

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

КАРБАЛЕКС 300 мг ретард
(CARBALEX 300 mg retard)
КАРБАЛЕКС 600 мг ретард
(CARBALEX 600 mg retard)

Загальна характеристика:

міжнародна назва: карбамазепін;

основні фізико-хімічні властивості: для Карбалекс 300 мг ретард: білі або майже білі, круглі таблетки з двома розподільними рисками, що перетинаються з одного боку таблетки і вибитим логотипом «GEROT» - з іншого;

для Карбалекс 600 мг ретард: білі або майже білі, продовгуваті таблетки з рискою з обох боків таблетки;

склад: 1 таблетка Карбалекс 300 мг ретард містить карбамазепіну 300 мг;

1 таблетка Карбалекс 600 мг ретард містить карбамазепіну 600 мг;

допоміжні речовини: метакрилатного сополімеру дисперсія, амонійно-метакрилатний сополімер, кремній колоїдний безводний, магнію стеарат, тальк, натрію крохмаль гліколят, целюлоза мікрокристалічна.

Форма випуску. Таблетки пролонгованої дії.

Фармакотерапевтична група. Протиепілептичні засоби. Карбамазепін.

Код АТС N03AF01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Карбамазепін виявляє протисудомну (протиепілептичну) і помірну антидепресивну (тимолептичну) і нормотимічну дію.

Блокує натрієві канали мембран гіперактивних нервових клітин, знижує вплив збуджуючих нейромедіаторних амінокислот (глутамата, аспартата), посилює гальмівні (ГАМКергічні) процеси і взаємодію з центральними аденозиновими рецепторами.

Антиманіакальні властивості обумовлені пригніченням метаболізму дофаміну і норадреналіну.

Протисудомна дія виявляється при парціальних і генералізованих нападах (*grand mal*).

Ефективний (особливо у дітей і підлітків) для блокування симптомів тривожності і депресії, а також зменшення дратівливості і агресивності (епілепсія).

Попереджує напади невралгії трійчастого нерва, зменшує виразність клінічних проявів алкогольної абстиненції (у тому числі збудження, тремор, порушення ходи) і знижує судомну активність.

При нецукровому діабеті зменшує діурез і відчуття спраги.

Фармакокінетика. Після орального застосування карбамазепін майже повністю всмоктується зі шлунково-кишкового тракту. C_{max} при одноразовому прийомі досягається через 12 год. Зв'язок з білками плазми крові - 70-80 %. У спинномозковій рідині і слині утворюється концентрація пропорційна частці незв'язаної з білками активної речовини (20-30 %).

Проникає в материнське молоко (25-60 % від рівня в плазмі) і через плацентарний бар'єр. Уявний об'єм розподілу складає 0,8-1,9 л/кг.

$T_{1/2}$ — 25–65 год; при довготривалому застосуванні – 8-29 год (внаслідок індукції ферментів метаболізму). У пацієнтів, які застосовують індуктори монооксигеназної системи (фенітоїн, фенобарбітал), $T_{1/2}$ складає 8-10 год.

Карбамазепін метаболізується у печінці і виводиться нирками.

Пролонгована дія таблеток не залежить від прийому їжі. При бажанні таблетки можна розчинити в рідині (вода, чай, апельсиновий сік, молоко) без ризику втрати їхнього ретардного ефекту.

Інструкцію завантажено з сайту www.dovgolit.com

Початок протисудомної дії варіює від декількох годин до декількох днів (іноді до 1 місяця).

Показання для застосування.

Напади епілепсії тяжкої форми, фокальні напади, напади у скроневих долях, змішані форми нападів, психомоторне збудження.

Манія, профілактика маніакально-депресивних розладів.

Невралгія трійчастого нерва.

Діабетична невропатія.

Алкогольний абстинентний синдром.

Нецукровий діабет центрального генезу.

Спосіб застосування та дози. Приймати препарат під час або після їжі, запиваючи рідиною (не запивати грейпфрутовим соком).

Розпочинати терапію карбамазепіном слід з низьких доз, поступово зменшуючи дозу антиконвульсантів, призначених раніше.

Антиконвульсивна терапія.

Дорослі і діти старше 10 років. Розпочинати терапію слід з дози 150 мг 2 рази на добу, поступово збільшуючи дозу до досягнення індивідуальної оптимальної дози. Загалом середня терапевтична доза складає 600 мг/добу, яку приймають, як правило, ввечері, якщо призначено прийом один раз на добу.

Діти віком від 1 до 5 років – 150 мг двічі на добу (вранці і ввечері).

Діти віком від 6 до 10 років – 150 – 300 мг двічі на добу (15-20 мг/кг/добу).

Манія, профілактика маніакально-депресивних (біполярних) розладів.

Дозування може бути від 300 до 1500 мг/добу. Загалом терапію проводять в дозі 400 – 600 мг/добу за 2-3 прийоми.

При лікуванні гострих маніакальних станів дозу слід збільшувати миттєво, беручи до уваги, що малі дози мають оптимальний вплив і рекомендуються для профілактики біполярних розладів.

Невралгія трійчастого нерва.

Початкова доза 300 мг/добу, поступово збільшуючи дозу до зникнення симптомів болю. Середня добова доза - 600 мг.

Діабетична невропатія.

Середня добова доза становить 600 мг, яка може застосовуватись раз на добу або ділитися на 2 прийоми по 300 мг – вранці і ввечері.

Алкогольний абстинентний синдром.

Середня добова доза становить 600 мг. У деяких випадках слід застосовувати дозу 1200 мг/добу протягом перших днів лікування.

Дозування для пацієнтів з тяжкою нирковою недостатністю.

Пацієнти зі зниженою клубочковою фільтрацією і такі, що знаходяться на діалізі повинні застосовувати 75 % середньої дози.

Побічна дія.

На початку терапії карбамазепіном можуть спостерігатися анорексія, сухість у роті, нудота, діарея або запор.

Часто можуть спостерігатися такі побічні ефекти: головний біль, запаморочення, сонливість, стомлюваність, атаксія, порушення акомодатії, ністагм, диплопія, парестезія, парези нижніх кінцівок, розлади мови. У літніх пацієнтів також можуть спостерігатися сплутаність свідомості, збуджуваність. Дуже рідко - зорові галюцинації. Ці симптоми зникають протягом 8–14 днів без проведення будь-яких терапевтичних заходів або після зменшення дози.

При лікуванні карбамазепіном були зафіксовані такі побічні ефекти: алергічні шкірні реакції, такі як жар, ізольовані випадки пурпури, дерматиту, ексудативної еритеми (включаючи синдром Стівена-Джонса), синдром Лайєла, випадіння волосся; лейкопенія, тромбоцитопенія, агранулоцитоз, апластична анемія, поодинокі випадки лейкоцитозу, тромбоемболія, порфірія; холестатична або гепатоцелюлярна

жовтуха; урологічні розлади (гематурія, протеїнурія або ниркова недостатність); зменшення рівня Т₃ і Т₄, гіпокальціємія, зменшення рівня 25-гідроксиколекальциферолу; порушення провідності (включаючи атріовентрикулярну блокаду), брадикардія; окремі випадки реакцій підвищеної чутливості легень до препарату, що супроводжувались пропасницею, задишкою (диспноє), запаленням і фіброзами легень; менінгіти, периферична еозінофілія; синдром системного вовчака.

При високих дозах може спостерігатися тремор (також атаксія), гіпертензія або гіпотензія, аритмія.

Протипоказання.

Не слід застосовувати препарат при підвищеній чутливості до карбамазепіну або інших компонентів, що входять до складу лікарського засобу; атріовентрикулярній блокаді; гострій печінковій недостатності; ураженнях кісткового мозку, дітям віком до 1 року.

Передозування.

Симптоми гострого передозування карбамазепіном виявляються блюванням, втратою свідомості, тремором, збудженням, конвульсіями аж до коми, утрудненням дихання, зміною артеріального тиску, порушенням серцевої провідності, олігурією. Терапія симптоматична.

Особливості застосування.

Перед початком терапії карбамазепіном слід перевірити показники крові і функцію печінки.

При терапії карбамазепіном слід контролювати такі показники:

аналіз крові – щотижнево протягом першого місяця лікування, потім - щомісяця;

функція печінки – кожні 3–4 місяці, якщо показники залишаються в нормі і в коротші інтервали у випадку патологічних показників.

Якщо виявляються симптоми порушення гемопоезу, прогресують симптоми лейкопенії або алергічних шкірних реакцій, або порушується функція печінки, прийом карбамазепіну слід припинити.

Регулярне обстеження і коригування дози слід здійснювати пацієнтам із серцево-судинними захворюваннями, порушеннями функції нирок, захворюванням печінки і хворим на глаукому.

Протягом терапії слід утримуватись від вживання алкоголю.

Раптову відміну прийому карбамазепіну або перехід до прийому інших антиконвульсантів дозволяється робити тільки пацієнтам, які застосовують барбітурати або діазепам як захисну терапію.

Ефект гормональних контрацептивів знижується на тлі прийому карбамазепіну. Слід застосовувати альтернативні методи контрацепції протягом лікування карбамазепіном.

У період вагітності, насамперед у перший триместр вагітності, застосування будь-яких медичних засобів є небезпечним. Але, якщо є необхідність в антиконвульсивній терапії, не слід самовільно переривати вагітність, а зважити фактор ризик/користь для матері і плода.

У досліджах на тваринах карбамазепін виявив відносно низьку тератогенність. Низька вага плода й органів може супроводжуватись недостатнім скостенінням і вовчою пашею при застосуванні карбамазепіну у дозі, що в 10- 25 разів вища за середню терапевтичну.

Для більшої безпечності слід якомога раніше виявити найменшу ефективну дозу, шляхом дослідження плазмових концентрацій (терапевтична концентрація: 3–12 мг/л = 13-50 мкмоль/л).

Активна субстанція проникає в кров плода і в материнське молоко. Для досягнення виведення карбамазепіну у немовлят слід припинити годування груддю. Карбамазепін виділяється в материнське молоко і спричиняє утруднення смоктання немовлям внаслідок седативного впливу на ЦНС.

Слід бути обережними під час керування автотранспортом і роботи зі складними механізмами у період застосування карбамазепіну.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами.

Карбамазепін зменшує ферментіндукуючий ефект інших лікарських засобів, таких як антикоагулянти (похідні кумаринів), кінідин, гормональні контрацептиви, антибіотики (доксидиклін).

Метаболізм карбамазепіну блокується при сумісному застосуванні еритроміцину, тролеандоміцину, ізоніазиду, блокаторів кальцієвих каналів (верапаміл, дилтіазем), декстропропоксифену і вілоксазину,

що спричиняє підвищення концентрації карбамазепіну в плазмі.

Підвищення плазматичного рівня карбамазепіну також спостерігається при одночасному застосуванні інших антиконвульсантів (фенітоїн, примідон, вальпроєва кислота) або циметидин.

Комбінована терапія з препаратами літію може призвести до нейротоксичних реакцій.

Щонайменше 2 тижні має минути від часу закінчення лікування інгібіторами моноамінооксидази (МАО) і початком терапії карбамазепіном.

Грейпфрутовий сік збільшує біодоступність карбамазепіну, тому слід уникати його прийому.

Прийом карбамазепіну впливає на зміну лабораторних показників тиреоїдних гормонів.

Умови та термін зберігання. Зберігати в сухому, захищеному від світла і недоступному для дітей місці при температурі до 25°C.

Термін придатності – 5 років.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка.

Для Карбалекс 300 мг ретард і Карбалекс 600 мг ретард: по 10 таблеток у блістері, по 10 блістерів у картонній коробці.

Виробник. Герот Фармацевтика ГмбХ.

Адреса. Арнетгассе 3, А-1160 Відень.