PREPARATO CHARAKTERISTIKŲ SANTRAUKA

1. VAISTINIO PREPARATO PAVADINIMAS

Diacarb 250 mg tabletės

2. KOKYBINĖ IR KIEKYBINĖ SUDĖTIS

Kiekvienoje tabletėje yra 250 mg acetazolamido.

Visos pagalbinės medžiagos išvardytos 6.1 skyriuje.

3. FARMACINĖ FORMA

Tabletė.

Tabletės yra baltos, apvalios, abipusiai išgaubtos.

4. KLINIKINĖ INFORMACIJA

4.1 Terapinės indikacijos

Glaukomos gydymas.

4.2 Dozavimas ir vartojimo metodas

Dozavimas

Suaugusieji
Nuo 250 iki 1000 mg lygiomis dalimis per 2-4 kartus.

Senyvi žmonės
Kokią įtaką daro amžius acetazolamido poveikiui senų žmonių organizme, duomenų nėra. Vis dėlto labiau tikėtina, kad senyvi pacientai turės su amžiumi susijusį inkstų funkcijos sutrikimą, taigi pacientams, vartojantiems šių vaistinių preparatų, būtina imtis atsargumo priemonių.

Vartojimo metodas
Vaistinį preparatą reikia vartoti per burną.

4.3 Kontraindikacijos

- Padidėjęs jautrumas veikliajai arba bet kuriai 6.1 skyriuje nurodytai pagalbinei medžiagai;
- Padidėjęs jautrumas sulfamidams;
- Serume sumažėjusi natrio ir/arba kalio koncentracija;
- Sutrikusi inkstų ir (arba) kepenų veikla (sergant kepenų ligomis dažniau galima encefalopatija);
- Antinksčių nepakankamumas;
- Hiperchloremine acidozė;
- Lėtinė dekompensuota uždaro kampo glaukoma (vaistinis preparatas netinka ilgalaikiam gydymui);
- Hiperkalciurija.

4.4 Specialūs įspėjimai ir atsargumo priemonės

- Jei yra padidėjęs jautrumas vaistiniam preparatui, gali atsirasti gyvybei grėsmingas nepageidaujamas poveikis, pvz., Stivenso ir Džonsono sindromas, Lyell sindromas, žaibiška kepenų nekrozė, agranulocitozė, aplazinė anemija ir hemoraginė diatezė.
  Jei atsirado odos ir kraujodaros pokyčių, vaistinio preparato vartojimą reikia nedelsiant nutraukti.
- Acetazolamido reikia atsargiai vartoti su didele doze acetilsalicilo rūgšties, kadangi gali prasidėti anoreksija, padažnėti kvėpavimas, atsirasti letarginė būsena, koma, gali ištikti net mirtis.
- Vartojama didesnė negu rekomenduojama acetazolamido dozė diurezės nedidina, tačiau gali stiprinti mieguistumą bei parestezią, o kartais - net sumažinti diurezę.
- Vaistinis preparatas gali didinti acidozę, todėl pacientams, sergantiems plaučių embolija ir emfizema, jo reikėtų vartoti atsargiai.
- Vaistinis preparatas šarmina šlapimą.

Laboratoriniai tyrimai
Padėjus gerti vaistinio preparato ir gydymo juo metu rekomenduojama reguliariai stebėti kiekybinę kraujo ląstelių sudėtį, trombocitų kiekį bei elektrolitų koncentraciją serume.

Gydymo pradžioje pasireiškusi generalizuota eritema su pustulėmis ir karščiavimu gali būti ūminės generalizuotos egzanteminės pustuliozės (ŪGEP) simptomas (žr. 4.8 skyrių). Diagnozavus ŪGEP, gydymas acetazolamidu turi būti nutrauktas ir uždraustas bet koks paskesnis acetazolamido vartojimas.

Natris
Šio vaistinio preparato sudėtyje yra mažiau kaip 1 mmol (23 mg) natrio, t.y. jis beveik neturi reikšmės.

4.5 Sąveika su kitais vaistiniais preparatais ir kitokia sąveika

- Acetazolamidas gali stiprinti folio rūgšties antagonistų, vaistinių preparatų nuo diabeto ir geriamųjų antikoaguliantų poveikį.
- Vartojant acetazolamido kartu su acetilsalicilo rūgštimi gali pasireikšti sunki acidozė ir stiprėti toksinis poveikis nervų sistemai.
- Vartojant širdį veikiančių glikozidų ar vaistinių preparatų, didinančių arterinį kraujospūdį kartu su acetazolamidu, pastarojo vaistinio preparato dozę reikia tikslinti.
- Acetazolamidas sutrikdo fenitoino metabolizmą, todėl serume padidėja šio vaistinio preparato koncentracija. Kai kuriems pacientams, vartojusiems acetazolamido kartu su vaistiniais preparatais nuo traukulių (fenitoinu, primidonu), atsirado sunkus kaulų suminkštėjimas. Acetazolamidas slopina primidono absorbciją ir mažina vaistinių preparatų nuo traukulių veiksmingumą.
- Kad nepasireikštų nepageidaujamas poveikis, acetazolamido vartoti kartu su kitais karboanhidrazės inhibitoriais (KAI) negalima.

4.6 Vaisingumas, nėštumo ir žindymo laikotarpis

Nėštumas
Pagal saugumą nėštumo metu vaistinis preparatas priklauso C kategorijai.
Acetazolamidas prasiskverbia per placentą.
Nustatyta, kad acetazolamidas, jei jo sugirdoma 10 kartų didesnė negu rekomenduojama žmogui dozė, pelėms, žiurkėms, žiurkėnams ir triušiams sukelia teratogeninį ir embriotoksinį poveikį. Nėščių moterų išsamių klinikinių stebėjimų neatlikta, todėl galutinės išvados apie vaistinio preparato

teratogeninį poveikį žmonėms daryti negalima. Dėl minėtų priežasčių nėščioms moterims, ypač pirmuosius tris nėštumo mėnesius, vaistinio preparato vartoti negalima.
Kiekvienu atveju reikia apsvarstyti, ar gydymo nauda didesnė negu vaisiaus pažeidimo pavojus.

Žindymas
Šiek tiek acetazolamido patenka į motino pieną. Jei žindyvė geria vaistinio preparato, žindymą reikia nutraukti.

4.7 Poveikis gebėjimui vairuoti ir valdyti mechanizmus

Acetazolamidas, ypač didelės jo dozės, gali sukelti mieguistumą, rečiau - nuovargį, svaigulį, sutrikdyti koordinaciją ir orientaciją, todėl vaistinio preparato vartojantiems pacientams reikėtų atsisakyti vairuoti transportą bei prižiūrėti veikiančius įrenginius.

4.8 Nepageidaujamas poveikis

Nepageidaujamo poveikio dažnis apibūdinamas taip: labai dažnas (≥ 1/10), dažnas (nuo ≥ 1/100 iki < 1/10), nedažnas (nuo ≥ 1/1 000 iki < 1/100), retas (nuo ≥ 1/10 000 iki < 1/1 000), labai retas (< 1/10 000) ir nežinomas (negali būti apskaičiuotas pagal turimus duomenis).

Nervų sistemos sutrikimai
Nedažnas: glebusis paralyžius, galvos svaigimas, pavieniai mieguistumo ir orientacijos sutrikimo atvejai.
Labai retas: parestezija, nuovargis.

Ausų ir labirintų sutrikimai
Labai retas: klausos sutrikimai, zvimbimas ausyse.

Virškinimo trakto sutrikimai
Nedažnas: rėmuo, pykinimas, vėmimas, viduriavimas.
Labai retas: apetito nebuvimas, skonio pokytis.

Inkstų ir šlapimo takų sutrikimai
Nedažnas: dažnas šlapinimasis, hematurija, inkstų diegliai.
Dažnis nežinomas: gliukozurija.

Metabolizmo ir mitybos sutrikimai
Labai retas: metabolinė acidozė, elektrolitų pusiausvyros sutrikimai, hipokalcemija.

Akių sutrikimai
Labai retas: trumpalaikė trumparegystė.

Kepenų, tulžies pūslės ir latakų sutrikimai
Retas: kepenų diegliai, kepenų funkcijos nepakankamumas.

Odos ir poodinio audinio sutrikimai:
Nedažnas: niežulys.
Labai retas: dilgėlinė, padidėjusio jautrumo šviesai reakcijos, daugiaformės eritemos tipo išbėrimas, Stivenso ir Džonsono sindromas, Lyell sindromas.
Dažnis nežinomas: ūminė generalizuota egzanteminė pustuliozė (ŪGEP).

Kraujo ir limfinės sistemos sutrikimai
Labai retas: agranuliocitozė, trombocitopenija, leukopenija, ir aplazinė anemija, kaulų čiulpų

nepakankamumas, pancitopenija.

Bendrieji sutrikimai ir vartojimo vietos pažeidimas
Nedažnas: karščiavimas.
Dažnis nežinomas: parazitų sukeltos infekcijos.

Pranešimas apie įtariamas nepageidaujamas reakcijas
Svarbu pranešti apie įtariamas nepageidaujamas reakcijas, pastebėtas po vaistinio preparato registracijos, nes tai leidžia nuolat stebėti vaistinio preparato naudos ir rizikos santykį. Sveikatos priežiūros specialistai turi pranešti apie bet kokias įtariamas nepageidaujamas reakcijas, užpildę interneto svetainėje http://www.vvkt.lt/ esančią formą, ir pateikti ją Valstybinei vaistų kontrolės tarnybai prie Lietuvos Respublikos sveikatos apsaugos ministerijos vienu iš šių būdų: raštu (adresu Žirmūnų g. 139A, LT 09120 Vilnius), faksu (nemokamu fakso numeriu (8 800) 20 131), elektroniniu paštu (adresu NepageidaujamaR@vvkt.lt), per interneto svetainę (adresu http://www.vvkt.lt).

4.9 Perdozavimas

Perdozavimo ir ūminės intoksikacijos žmonėms atvejų nepastebėta.
Specifinio acetazolamidui priešnuodžio nėra.
Perdozavus vaistinio preparato gali sutrikti elektrolitų pusiausvyra, centrinės nervų sistemos veikla pasireikšti acidozė, todėl reikia stebėti elektrolitų (ypač kalio) koncentraciją serume ir kraujo pH.
Gydymas yra simptominis ir palaikomasis.
Acidozei šalinti reikia vartoti rūgščiųjų karbonatų.
Acetazolamidą galima pašalinti kraujo dialize.

5. FARMAKOLOGINĖS SAVYBĖS

5.1 Farmakodinaminės savybės

Farmakoterapinė grupė - karboanhidrazės inhibitoriai, ATC kodas - S 01E C01.

Acetazolamidas yra stipraus poveikio karboanhidrazės inhibitorius, sukeliantis silpną diurezinį poveikį. Jo veikimo mechanizmas susijęs su Na^+ jonų ir H^+ jonų, tiekiamų anglies rūgštis, mainų slopinimu. Karboanhidrazė katalizuoja anglies rūgšties sintezės reakciją, todėl jos aktyvumo blokavimas acetazolamidu mažina minėtos rūgšties sintezę proksimaliniuose inkstų kanalėliuose. Trūkstant anglies rūgšties, kuri yra H^+ jonų šaltinis, sumažėja H^+ jonų, būtinų Na^+ ir H^+ jonų mainams, todėl padidėja natrio bei vandens šalinimas.
Dėl acetazolamido poveikio didėja natriurezė ir diurezė. Po maždaug 3 dienų vartojimo acetazolamido diurezinis poveikis išnyksta. Padarius kelių dienų pertrauką, karboanhidrazės aktyvumas vėl tampa normalus, todėl acetazolamidas vėl gali sukelti diurezinį poveikį.
Acetazolamidas ne tik skatina natrio, bet ir karbonatų šalinimą, todėl sukelia metabolinę acidozę. Dėl acetazolamido poveikio į distalinę nefrono dalį patenka didesnis natrio kiekis, todėl Na^+ ir H^+ jonų mainai šioje nefrono dalyje padidėja, o organizmas netenka daug kalio ir prasideda hipokaliemija. Be to, acetazolamidas skatina fosfatų, magnio ir kalcio šalinimą su šlapimu, dėl to gali labai sutrikti medžiagų apykaita.
Dėl ekstrarenalinio poveikio acetazolamidas vartojamas glaukomai gydyti. Jis slopina skysčio gamybą akies obuolyje, todėl sumažina akispūdį.
Kaip pagalbinis vaistinis preparatas acetazolamidas tinka epilepsijai gydyti. Karboanhidrazės aktyvumo blokavimas centrinėje nervų sistemoje slopina nenormalias neuronų iškrovas.

5.2 Farmakokinetinės savybės

Bendrieji duomenys

Farmakokinetikos duomenys pateikti remiantis mokslinės literatūros šaltiniais.

Absorbcija
Acetazolamidas gerai absorbuojamas iš virškinimo trakto. Išgėrus 500 mg dozę, didžiausia koncentracija kraujyje (12-27 mikrogramai/ ml) atsiranda po 1-3 val. Mažėjanti jo koncentracija kraujyje būna net 24 valandas.

Pasiskirstymas
Acetazolamido patenka į daugelį audinių. Daugiausia jo būna eritrocituose, kraujo plazmoje ir inkstuose, mažiau - kepenyse, raumenyse, akyse ir CNS. Audiniuose jis nesikaupia.
Acetazolamido prasiskverbia per placentą.
Šiek tiek acetazolamido išsiskiria į žindyvės pieną.

Biotransformacija
Acetazolamidas nemetabolizuojamas.

Eliminacija
Acetazolamidas išsiskiria pro inkstus nepakitęs.
Per 24 val. su šlapimu pašalinama maždaug 90% išgertos dozės.

5.3 Ikiklinikinių saugumo tyrimų duomenys

Ilgalaikių acetazolamido kancerogeninio poveikio tyrimų su gyvūnais neatlikta.
Acetazolamido tyrimų su bakterijomis metu mutageninio poveikio nepastebėta.
Vartojamas 4 kartus didesnėmis, negu rekomenduojama žmogui (20 mg/kg kūno svorio), dozėmis vaistinis preparatas žiurkių vaisingumo neveikė.
Sugirdytas arba injekuotas pelėms, žiurkėms, žiurkėnams ir triušiams acetazolamidas sukėlė teratogeninį poveikį.
Svarbiausi vaisiaus pokyčiai: skeleto aplazija, pirštakaulių formos pakitimai arba jų trūkumas (ektodaktilizmas) ir krūtinės bei liemens slankstelių hipoplazija.
Yra kelios hipotezės, nuo ko priklauso teratogeninis poveikis, pvz.:

- nuo apvaisintos kiaušialąstės genotipo pokyčių,
- nuo vaistinio preparato sukeltos acidozės,
- nuo kūno dalių kraujotakos sutrikimo (dažniau kinta galūnių kraujotaka),
- nuo dozės.

6. FARMACINĖ INFORMACIJA

6.1 Pagalbinių medžiagų sąrašas

Mikrokristalinė celiuliozė
Povidonas
Kroskarmeliozės natrio druska
Bevandenis koloidinis silicio dioksidas
Magnio stearatas

6.2 Nesuderinamumas

Duomenys nebūtini.

6.3 Tinkamumo laikas

5 metai.

6.4 Specialios laikymo sąlygos

Laikyti ne aukštesnėje kaip 25 °C temperatūroje.
Lizdines plokšteles laikyti išorinėje dėžutėje, kad vaistinis preparatas būtų apsaugotas nuo šviesos ir drėgmės.

6.5 Talpyklės pobūdis ir jos turinys

Aliuminio ir PVC lizdinės plokštelės. Vienoje plokštelėje yra 10 tablečių, vienoje kartono dėžutėje – 2 arba 3 lizdinės plokštelės (20 arba 30 tablečių) ir pakuotės lapelis.
Gali būti tiekiamos ne visų dydžių pakuotės.

6.6 Specialūs reikalavimai atliekoms tvarkyti

Specialių reikalavimų nėra.
Nesuvartotą vaistinį preparatą ar atliekas reikia tvarkyti laikantis vietinių reikalavimų.

7. REGISTRUOTOJAS

Pharmaceutical Works POLPHARMA S.A.
Ul. Peplinska 19, 83-200 Starogard Gdanski, Lenkija

8. REGISTRUOTOJAS PAŽYMĖJIMO NUMERIS (-IAI)

N20 - LT/1/94/0975/001.
N30 - LT/1/94/0975/002.

9. REGISTRAVIMO / PERREGISTRAVIMO DATA

Registravimo data 1994 m. birželio mėn. 22 d.
Paskutinio perregistravimo data 2008 m. sausio mėn. 17 d.

10. TEKSTO PERŽIŪROS DATA

2020 m. balandžio 8 d.

Išsami informacija apie šį vaistinį preparatą pateikiama Valstybinės vaistų kontrolės tarnybos prie Lietuvos Respublikos sveikatos apsaugos ministerijos tinklalapyje http://www.vvkt.lt/.