

ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування препарату

ДІАКАРБ (DIACARB)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: ацетазоламід;

основні фізико-хімічні властивості: біла, кругла, гладка, пласка таблетка з обох боків;

склад: 1 таблетка містить 250 мг ацетазоламіду;

допоміжні речовини: крохмаль картопляний, тальк, натрію крохмальгліколят.

Форма випуску. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Протиглаукомні препарати та міотичні засоби.

Код АТС S01E C01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Ацетазоламід є потужним інгібітором карбоангідрази, має слабкий діуретичний ефект. Механізм дії включає пригнічення вивільнення іонів Na^+ та H^+ з вуглецевої кислоти. Карбоангідраза каталізує реакцію, в результаті якої утворюється вуглецева кислота. Пригнічення цього ферменту ацетазоламідом призводить до пригнічення синтезу вуглецевої кислоти у проксимальних каналцях. Дефіцит вуглецевої кислоти, яка є джерелом іонів водню, підсилює виведення води та натрію. Ефект ацетазоламіду полягає у посиленні натрійурезу та діурезу. Ацетазоламід втрачає свої діуретичні властивості через три дні застосування. Короткочасна перерва у застосуванні призводить до відновлення діуретичного ефекту ацетазоламіду, оскільки відновлюється активність карбоангідрази. Ацетазоламід підвищує не тільки виведення натрію, а також і бікарбонатів, що може бути причиною метаболічного ацидозу. Виведення значної кількості натрію, спричинене прийомом ацетазоламіду, призводить до посилення виведення води, що супроводжується втратою калію та спричинює гіпокаліємію. Ацетазоламід призводить також до підвищеного виведення фосфатів, магнію та кальцію із сечею, що, відповідно, може призвести до метаболічних порушень.

Екстраренальний ефект ацетазоламіду використовується для лікування глаукоми. Ацетазоламід зменшує кількість рідини, яка виробляється оком, і, завдяки цьому зменшується внутрішньоочний тиск. Препарат також використовується як ад'ювантна терапія при лікуванні епілепсії.

Пригнічення карбоангідрази в центральній нервовій системі (ЦНС) затримує аномальну нейрональну передачу.

Фармакокінетика. Ацетазоламід добре всмоктується із шлунково-кишкового тракту (ЖКТ). Після прийому внутрішньо у дозі 500 мг максимальна концентрація C_{max} (12-27 $\mu\text{g}/\text{ml}$) досягається через 1–3 години. Невеликі концентрації ацетазоламіду підтримуються у крові протягом 24 годин.

Розподіл

Ацетазоламід розподіляється в багатьох тканинах. В основному він потрапляє в еритроцити, плазму, нирки та у значній кількості в печінку, м'язи, очі та ЦНС. Препарат не накопичується у тканинах. Ацетазоламід проникає крізь плацентарний бар'єр та у невеликій кількості потрапляє у грудне молоко.

Метаболізм

Ацетазоламід не метаболізується.

Виведення

Препарат виділяється нирками у незмінену вигляді. Після прийому внутрішньо близько 90%

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

прийнятої дози виводиться із сечею протягом 24 годин.

Показання для застосування.

Лікування

- хронічної глаукоми з відкритим кутом;
- вторинної глаукоми;
- глаукоми із закритим кутом (для короткочасної передопераційної терапії та перед офтальмологічними процедурами, які можуть спровокувати гострий напад глаукоми із закритим кутом, для зменшення внутрішньо- очного 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.

Спосіб застосування та дози.

Препарат приймають внутрішньо.

Лікування глаукоми

Дозу препарату визначають індивідуально, залежно від внутрішньоочного тиску. Рекомендовані дози для дорослих :

<i>При глаукомі з відкритим кутом</i>	250 мг (одна таблетка) 1 – 4 рази на день. Доза більше за 1000 мг (4 таблетки) не підвищує терапевтичну ефективність.
<i>При вторинній глаукомі</i>	250 мг (одна таблетка) кожні 4 години. У деяких пацієнтів терапевтичний ефект спостерігається після прийому 250 мг (однієї таблетки) двічі на день (тривале призначення не показано).
<i>При гострих нападах глаукоми із закритим кутом</i>	250 мг (одна таблетка) 4 рази на день.

Лікування епілепсії

Дорослі та діти	Як правило, 8-30 мг/кг маси тіла на добу. Доза застосовується в 1 – 4 прийоми. Оптимальна доза становить 375 – 1000 мг (1½ - 4 таблетки).
При одночасному застосуванні ацетазоламід з іншими протисудомними препаратами початкова доза першого повинна становити 250 мг (одна таблетка) на день. Дозу за необхідності підвищують поступово. Для дітей доза не повинна перевищувати 750 мг/ на день.	

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

Початкова доза 250 – 375 мг/ на день (1 - 1½ таблетки), вранці.

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

При лікуванні серцевої недостатності ацетазоламід призначають на фоні загально- прийнятої терапії (наприклад призначення серцевих глікозидів, дієта із зменшеною кількістю натрію, препарати калію).

Лікування висотної хвороби

Рекомендована денна доза становить 500 – 1000 мг (2–4 таблетки), розділена на декілька прийомів.

У разі передбачуваного швидкого підйому на висоту рекомендована доза становить 1000 мг (4 таблетки), розділена на декілька прийомів.

Препарат слід приймати за 24-48 годин до підйому вгору, а в разі проявів хвороби лікування слід продовжити ще 48 годин або більше за необхідності.

Побічна дія.

Небажані явища найчастіше спостерігаються на початку лікування і включають парестезію, порушення слуху або гудіння у вухах, втрату апетиту, зміну смакових відчуттів, нудоту, блювання, діарею та полакіурію (часте сечовипускання), спорадично сонливість і дезорієнтацію. Можливі ацидоз і порушення електролітного балансу. Спостерігалася мінуча міопія. Інші небажані явища включали кропив'янку, гематурію, глюкозурію, печінкову недостатність, незначний параліч і фотогіперчутливість, печінкову та ниркову коліки. Оскільки ацетазоламід є сульфонамідним дериватом, він може спричинювати небажані явища, притаманні сульфонамідам, які включають пропасницю, агранулоцитоз, тромбоцитопенію, лейкопенію та апластичну анемію, недостатність кісткового мозку, панцитопенію, висип у формі мультиформної еритеми, синдром Стівенса - Джонсона, синдром Лаелла.

Протипоказання. Ацетазоламід протипоказаний пацієнтам:

- з гіперчутливістю до сульфонамідів або до будь-якого компонента препарату;
- зі зниженим рівнем натрію та калію в крові;
- з порушеннями функції печінки (ризик розвитку енцефалопатії при захворюваннях печінки);
- з порушеннями функції нирок;
- з недостатністю надниркових залоз;
- хворим на гіперхлоремічний ацидоз;
- з хронічною некомпенсованою глаукомою з закритим кутом, яка потребує тривалого лікування;
- з цукровим діабетом;
- з сечокам'яною хворобою (при гіперкальціурії);
- в період годування груддю;
- під час вагітності.

Передозування.

У випадку передозування можливі порушення електролітного балансу, ацидоз і порушення з боку ЦНС. У зв'язку з цим необхідно контролювати рівень електролітів, особливо рівень калію та рН крові. Лікування - симптоматичне. Специфічного антидоту немає. У випадку ацидозу пацієнту призначаються бікарбонати. Ацетазоламід видаляється при гемодіалізі.

Особливості застосування.

У разі гіперчутливості іноді виникають симптоми, які можуть загрожувати життю пацієнта,

наприклад синдром Стівенса - Джонсона, синдром Лаелла, швидкоплинний 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 ймовірність розвитку анорексії, прискорення дихання, летаргічного стану, коми та навіть смерті.

Ацетазоламід, призначений у дозах, вищих за рекомендовані, не призведе до збільшення діурезу, однак може спричинювати сонливість і парестезію, іноді може призвести навіть до зменшення діурезу.

Препарат може посилити ацидоз, тому його слід призначати з обережністю хворим на легенеvu емболію та емфізему.

Препарат призводить до алкалізації сечі (збільшення рН).

Рекомендується провести повний аналіз крові перед початком лікування і протягом курсу лікування.

Періодично показаний контроль електролітів сироватки.

Вагітність: категорія С.

Ацетазоламід проникає крізь плацентарний бар'єр. Ацетазоламід був тератогенним та ембріотоксичним для мишей, щурів, хом'яків і кролів у дозі, що у 10 разів перевищувала рекомендовану для людей, та була введена внутрішньо. Адекватні та добре контрольовані клінічні дослідження тератогенності у вагітних жінок не проводилися. Тому препарат не слід призначати вагітним, особливо у першій триместр вагітності. В будь-якому разі при призначенні препарату вагітним слід ретельно зважити очікувану користь для матері та потенційний ризик для плоду.

Лактація. Ацетазоламід у невеликій кількості виділяється у грудне молоко. Під час прийому препарату годування груддю слід припинити.

Дитячий вік. Діакарб застосовують для лікування у дітей тільки як ад'ювантну терапію при епілепсії.

Вплив на здатність керувати транспортними засобами та механізмами. Ацетазоламід у високих дозах може спричинювати сонливість, рідше - стомлюваність, запаморочення, атаксію та дезорієнтацію. Тому під час лікування ацетазоламідом не слід керувати потенційно небезпечними механізмами та автомобілем.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Ацетазоламід може посилювати дію антагоністів фолієвої кислоти, гіпоглікемічних засобів та антикоагулянтів, що приймають внутрішньо.

Одночасне застосування ацетазоламід у з ацетилсаліциловою кислотою може призвести до тяжкого ацидозу та токсично вплинути на ЦНС.

При одночасному застосуванні ацетазоламід у із серцевими глікозидами або ліками, що підвищують артеріальний тиск, доза першого повинна бути змінена.

Ацетазоламід порушує метаболізм фенітоїну, підвищуючи концентрації останнього в сироватці крові. У деяких пацієнтів, які приймали ацетазоламід з деякими протисудомними засобами (фенітоїном, примідоном), спостерігалася тяжка форма остеомалачії.

Умови та термін зберігання.

Зберігати при температурі нижче 25 °С в сухому, захищеному від світла місці, недоступному для дітей. Термін придатності – 5 років.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 12 таблеток у блістері; по 2 блістери в коробці картонній.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Виробник. Фармацевтичний завод „Польфарма” С.А., Польща /
Pharmaceutical Works “Polpharma” S.A., Poland.

Адреса. Вул. Пельплинська, 19, 83-200 Старогард Гданьски, Польща /
19 Pelplinska street, 83-200 Starogard Gdanski, Poland.