

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ПРЕПАРАТА ДИУРЕМИД

Состав.

Действующее вещество: acetazolamide;

1 таблетка содержит ацетазоламида 250 мг;

вспомогательные вещества: крахмал картофельный, тальк, натрия крахмалгликолят (тип А).

Лекарственная форма. Таблетки.

Фармакотерапевтическая группа. Противоглаукомные препараты и миотические средства. Ингибиторы карбоангидразы. Код АТХ S01E C01.

Клинические характеристики.

Показания.

- Лечение глаукомы:
 - хроническая открытоугольная глаукома;
 - вторичная глаукома;
 - закрытоугольная глаукома (для кратковременной предоперационной терапии и перед офтальмологическими процедурами, которые могут спровоцировать острый приступ закрытоугольной глаукомы, для уменьшения внутриглазного давления).
- Лечение отеков:
 - при сердечной недостаточности;
 - отеков, вызванных применением лекарственных средств.
- Лечение эпилепсии (в комбинации с другими противосудорожными средствами):
 - petit mal (малые приступы) у детей;
 - grand mal (большие приступы) у взрослых;
 - смешанной формы.
- Лечение высотной болезни (препарат сокращает время акклиматизации, но его влияние на проявления этой болезни незначительно).

Противопоказания.

Повышенная индивидуальная чувствительность к компонентам препарата и сульфонидам, острая почечная недостаточность, выраженные нарушения функции печени, печеночная недостаточность, цирроз печени (риск развития энцефалопатии), мочекаменная болезнь (при гиперкальциурии), гиперхлоремический ацидоз, гипокалиемия, хроническая декомпенсированная закрытоугольная глаукома (для длительной терапии), сахарный диабет, уремия, недостаточность надпочечных желез.

Способ применения и дозы.

Препарат принимать внутрь.

Лечение глаукомы.

Дозу препарата определять индивидуально, в зависимости от внутриглазного давления. Рекомендованные дозы для взрослых:

При открытоугольной глаукоме	250 мг (1 таблетка) 1-4 раза в день. Доза свыше 1000 мг (4 таблетки) не повышает терапевтическую эффективность.
При вторичной глаукоме	250 мг (1 таблетка) каждые 4 часа. У некоторых пациентов терапевтический эффект наблюдается после приема 250 мг (1 таблетка) дважды в день (длительное назначение не показано).
При острых приступах закрытоугольной глаукомы	250 мг (1 таблетка) 4 раза в день.

Лечение эпилепсии.

Взрослые и дети	Как правило, 8-30 мг/кг массы тела в сутки. Дозу применять в 1-4 приема. Оптимальная доза составляет 250-1000 мг (1-4 таблетки).
При одновременном применении ацетазоламида с другими противосудорожными препаратами начальная доза первого должна составлять 250 мг (1 таблетка) в день. Дозу при необходимости повышать постепенно. Для детей доза не должна превышать 750 мг в день.	

Лечение отеков при сердечной недостаточности и отеков, вызванных применением лекарственных средств. Начальная доза – 250 мг в день (1 таблетка) утром.

Лучший диуретический эффект наблюдается, если применять препарат через день или через 2 дня с однодневным перерывом.

При лечении сердечной недостаточности ацетазоламид назначать на фоне общепринятой терапии (например, назначение сердечных гликозидов, низкосолевая диета и пополнение дефицита калия).

Лечение высотной болезни. Рекомендованная дневная доза составляет 500-1000 мг (2 – 4 таблетки), разделенная на несколько приемов.

В случае предусмотренного быстрого подъема на высоту (больше 500 м в день) рекомендованная доза составляет 1000 мг (4 таблетки), разделенная на несколько приемов.

Препарат следует принимать за 24-48 часов до подъема вверх, а в случае появления симптомов болезни лечение следует продлить еще 48 часов или больше при необходимости.

Побочные реакции.

Побочные реакции чаще всего наблюдаются в начале лечения.

Со стороны нервной системы и органов чувств: судороги, парестезии, нарушение слуха/шум

в ушах, нарушение вкусовых ощущений, головная боль, головокружение, раздражительность, депрессия, спутанность сознания, атаксия; при длительном применении – дезориентация, сонливость, нарушение осязания и чувствительности, общая слабость; в единичных случаях – ощущение волос на языке.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: анорексия, тошнота, рвота, диарея, печеночная недостаточность, печеночная колика, кишечная колика, гепатит, холестатическая желтуха, изменения показателей функции печени.

Со стороны обмена веществ: метаболический ацидоз, потеря веса, жажда, нарушения электролитного баланса (при длительном применении).

Со стороны системы крови: в отдельных случаях при длительном применении – гемолитическая анемия, лейкопения, агранулоцитоз, тромбоцитопения, панцитопения, угнетение костного мозга, апластическая анемия, тромбоцитопеническая пурпура.

Со стороны мочевыделительной системы: частое мочеиспускание, гематурия, глюкозурия, почечная колика, гипонатриемия, гипокалиемия, кристаллурия, полиурия, почечная недостаточность.

Аллергические реакции: при повышенной чувствительности к компонентам препарата – кожная сыпь, зуд, эритема, крапивница, мультиформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла.

Прочие: обратимая миопия, фотосенсибилизация, снижение либидо, приливы, лихорадка.

Передозировка.

При передозировке возможны нарушения электролитного баланса, ацидоз и нарушения со стороны центральной нервной системы (сонливость, парестезии); иногда – уменьшение диуреза.

Лечение. Отмена препарата, симптоматическая терапия, при ацидозе назначать бикарбонаты. Эффективен гемодиализ. Специфического антидота нет.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Ацетазоламид проникает через плацентарный барьер. Применение препарата в период беременности противопоказано. При необходимости лечения ацетазоламидом кормление грудью следует прекратить.

Дети. Препарат применять для лечения детей с 3 лет только как вспомогательную терапию при эпилепсии.

Особенности применения.

Применять с осторожностью при эмболии легочной артерии и эмфиземе легких, при почечной недостаточности, а также больным пожилого возраста в связи с повышенным риском развития метаболического ацидоза.

При пропуске приема очередной дозы не следует увеличивать дозу в следующий прием.

При назначении препарата более 5 дней подряд повышается риск развития метаболического

ацидоза.

При длительной терапии необходим мониторинг уровня электролитов в сыворотке (особенно уровня калия и рН крови), а также контроль картины периферической крови. В случае появления изменений в картине крови или кожных проявлений препарат необходимо срочно отменить.

В случае гиперчувствительности возможно возникновение симптомов, которые могут угрожать жизни пациента, например, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла, быстротекущий некроз печени, агранулоцитоз, апластическая анемия и геморрагический диатез. В случае развития кожных или гематологических проявлений применение препарата следует немедленно прекратить.

Назначение ацетазоламида в дозах выше рекомендованных не приводит к увеличению диуреза, однако может вызывать сонливость и парестезию, иногда может привести даже к уменьшению диуреза.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами.

Ацетазоламид в высоких дозах может вызывать сонливость, реже – утомляемость, головокружение, атаксию и дезориентацию. Поэтому во время лечения ацетазоламидом не следует управлять потенциально опасными механизмами и автомобилем.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Мочегонный эффект ацетазоламида усиливается теофиллином, ослабляется кислотообразующими диуретиками.

Ацетазоламид может усиливать действие антагонистов фолиевой кислоты, гипогликемических средств и антикоагулянтов, принимаемых внутрь.

При одновременном применении ацетазоламид повышает риск проявления токсических эффектов салицилатов, препаратов наперстянки, карбамазепина, эфедрина, недеполяризующих миорелаксантов.

Одновременное применение с ацетилсалициловой кислотой может привести к тяжелому ацидозу и токсическому влиянию на центральную нервную систему с риском развития анорексии, тахипноэ, летаргического состояния, комы с возможным летальным исходом.

Необходима коррекция дозы ацетазоламида при одновременном применении с сердечными гликозидами или средствами, повышающими артериальное давление.

Ацетазоламид нарушает метаболизм фенитоина, повышая его концентрацию в сыворотке крови. У некоторых пациентов, которые принимали ацетазоламид с некоторыми противосудорожными средствами (фенитоином, примидоном), наблюдалась тяжелая форма остеомаляции.

Одновременное применение ацетазоламида с амфетаминами, атропином или хинидином может усилить их побочное действие. Ацетазоламид может повысить или снизить концентрацию глюкозы в крови, что следует помнить при лечении сахарного диабета. Может потребоваться изменение дозы инсулина или пероральных гипогликемизирующих препаратов.

Ацетазоламид усиливает выведение лития и может ослабить его действие.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Диуретическое, противоглаукомное, противоэпилептическое средство. Механизм действия обусловлен избирательным ингибированием карбоангидразы – фермента, катализирующего обратимую реакцию гидратации диоксида углерода и последующую диссоциацию угольной кислоты. Диуретический эффект обусловлен угнетением активности карбоангидразы в почках (главным образом в проксимальных почечных канальцах), что приводит к снижению реабсорбции бикарбоната, ионов натрия и калия, усилению диуреза, повышению рН мочи, увеличению реабсорбции аммиака. Не влияет на экскрецию ионов хлора. В результате угнетения карбоангидразы цилиарного тела уменьшает секрецию водянистой влаги и снижает внутриглазное давление. Ингибирование карбоангидразы в головном мозге приводит к накоплению CO₂ в мозге и торможению чрезмерных пароксизмальных разрядов нейронов, что обуславливает противоэпилептическую активность препарата. Применение препарата при повышенном внутричерепном давлении связано с подавлением карбоангидразы в сосудистых сплетениях желудочков головного мозга и снижением продуцирования спинномозговой жидкости.

Фармакокинетика.

При приеме внутрь хорошо всасывается из желудочно-кишечного тракта. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 1-3 часа после применения, определяемые концентрации ацетазоламида сохраняются в крови в течение 24 часов. Связывается с белками плазмы в высокой степени. Благодаря высокому сродству с карбоангидразой накапливается преимущественно в тканях, содержащих этот фермент, в частности в эритроцитах, почках, мышцах, тканях глазного яблока и ЦНС. Проникает через плацентарный барьер, в небольшом количестве – в грудное молоко. Не кумулируется в организме. Не биотрансформируется, выводится почками в неизмененном виде. Период полувыведения составляет около 4-9 часов, почечный клиренс увеличивается при щелочной реакции мочи. Около 90 % принятой дозы выводится почками в течение 24 часов. Длительность фармакологического действия составляет 8-12 часов.

Фармацевтические характеристики.

Основные физико-химические свойства: таблетки плоскоцилиндрической формы со скошенными краями белого или почти белого цвета.

Срок годности. 3 года.

Условия хранения. Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка. По 10 таблеток в блистере; по 2 блистера в пачке.

Категория отпуска. По рецепту.

