в результате которой образуется угольная кислота. Угнетение активности этого фермента ацетазоламидом тормозит синтез угольной кислоты в проксимальных канальцах. Дефицит угольной кислоты, являющейся источником ионов водорода, приводит к повышенному выведению воды и натрия. Эффектом действия ацетазоламида является увеличение натрийуреза и диуреза.

Внепочечное действие ацетазоламида используется для лечения глаукомы. Ацетазоламид уменьшает продукцию водянистой влаги глаза и, благодаря этому, уменьшает внутриглазное давление.

Ацетазоламид применяется также как вспомогательный препарат для лечения

эпилепсии. Угнетение карбоангидразы в центральной нервной системе угнетает нарушенные импульсы нейронов.

#### *Фармакокинетика*

Ацетазоламид хорошо всасывается из желудочно-кишечного тракта.

После приема внутрь дозы 500 мг,  $C_{max}$  (12-27  $\mu\text{г/мл}$ ) наступает через 1-3 часа. Ацетазоламид в меньших концентрациях задерживается в крови в течение 24 часов от момента введения.

Ацетазоламид проникает во многие ткани. Находится в основном в эритроцитах, в плазме и почках, в меньшей степени в печени, мышцах, в глазном яблоке и ЦНС.

Не кумулируется в тканях.

Фракция, связанная с белками, составляет 70-90% общего содержания ацетазоламида в крови. Период полувыведения составляет 3-6 часов (согласно некоторым данным даже до 8 часов).

Ацетазоламид проникает через плацентарный барьер.

Ацетазоламид в небольших количествах выделяется с грудным молоком.

Ацетазоламид не биотрансформируется.

Препарат выводится почками в неизмененном виде.

После приема внутрь, около 90% принятой дозы выводится с мочой в течение 24 часов.

Небольшое количество выводится с желчью.

#### **Показания к применению**

- **Глаукома**
  - хроническая открытоугольная
  - вторичная
  - закрытоугольная (кратковременное предоперационное лечение с целью снижения внутриглазного давления).
- **Отеки**
  - при сердечной недостаточности
  - вызванные лекарственными средствами
- **Эпилепсия**  
в комбинации с другими противосудорожными препаратами
  - *petit mal* (малый судорожный припадок) у детей
  - *grand mal* (большой судорожный припадок)
  - смешанные формы.
- **Острая высотная болезнь**  
препарат сокращает время акклиматизации, но его действие на симптомы этой болезни незначительное.

#### **Противопоказания**

- Повышенная чувствительность к действующему веществу, сульфонамиду или к какому-либо вспомогательному веществу.
- Ацетазоламид противопоказан в случаях, когда в крови пациента отмечается низкий уровень натрия и (или) калия, в случае недостаточности почек и печени, при надпочечниковой недостаточности и гипохлоремическом ацидозе. Ацетазоламид не следует применять у пациентов с циррозом печени, поскольку это может увеличивать риск печеночной энцефалопатии.
- Продолжительное применение ацетазоламида противопоказано у пациентов с хронической декомпенсированной закрытоугольной глаукомой, поскольку в случае полного закрытия угла камеры глаза ухудшение течения глаукомы будет маскироваться сниженным внутриглазным давлением.
- Ацетазоламид противопоказан у пациентов с мочекаменной болезнью.

## **Способ применения и дозы**

Препарат принимают внутрь.

### ***Глаукома***

Дозу препарата следует устанавливать индивидуально в зависимости от величины внутриглазного давления.

Обычно взрослым рекомендуют следующую дозировку:

При открытоугольной глаукоме: 250 мг (1 таблетка) от 1 до 4 раз в сутки.

Дозы более чем 1000 мг (4 таблетки) не повышают эффективность лечения.

При вторичной глаукоме: 250 мг (1 таблетка) каждые 4 часа.

У некоторых пациентов эффективность препарата наблюдается при дозе 250 мг (1 таблетка) 2 раза в сутки (при кратковременной терапии).

При острых приступах глаукомы 250 мг (1 таблетка) 4 раза в сутки.

### ***Эпилепсия***

Взрослые и дети: обычно применяют из расчета 8 до 30 мг/кг массы тела в сутки, в 1-4 равные приема. Оптимальная доза составляет 375-1000 мг (1½-4 таблетки) в сутки.

При одновременном применении ацетазоламида с другими противосудорожными препаратами, в начале лечения применяют 250 мг (1 таблетку) 1 раз в сутки, постепенно увеличивая дозу в случае необходимости. У детей не следует применять дозы выше, чем 750 мг в сутки.

### ***Отеки при сердечно-сосудистой недостаточности и вызванные лекарственными средствами***

В начале 250-375 мг (1-1½ таблетки) 1 раз в сутки, утром.

Оптимальный диуретический эффект достигается при приеме препарата через день или в течение двух дней с последующим однодневным перерывом.

В период приема ацетазоламида следует продолжать лечение сердечной недостаточности, например: применение гликозидов наперстянки, низкосолевого питания и восполнение дефицита калия.

### ***Острая высотная болезнь***

Рекомендуется применение препарата в дозе 500-1000 мг (2-4 таблетки) в сутки в несколько приемов.

В случае быстрого подъема на высоту (более 500 м в день): 1000 мг (4 таблетки) в сутки в несколько приемов.

Препарат следует принимать за 24-48 ч до планируемого подъема на значительную высоту, а в случае появления симптомов высотной болезни, лечение следует продолжать следующие 48 часов или более, если это необходимо.

### ***Побочные действия***

Как каждое лекарственное средство, Диакарб® может оказывать побочные действия, хотя не у каждого они возникают.

Побочные действия, во время кратковременного лечения, чаще всего не являются серьезными.

Могут появиться следующие побочные действия: парестезии (чувство ползания мурашек в конечностях), потеря аппетита, нарушение вкуса, полиурия, приливы, жажда, головная боль, головокружение, утомляемость, раздражительность, депрессия, уменьшение полового влечения, спорадически – сонливость и дезориентация.

Редко наблюдалась фотосенсибилизация.

С частотой неизвестной: острый генерализованный экзантематозный пустулез (ОГЭП). При продолжительной терапии может выступить метаболический ацидоз и нарушение водно-электролитного баланса, включая спорадические случаи гипокалиемии и гипонатриемии. Чаще всего гипокалиемия имеет преходящий характер и редко имеет клиническое значение.

В случае развития метаболического ацидоза применяют гидрокарбонаты.

При продолжительной терапии может выступить гипергликемия и гипогликемия.

Отмечены случаи преходящей близорукости, которые исчезают после уменьшения дозы или после отмены препарата.

*Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта:* тошнота, рвота, диарея.

Ацетазоламид как производное сульфонида может вызывать побочные действия, характерные для сульфонида. Это: повышение температуры тела, агранулоцитоз, тромбоцитопения, лейкопения, апластическая анемия, угнетение функции костного мозга, панцитопения, сыпь (включая полиморфную эритему, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз), анафилактические реакции, кристаллурия, образование камней в почках, почечная колика и повреждение почек. Отмечены редкие случаи молниеносного некроза печени.

*Другие спорадически появляющиеся побочные действия это:* крапивница, наличие крови в кале, гематурия, глюкозурия, нарушения слуха и шум в ушах, нарушения функции печени, почечная недостаточность, и редко гепатит или механическая желтуха, вялый паралич, судороги.

#### Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

#### **Особые указания**

У пациентов, принимающих противосудорожные препараты при различных показаниях отмечены случаи суицидальных попыток и намерений. В случае появления признаков суицидальных попыток и намерений следует обратиться к врачу.

Повышение дозы ацетазоламида не приводит к увеличению диуреза, но может увеличить частоту проявления сонливости и парестезий.

Увеличение дозы препарата часто приводит к снижению диуреза. В некоторых случаях, однако, применяют высокие дозы препарата в комбинации с другими диуретиками с целью обеспечения диуреза в ситуации полностью рефрактерной сердечной недостаточности.

У пациентов, леченных ацетазоламидом отмечают как повышение, так и снижение уровня глюкозы в крови. Этот факт следует учитывать по отношению к пациентам с нарушенной переносимостью глюкозы или сахарным диабетом.

При продолжительной терапии ацетазоламидом показаны особые меры осторожности. Следует сообщать врачу обо всех случаях появления кожных изменений. Рекомендуется проводить периодическое исследование картины крови и определение уровня электролитов. В случае тяжелой реакции на сульфонида отмечены редкие случаи смертельного исхода. Внезапное падение уровня форменных элементов крови или появление токсических кожных изменений должны быть сигналом к немедленному прекращению лечения ацетазоламидом.

У пациентов с непроходимостью/обтурацией нижних дыхательных путей/обтурационным состоянием или эмфиземой легких, у которых альвеолярная

вентиляция может быть снижена, ацетазоламид может увеличивать ацидоз и поэтому следует применять его с осторожностью. У пациентов с мочекаменной болезнью в анамнезе, следует оценить соотношение пользы от применения препарата к риску дальнейшего образования камней в почках.

Ацетазоламид алкализует мочу.

Развитие генерализованной эритемы на фоне приема лекарственного средства, сопровождающейся появлением пустул и лихорадкой, может быть симптомом острого генерализованного экзантематозного пустулеза (ОГЭП) (см. раздел «Побочные действия»). При постановке диагноза ОГЭП терапия ацетазоламидом должна быть отменена, любое последующее назначение ацетазоламида противопоказано.

#### Лабораторные исследования

Рекомендуется проводить контроль картины крови и тромбоцитов в начале лечения и периодически во время лечения, а также периодически контролировать содержание электролитов в сыворотке.

#### **Применение во время беременности и лактации**

##### Беременность

Ацетазоламид проникает через плацентарный барьер.

Препарат не рекомендуется применять у беременных женщин, особенно в I триместре беременности.

##### Грудное вскармливание

Ацетазоламид в небольших количествах выделяется с грудным молоком.

В связи с потенциальным риском появления побочных действий у грудных детей, следует принять решение об отмене препарата или о прекращении грудного вскармливания.

#### **Влияние на способность вождения средств транспорта и обслуживания механического оборудования**

Повышение дозы ацетазоламида не приводит к увеличению диуреза, но может увеличить частоту проявления сонливости и парестезий. Редко сообщалось о случаях усталости, головокружений и атаксии.

У некоторых пациентов с отеком, вызванным циррозом печени, отмечается состояние дезориентации. Такие клинические случаи должны быть под тщательным наблюдением. Отмечены случаи преходящей близорукости. Данные симптомы всегда исчезают после уменьшения дозы или после отмены препарата.

В период лечения пациенты не должны управлять транспортным средством и обслуживать механизмы.

#### **Передозировка**

В результате передозировки могут наступить нарушения водно-электролитного баланса и ацидоз, а также расстройства со стороны ЦНС.

В случае приема лекарственного средства в дозе большей чем рекомендованная, необходимо немедленно обратиться к врачу.

#### **Лекарственное взаимодействие**

Необходимо сообщить врачу обо всех принимаемых в последнее время препаратах, даже тех, которые отпускаются без рецепта.

Следует проинформировать врача о применении:

- фолиевой кислоты
- гипогликемизирующих препаратов

- пероральных антикоагулянтов
- ацетилсалициловой кислоты
- сердечных гликозидов
- препаратов, понижающих артериальное кровяное давление
- противосудорожных препаратов (фенитоина, примидона, карбамазепина)
- ингибиторов карбоангидразы (например дорзоламида, бринзоламида)
- амфетамина
- хинидина
- метенамина
- циклоспорина
- лития
- натрия гидрокарбоната.

**Срок годности**

5 лет

Не применять по истечении срока годности.

**Форма выпуска и упаковка**

Блистер из Al/PVC фольги в картонной пачке. 30 таблеток (3 блистера по 10 таблеток).

**Условия хранения**

Хранить в защищенном от света месте, при температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Лекарственные препараты нельзя спускать в канализацию или выбрасывать в мусорную корзину. Необходимо спросить фармацевта, что делать с неиспользованными лекарственными препаратами. Это важно для охраны окружающей среды.

**Условия отпуска из аптек**

По рецепту

**Держатель регистрационного удостоверения / производитель**

Фармацевтический завод «ПОЛЬФАРМА» АО

ул. Пельплиньска 19

83-200 Старогард Гданьски

Польша

**Наименование, адрес организации на территории Кыргызской Республики, ответственной за пострегистрационное наблюдение за безопасностью лекарственного препарата**

Представительство АО «Химфарм» в Кыргызской Республике

Кыргызская Республика, г. Бишкек, ул. Орозбекова 52-54, 3 этаж

Номер телефона +996312621251

Адрес электронной почты: [pvh-kg@santo.kz](mailto:pvh-kg@santo.kz)