

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ЗЕПТОЛ
(ZERTOL)

Загальна характеристика:

міжнародна назва: carbamazepine;

основні фізико-хімічні властивості: білі, круглі, плоскі таблетки з фаскою, з розподільчою рискою на одному боці, на іншому – відтиснуто “Zeptol-200”;

склад: 1 таблетка містить карбамазепіну 200 мг;

допоміжні речовини: целюлоза мікрокристалічна, полівінілпіролідон, кремнію діоксид колоїдний безводний, натрію пропілпарабен, тальк очищений, магнію стеарат, натрію крохмальгліколят, натрію лаурилсульфат, крохмаль кукурудзяний, гіпромелоза, бронопол.

Форма випуску. Таблетки.

Фармакотерапевтична група. Протиепілептичні засоби. Код АТС N03A F01.

Фармакологічні властивості. Активний компонент таблеток – карбамазепін має протисудомну та помірну антипсихотичну дію; має також анальгезуючу дію при невралгії, особливо трійчастого нерва. При нецукровому діабеті має антидіуретичну дію. Механізм дії карбамазепіну як протисудомного засобу, очевидно, ґрунтується на його здатності знижувати збудливість постсинаптичних мембран і блокувати проведення нервового імпульсу.

Фармакокінетика. Карбамазепін повільно, але майже повністю всмоктується із шлунково-кишкового тракту. Зв'язування препарату з білками крові досягає 76%. Рівень карбамазепіну у сироватці крові змінюється в межах від 6,5 до 25 мкг/мл. У спинномозковій рідині утворюються концентрації пропорційно до частки незв'язаної з білками активної речовини (20 - 30%). Потрапляє у грудне молоко (25 - 60% від рівня у плазмі) і через плацентарний бар'єр. Уявний об'єм розподілу становить 0,8 - 1,9 л/кг. Біотрансформується у печінці з утворенням основного метаболіту – карбамазепін-10,11-епоксиду. Період напіввиведення – 20 - 65 год. При тривалому застосуванні – 8 - 29 год (внаслідок індукції ферментів метаболізму); у пацієнтів, у яких застосовують індуктори монооксигеназної системи (фенітоїн, фенобарбітал) період напіввиведення становить 8 - 10 год. Після одноразового внутрішнього застосування 400 мг 72% застосованої дози виводиться нирками і 28% – через кишечник. У сечі виявляється 2% незміненого карбамазепіну, 1% – активного 10,11-епоксидного деривату і приблизно 30% інших метаболітів. У дітей екскреція прискорена. Початок протисудомної дії варіює від декількох годин до декількох діб (інколи до 1 міс.) антинеуралгічна дія розвивається через 8 - 72 год, антипсихотична – через 7 - 10 діб.

Показання для застосування.

1. Епілепсія:

– фокальні епілептичні напади з простою або складною симптоматикою (психомоторні еквіваленти, скронева епілепсія);

– генералізовані тоніко-клонічні епілептичні напади (великі судомні напади); змішані епілептичні напади, у тому числі вищезазначені.

2. Невралгія трійчастого нерва, глософарингеальна невралгія.

3. Маніакально-депресивний психоз.

Спосіб застосування та дози.

1. Епілепсія.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Для дорослих початкова доза становить 200 мг 1 або 2 рази на день.

Потім дозу повільно збільшують до оптимальної, яка зазвичай становить 600 - 1 200 мг у декілька прийомів. Максимальна добова доза – 1 800 мг.

Середня добова доза для дітей становить 20 мг на 1 кг маси тіла:

– 3 - 5 років – 200 - 400 мг на добу,

– 5 - 10 років – 400 - 600 мг на добу,

– 10 - 15 років – 600 - 1 000 мг на добу.

Вказані добові дози приймаються у кілька прийомів.

2. Невралгії трійчастого нерва.

Початкова доза становить 200 - 400 мг на добу, які розподіляють на 1 - 2 прийоми. Цю дозу підвищують аж до повного зникнення болю в середньому на 400 - 800 мг на добу, які розподіляють на 2 - 4 прийоми. Після цього у певної частини хворих лікування може бути продовжене нижчою підтримуючою дозою, яка ще може застерігати напади болю і становить 400 мг, які розподіляють на 2 прийоми.

Літнім і чутливим хворим Зептол призначають у початковій дозі, яка становить 200 мг на добу (по ½ таблетки 2 рази на добу).

3. Маніакально-депресивний психоз.

Початкова доза препарату становить 400 мг на день за кілька прийомів з поступовим збільшенням до необхідної. Середня добова доза становить 400 - 600 мг. Максимальна добова доза – 1 600 мг за кілька прийомів.

Побічна дія. Зазвичай Зептол добре переноситься хворими. Побічні явища, що зустрічаються найчастіше на фоні терапії препаратом, включають: запаморочення, сонливість, нудоту, блювання. В основному ці явища спостерігаються на початку терапії.

Щоб знизити інтенсивність цих проявів, необхідно починати терапію з низьких доз. Інші побічні явища спостерігаються рідко. До них належать зміни з боку таких органів і систем.

Кровотворна система: апластична анемія, агранулоцитоз, панцитопенія, тромбоцитопенія, лейкопенія, лейкоцитоз, еозинофілія.

Шкіра: свербіж, еритематозні висипання, кропив'янка, токсичний епідермальний некроз (синдром Лайєла), синдром Стівенса-Джонсона, зміни пігментації шкіри, ексфолюативний дерматит, мультиформна еритема, алопеція, вовчакоподібний синдром. У деяких випадках інтенсивність проявів змушує припинити терапію.

Серцево-судинна система: застійна серцева недостатність, набряк, гіпотензія, колапс, посилення симптомів стенокардії, аритмія, атріовентрикулярна блокада і тромбофлебіт. У деяких випадках ці розлади призводили до смерті.

Печінка: зміни показників печінкових проб (тимчасове підвищення активності ферментів печінки), холестатична і гепатоцелюлярна жовтяниця, гепатит.

Система органів дихання: задишка, пневмонія.

Сечостатева система: прискорене сечовипускання, гостра затримка сечі, олігурія, що супроводжується підвищенням артеріального тиску, азотемія, ниркова недостатність, імпотенція. Є дані про випадки альбумінурії, глікурії, підвищення концентрації азоту сечовини у крові, збільшення мікроскопічного осаду сечі.

Нервова система: запаморочення, сонливість, порушення координації руху, сплутаність свідомості, головний біль, втома, порушення акомодатії, зорові галюцинації, мінуща диплопія, ністагм, розлад мови, мимовільні рухи, периферичний неврит, парестезії, тривога, депресія, шум у вухах, гіперакузія.

Травна система: нудота, блювання, неприємні відчуття в епігастрії, діарея, запор, зниження апетиту, сухість у роті, глосит, стоматит.

Кісткова система: біль у суглобах і м'язах, судоми ікроножних м'язів.

Ендокринна система: є дані про виникнення синдрому недостатності секреції антидіуретичного гормону на фоні терапії карбамазепіном, а також випадки гіпонатріємії.

Інші: у пацієнтів літнього віку може спостерігатися сплутаність свідомості та ажитація на фоні прийому препарату. Можлива екзацербация психотичних розладів.

Протипоказання. Розлади атріовентрикулярної провідності (за виключенням пацієнтів з імплантованим пейсмейкером); підвищена чутливість до препарату або трициклічних антидепресантів; одночасне застосування інгібіторів моноаміноксидази; пригнічення функції кісткового мозку в анамнезі. Дитячий вік до 3 років.

Передозування.

Симптоми: сплутаність свідомості, атаксія і гіперкінези, у складніших випадках – пригнічення дихання, кома, судоми і зміни на електрокардіограмі.

Лікування: специфічний антидот відсутній. Показано визначення карбамазепіну в плазмі, промивання шлунка, призначення активованого вугілля. Підтримуюча і симптоматична терапія. Гемодіаліз і перитонеальний діаліз неефективні.

Особливості застосування. До групи ризику застосування препарату належать пацієнти, які мають в анамнезі випадки побічних гематологічних реакцій до будь-якого іншого лікарського засобу. Є відомості про тяжкі шкірні реакції, включаючи епідермальний некроліз (синдром Лайєла) і синдром Стівенса-Джонсона, на фоні прийому карбамазепіну. Проте подібні побічні ефекти зустрічаються дуже рідко. Було кілька повідомлень про випадки смерті на фоні терапії карбамазепіном.

Є дані про те, що карбамазепін має деяку холінолітичну активність, тому особливий контроль повинен бути встановлений за пацієнтами літнього віку з підвищеним внутрішньоочним тиском.

Запобіжні заходи.

До початку терапії потрібно зібрати докладний анамнез і провести обстеження пацієнта, щоб оцінити співвідношення ризик/користь. Призначати Зептол з обережністю хворим за наявності в анамнезі захворювань серця, печінки, нирок та при гематологічних порушеннях.

Пацієнт повинен повідомляти про будь-які ознаки патології з боку кровотворення (схильність до появи синців, петехіальні та пурпурні крововиливи), а також такі як пропасниця, фарингіт/ангіна, стоматит/гінгівіт.

У зв'язку із запамороченням і сонливістю, що можуть спостерігатися на фоні терапії карбамазепіном, пацієнти повинні бути попереджені, що небезпечно керувати автомобілем, працювати зі складними механізмами, брати участь у висотних роботах, що потребують концентрації уваги і скоординованості рухів. До початку терапії Зептолом слід провести оцінку ниркової і печінкової функцій, а також рутинний аналіз крові. Зазначені аналізи слід періодично повторювати. При виявленні значних порушень препарат слід відмінити.

Моніторинг концентрації карбамазепіну в сироватці крові особливо корисний для перевірки виконання продиктованих схем приймання препарату, а також у разі раптового почастішання нападів.

Вагітність і лактація.

Даних про застосування карбамазепіну у вагітних недостатньо. Не рекомендується призначати препарат у перші три місяці вагітності. Призначаючи Зептол вагітним, слід уважно проаналізувати співвідношення ризик/користь для матері і плода. Катамнестичне обстеження хворих, які застосовують карбамазепін ізольовано та в комбінації з іншими протисудомними засобами, показало, що комбінована терапія може спричинити тератогенні ефекти, у зв'язку з чим монотерапії карбамазепіном у вагітних жінок надають перевагу. Припиняти протисудомну терапію не можна, тому що існує можливість рецидиву епілептичного нападу, що супроводжується гіпоксією та небезпечністю для життя. В окремих випадках, коли припинення терапії внаслідок малої частоти виваженості нападів не може бути небезпечним для пацієнта, до настання вагітності або під час її можливе переривання терапії, проте не можна з упевненістю підтверджувати, що навіть незначний напад не несе в собі небезпеку для життя і розвитку плода. Дія препарату на пологи у жінок невідома. Під час лактації концентрація карбамазепіну у жіночому молоці становить 6% від концентрації препарату в сироватці, тому рекомендується припинити годування або приймати препарат, залежно від ступеня необхідності

Сторінка 4 з 4. Видаєник: Державний експертний центр МОЗ України
приймання препарату для матері.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. Одночасне застосування фенобарбіталу, фенітоїну і карбамазепіну спричиняє значне зниження концентрації карбамазепіну в сироватці. Періоди напіввиведення фенітоїну, варфарину, доксицикліну і теофіліну значно скорочуються при одночасному застосуванні їх з карбамазепіном. При поєднанні карбамазепіну з галоперидолом рівень останнього в сироватці крові може знижуватися, у такому разі дозу галоперидолу слід збільшити. Рівень карбамазепіну в сироватці крові може підвищуватися при поєднаному застосуванні його з еритроміцином, циметидином, пропоксифеном, ізоніазидом, блокаторами кальцієвих каналів. У деяких випадках це може бути причиною виникнення токсичних реакцій. Одночасне застосування карбамазепіну і літію збільшує ризик нейротоксичних реакцій. Є дані про зміну функції щитовидної залози при комбінації карбамазепіну з іншими протисудомними засобами. При одночасному прийманні карбамазепіну з протизаплідними засобами може знизитися ефективність останніх. Описані випадки кровотеч.

Умови та термін зберігання. Зберігати у недоступному для дітей, сухому, захищеному від світла місці при температурі не вище 25 С. Термін придатності – 5 років.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 10 таблеток у стрипі, по 10 стрипів у картонній коробці.

Виробник. САН ФАРМАСЬЮТИКАЛ ІНДАСТРІЗ ЛТД.

Адреса. *Офіс.* Acme Plaza, Andheri-Kurla Road, Andheri East, Mumbai 400059, India.

Екме Плаза, Ендхері-Курла Роад, Ендхері Іаст, Мумбай 400059, Індія.

Завод: Survey No 214, Government Industrial Area, Phase II, Silvassa – 326 230 (U.T. Dadra & Nagar Haveli), India.

Сурвей № 214, Гавернмент Індастріал Ерія, Фаза ІІ, Сілвасса – 396 230, (У.Т. Дадра & Нагар Хавелі), Індія.