

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

ДІАКАРБ
(DIACARB)

Склад:

діюча речовина: ацетазоламід;

1 таблетка містить 250 мг ацетазоламіду;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, повідон, кремнію діоксид колоїдний безводний, кроскармелоза, магнію стеарат.

Лікарська форма. Таблетки.

Основні фізико-хімічні властивості: круглі двоопуклі таблетки білого кольору.

Фармакотерапевтична група. Протиглаукомні препарати і міотичні засоби. Інгібітори карбоангідрази. Код АТХ S01E C01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Діуретичний, протиглаукомний, протиепілептичний засіб. Механізм дії зумовлений вибірковою пригніченістю карбоангідрази – ферменту, що каталізує оборотну реакцію гідратації діоксиду вуглецю і подальшу дисоціацію вугільної кислоти. Діуретичний ефект зумовлений пригніченістю активності карбоангідрази у нирках (головним чином у проксимальних ниркових канальцях), що призводить до зниження реабсорбції бікарбонату, іонів натрію і калію, посилення діурезу, підвищення рН сечі, збільшення реабсорбції аміаку. Не впливає на екскрецію іонів хлору. У результаті пригнічення карбоангідрази циліарного тіла зменшує секрецію водянистої вологи і знижує внутрішньоочний тиск. Пригнічення карбоангідрази у головному мозку призводить до накопичення CO₂ у мозку і гальмування надмірних пароксизмальних розрядів нейронів, що зумовлює протиепілептичну активність препарату. Застосування препарату при підвищеному внутрішньочерепному тиску пов'язане з пригніченням карбоангідрази у судинних сплетіннях шлуночків головного мозку і зниженням продукування спинномозкової рідини.

Фармакокінетика.

Всмоктування

Ацетазоламід добре всмоктується із травного тракту. Максимальна концентрація C_{max} у плазмі крові досягається через 1–3 години після застосування. Невеликі концентрації ацетазоламіду зберігаються у крові упродовж 24 годин.

Розподіл

Ацетазоламід розподіляється у багатьох тканинах. Завдяки високому спорідненню з карбоангідразою накопичується переважно у тканинах, що містять цей фермент, зокрема в еритроцитах, нирках, м'язах, тканинах очного яблука і центральній нервовій системі. Препарат не накопичується у тканинах.

Фракція з білками становить 7–90 % від загального вмісту ацетазоламіду в крові. Період напіввиведення становить 4–9 годин.

Ацетазоламід проникає через плацентарний бар'єр.

У невеликих кількостях проникає у грудне молоко.

Метаболізм



Узгоджено з матеріалами
реєстраційного досьє

Ацетазоламід не метаболізується.

Виведення

Препарат виділяється нирками у незміненому вигляді. Після прийому внутрішньо близько 90 % прийнятої дози виводиться із сечею протягом 24 годин.

Клінічні характеристики.

Показання.

Лікування глаукоми:

- хронічна відкритокутова глаукома;
- вторинна глаукома;
- закритокутова глаукома (для короткочасної передопераційної терапії та перед офтальмологічними процедурами, для зменшення внутрішньоочного тиску).

Лікування набряків:

- при серцевій недостатності;
- набряків, спричинених прийомом лікарських засобів.

Лікування епілепсії (у комбінації з іншими протисудомними засобами):

- *petit mal* (малі напади) у дітей;
- *grand mal* (великі напади) у дорослих;
- змішаної форми.

Лікування висотної хвороби (препарат скорочує час акліматизації, але його вплив на прояви цієї хвороби незначний).

Протипоказання.

Підвищена індивідуальна чутливість до компонентів препарату і сульфонамідів, порушення функції печінки та нирок, гостра ниркова недостатність, печінкова недостатність, гіпонатріємія та/або гіпокаліємія, хвороба Аддісона, недостатності надниркових залоз, гіперхлоремічному ацидозі. Ацетазоламід протипоказаний пацієнтам із цирозом печінки, оскільки це може підвищувати ризик печінкової енцефалопатії.

Довготривале застосування ацетазоламід у протипоказано пацієнтам із хронічною декомпенсованою закритокутовою глаукомою, оскільки у випадку повного закриття кута камери ока погіршення перебігу глаукоми буде маскуватися зниженим внутрішньоочним тиском.

Сечокам'яна хвороба (при гіперкальціурії), цукровий діабет, уремія.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

- Ацетазоламід може посилювати дію антагоністів фолієвої кислоти, гіпоглікемічних засобів та антикоагулянтів, які застосовують внутрішньо.
- Одночасне застосування ацетазоламід у ацетилсаліциловою кислотою може призвести до важкого ацидозу та токсично вплинути на центральну нервову систему з ризиком розвитку анорексії, тахіпноє, летаргічного стану, коми з можливим летальним наслідком.
- При одночасному застосуванні ацетазоламід із серцевими глікозидами або лікарськими засобами, що підвищують артеріальний тиск, дозу першого необхідно змінити.
- Ацетазоламід порушує метаболізм фенітоїну, підвищуючи концентрації останнього в сироватці крові. У пацієнтів, які застосовують ацетазоламід із певними протисудомними засобами (фенітоїном, примідоном), спостерігалася тяжка форма остеомаляції.
- Одночасне застосування ацетазоламід з амфетамінами, атропіном або хінідином може посилювати їхню побічну дію. Знижується виведення амфетаміну і хінідину, тому можливе подовження часу дії амфетаміну і посилення дії хінідину шляхом підвищення рівня рН сечі в ниркових каналцях.
- Ацетазоламід може підвищувати або знижувати концентрацію глюкози в крові, що слід враховувати при лікуванні цукрового діабету. Може знадобитися зміна дози інсуліну або пероральних гіпоглікемізуючих препаратів.
- Ацетазоламід посилює виведення літію та може зменшити рівень літію у плазмі крові.
- Ацетазоламід може підвищувати концентрацію карбамазепіну у плазмі крові.
- При одночасному застосуванні ацетазоламід підвищує ризик появи токсичних ефектів саліцилатів, препаратів наперстянки, карбамазепіну, атефедрину, недеполяризуючих

міорелаксантів.

- Сечогінний ефект ацетазоламід у посилюється теофіліном, послаблюється кислотоутворюючими діуретиками.
- Були поодинокі повідомлення про зниження рівня прамідону у сироватці крові та збільшення рівня карбамазепіну при їх одночасному застосуванні з ацетазоламідом.
- Через можливі адитивні ефекти не рекомендується одночасне застосування з іншими інгібіторами карбоангідази.
- Циклоспорин: ацетазоламід може підвищувати рівень циклоспорину.
- Метенамін: ацетазоламід може порушувати антисептичний ефект метенаміну щодо сечі.
- Бікарбонат натрію: одночасне застосування ацетазоламід з бікарбонатом натрію підвищує ризик утворення ниркових конкрементів.

Особливості застосування.

Були повідомлення про суїцидальні думки та поведінку у пацієнтів, які лікувалися протиепілептичними лікарськими засобами за різними показаннями. Мета-аналіз рандомізованих плацебо-контрольованих досліджень також показав невелике підвищення ризику суїцидальних думок та поведінки. Механізм такого ризику невідомий, та доступні дані не виключають можливості підвищення ризику для ацетазоламід.

Тому слід проводити моніторинг щодо ознак суїцидальних думок та поведінки, а також розглянути необхідність відповідного лікування. Пацієнтам (та особам, які наглядають за пацієнтами) слід рекомендувати негайно звертатися по медичну допомогу при виникненні ознак суїцидальних думок чи поведінки.

Ацетазоламід, призначений у дозах, вищих за рекомендовані, не призводить до збільшення діурезу, однак може спричинити сонливість і парестезію, іноді може призвести навіть до зменшення діурезу. За певних умов, однак, необхідно застосовувати дуже великі дози у комбінації з іншими діуретиками для забезпечення діурезу при повній рефрактерній серцевій недостатності.

Під час лікування ацетазоламідом відзначали як зниження, так і підвищення рівня глюкози у плазмі крові, це слід враховувати при призначенні лікарського засобу з порушенням толерантності до глюкози або цукровим діабетом.

При тривалій терапії необхідні особливі міри перестороги. Слід попередити пацієнта про необхідність повідомляти про усі випадки появи змін з боку шкіри. Рекомендується проводити періодичний моніторинг картини крові та рівня електrolітів у сироватці крові (особливо рівня калію і рН крові), а також контроль картини периферичної крові. Мали місце летальні наслідки через серйозні реакції на сульфонаміди, хоча такі випадки були рідкими. У випадку різкого зменшення кількості формених елементів крові або появи токсичних змін з боку шкіри препарат необхідно терміново відмінити.

Застосовувати з обережністю при емболії легеневої артерії та емфіземі легенів, непрохідністю/обтурацією нижніх дихальних шляхів, у яких може бути знижена альвеолярна вентиляція, при нирковій недостатності, а також хворим літнього віку у зв'язку з підвищеним ризиком розвитку метаболічного ацидозу.

Некардіогенний набряк легень

Повідомлялося про тяжкі випадки некардіогенного набряку легень після прийому ацетазоламід, також після одноразової дози (див. розділ «Побічні реакції»). Некардіогенний набряк легень зазвичай розвивається протягом декількох хвилин або годин після прийому ацетазоламід. Симптоми включали задишку, гіпоксію та дихальну недостатність. Якщо є підозра на некардіогенний набряк легень, ацетазоламід слід відмінити та призначити підтримуюче лікування. Ацетазоламід не слід призначати пацієнтам, у яких раніше спостерігався некардіогенний набряк легень після прийому ацетазоламід.

У пацієнтів із конкрементами у нирках в анамнезі слід оцінити співвідношення ризик/користь для подальшого осадження конкрементів.

Препарат алкіризує сечу.

Розвиток генералізованої еритеми на тлі застосування лікарського засобу, що супроводжується появою пустул та гарячки, може бути симптомом гострого генералізованого екзематозного пустульозу. При діагностиці такого стану лікування ацетазоламідом слід відмінити, у подальшому призначення лікарського засобу протипоказано.

Узгоджено з матеріалами
реєстраційного досьє

У разі гіперчутливості можливе виникнення симптомів, які можуть загрожувати життю пацієнта, наприклад, синдром Стівенса-Джонсона, синдром Лайєлла, блискавичний некроз печінки, агранулоцитоз, апластична анемія та геморагічний діатез.

У випадку розвитку шкірних або гематологічних проявів прийом препарату слід негайно припинити.

Ацетазоламід слід з обережністю призначати пацієнтам, які приймають ацетилсаліцилову кислоту (високі дози), оскільки існує імовірність розвитку анорексії, прискорення дихання, летаргічного стану, коми та навіть летального наслідку.

При пропусканні чергової дози не слід підвищувати дозу у наступний прийом.

Якщо пацієнт приймає ацетазоламід довше 5 днів, є ризик розвитку метаболічного ацидозу.

Повідомлялося про випадки хоріоїдального випоту/відшарування після застосування ацетазоламиду. Симптоми включають гострий початок зниження гостроти зору або біль в оці і, як правило, виникають протягом декількох годин або тижнів з початку застосування препарату. При підозрі на хоріоїдальний випіт/відшарування слід відмінити застосування ацетазоламиду якомога швидше.

Лабораторні дослідження

Рекомендується проводити контроль картини крові та рівня тромбоцитів на початку лікування та періодично протягом лікування, також рекомендується контролювати рівень електролітів плазми у крові.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність

Ацетазоламід проникає через плацентарний бар'єр. Застосування препарату у період вагітності протипоказано.

Годування груддю

Ацетазоламід у невеликій кількості проникає у грудне молоко. Під час застосування препарату годування груддю слід припинити.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Ацетазоламід у високих дозах може спричиняти сонливість, рідше – стомлюваність, запаморочення, атаксію та дезорієнтацію. Тому під час лікування ацетазоламідом не слід керувати потенційно небезпечними механізмами та автомобілем.

Спосіб застосування та дози.

Препарат приймати внутрішньо.

Лікування глаукоми

Дозу препарату визначати індивідуально залежно від внутрішньоочного тиску.

Рекомендовані дози для дорослих:

<i>При відкритокутовій глаукомі</i>	250 мг (1 таблетка) 1–4 рази на добу. Доза понад 1000 мг (4 таблетки) не підвищує терапевтичну ефективність.
<i>При вторинній глаукомі</i>	250 мг (1 таблетка) кожні 4 години. У деяких пацієнтів терапевтичний ефект спостерігається після прийому 250 мг (1 таблетка) двічі на добу (тривале призначення не показано).
<i>При гострих нападах закритокутової глаукоми</i>	250 мг (1 таблетка) 4 рази на добу.

Лікування епілепсії

Дорослі та діти	Як правило, 8–30 мг/кг маси тіла на добу. Дозу застосовувати в 1–4 прийоми. Оптимальна доза
-----------------	--



Узгоджено з матеріалами
реєстраційного досьє

становить 250–1000 мг (1–4 таблетки).

При одночасному застосуванні ацетазоламід з іншими протисудомними препаратами початкова доза першого має становити 250 мг (1 таблетку) на добу. Дозу при необхідності підвищувати поступово. Для дітей доза не має перевищувати 750 мг на добу.

Лікування набряків при серцевій недостатності та набряків, спричинених застосуванням лікарських засобів

Початкова доза 250 мг на добу (1 таблетка) вранці.

Найкращий діуретичний ефект спостерігається, якщо застосовувати препарат через день або через 2 дні з одноденною перервою.

При лікуванні серцевої недостатності ацетазоламід призначати на тлі загальноприйнятої терапії (наприклад, призначення глікозидів наперстянки, низькосольова дієта та поповнення дефіциту калію).

Лікування висотної хвороби

Рекомендована добова доза становить 500–1000 мг (2–4 таблетки), розподілена на кілька прийомів. У разі передбачуваного швидкого підйому на висоту (більше 500 м на добу) рекомендована доза становить 1000 мг (4 таблетки), розподілена на кілька прийомів.

Препарат слід приймати за 24–48 годин до підйому вгору, а в разі появи симптомів хвороби лікування слід продовжити ще 48 годин або більше при необхідності.

Діти.

Препарат застосовувати для лікування дітей віком від 3 років тільки як допоміжну терапію при епілепсії.

Передозування.

Не описанні симптоми передозування та гострого отруєння у людей. У випадку передозування можливі порушення електролітного балансу, ацидоз і порушення з боку центральної нервової системи (сонливість, парестезії); іноді – зменшення діурезу. Тому слід контролювати концентрації, електролітів в плазмі крові, особливо калію, а також рН сечі.

Лікування.

Відміна препарату, симптоматична терапія, при ацидозі призначати бікарбонати. Ефективний гемодіаліз. Специфічного антидоту не існує.

Побічні реакції.

Під час лікування ацетазоламідом спостерігалися наступні побічні явища, зазначені нижче, з такою частотою виникнення: дуже часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), рідко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$), дуже рідко ($\geq 1/100000$, $< 1/10000$), частота невідома (не може бути визначена згідно з наявною інформацією).

З боку системи крові

Рідко: апластична анемія, тромбоцитопенія, агранулоцитоз, лейкопенія, тромбоцитопенічна пурпура, пригнічення кісткового мозку, панцитопенія.

В окремих випадках при тривалому застосуванні – гемолітична анемія.

З боку обміну речовин

Часто: анорексія, метаболічний ацидоз, порушення водно-електролітного балансу (у поєднанні з гіпонатріємією та гіпокаліємією).

Частота невідома: гіпокальціємія, зменшення маси тіла (при тривалому застосуванні).

З боку психіки

Нечасто: депресія.

З боку нервової системи та органів чуття

Часто: запаморочення, порушення смакових відчуттів, парестезії (відчуття повзання мурашок у кінцівках).

Нечасто: припливи, спрага, головний біль, дратівливість, зниження лібідо.

Повідомляли про поодинокі випадки: сонливість, сплутаність свідомості, в'ялий параліч, судоми.

Частота невідома: атаксія; при тривалому застосуванні – дезорієнтація, порушення дотику та

Узгоджено з матеріалами
реєстраційного досьє

чутливості, загальна слабкість, периферичний параліч; у поодиноких випадках – відчуття волосся на язиці.

З боку органів зору

Рідко: оборотна міопія.

Частота невідома: хоріоїдальний випіт, хоріоїдальне відшарування.

З боку органів слуху та рівноваги

Рідко: шум у вухах, порушення слуху.

З боку дихальних шляхів та органів середостіння

Невідомо: некардіогенний набряк легень.

З боку шлунково-кишкового тракту

Нечасто: нудота, блювання, діарея, мелена.

З боку печінки та жовчовивідних шляхів

Нечасто: порушення функції печінки.

Рідко: блискавичний некроз печінки, гепатит, механічна жовтяниця.

Частота невідома: печінкова недостатність, печінкова коліка.

З боку шкіри та її похідних

Рідко: мультиформна еритема, синдром Стівенса-Джонсона, фотосенсибілізація, шкірний висип, синдром Лайелла, кропив'янка.

Частота невідома: гострий генералізований екзематозний пустульоз, свербіж, еритема.

З боку сечовидільної системи

Нечасто: нефролітіаз, кристалурія, ниркова коліка, пошкодження нирки, поліурія, гематурія, ниркова недостатність.

Рідко: глюкозурія.

Частота невідома: часте сечовипускання.

Загальні розлади

Часто: втомлюваність.

Нечасто: гарячка.

З боку імунної системи

Рідко: реакції гіперчутливості, включаючи анафілактичні реакції.

Дослідження

Дуже рідко: гіпоглікемія, гіперглікемія.

Ацетазоламід, як похідне сульфонаміду, може спричиняти побічні реакції, характерні для сульфонамідів.

Термін придатності. 5 років.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25 °С в оригінальній упаковці.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 10 таблеток у блістері; по 3 блістери у картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

Виробництво готового лікарського засобу, первинне, вторинне пакування, контроль якості та випуск серії:

Фармацевтичний Завод «Польфарма» С. А., Польща/
Pharmaceutical Works «Polpharma» S.A., Poland.

Первинне, вторинне пакування, контроль якості та випуск серії:

Фармацевтичний завод «ПОЛЬФАРМА» С.А. Відділ Медана в Серадзі/
Pharmaceutical Works POLPHARMA S.A. Medana Branch in Sieradz.

Узгоджено з матеріалами
реєстраційного досьє

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Вул. Пельплиньська 19, 83-200, Старогард Гданьски, Польща/

19, Pelplinska Str., 83-200 Starogard Gdanski, Poland.

Вул. Польської Організації Військової 57, 98-200 Серадз, Польща/

57, Polskiej Organizacji Wojskowej Str., 98-200 Sieradz, Poland.

Дата останнього перегляду. *25.11.2024*



Узгоджено з матеріалами
реєстраційного досьє