

ІНСТРУКЦІЯ ДЛЯ МЕДИЧНОГО ЗАСТОСУВАННЯ ПРЕПАРАТУ ДІУРЕМІД

Склад.

Діюча речовина: acetazolamide;

1 таблетка містить ацетазоламіду 250 мг;

допоміжні речовини: крохмаль картопляний, тальк, натрію крохмальгліколят (тип А).

Лікарська форма. Таблетки.

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

Клінічні характеристики.

Показання.

- Лікування глаукоми:
 - хронічна відкритокутова глаукома;
 - вторинна глаукома;
 - глаукома закритокутова (для короткочасної передопераційної терапії та перед офтальмологічними процедурами, які можуть спровокувати гострий напад закритокутової глаукоми, для зменшення внутрішньоочного тиску).
- Лікування набряків:
 - при серцевій недостатності;
 - набряків, спричинених застосуванням 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, гостра ниркова недостатність, виражені порушення функції печінки, печінкова недостатність, цироз печінки (ризик розвитку енцефалопатії), сечокам'яна хвороба (при гіперкальціурії), гіперхлоремічний ацидоз, гіпокаліємія, гіпонатріємія, хронічна декомпенсована закритокутова глаукома (для тривалої терапії), цукровий діабет, уремія, недостатність надниркових залоз.

Спосіб застосування та дози.

Препарат приймати внутрішньо.

Лікування глаукоми.

Дозу препарату визначати індивідуально, залежно від внутрішньоочного тиску.

Рекомендовані дози для дорослих:

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

Лікування епілепсії.

Дорослі та діти	Як правило, 8-30 мг/кг маси тіла на добу. Дозу застосовувати в 1-4 прийоми. Оптимальна доза 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 день. Дозу при необхідності підвищувати поступово. Для дітей доза не має перевищувати 750 мг на день.	

Лікування набряків при серцевій недостатності та набряків, спричинених застосуванням лікарських засобів. Початкова доза – 250 мг на день (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 серцевих глікозидів, низькосольова дієта та поповнення дефіциту калію).

Лікування висотної хвороби. Рекомендована денна доза становить 500-1000 мг (2-4 таблетки), розподілена на кілька прийомів.

У разі передбачуваного швидкого підйому на висоту (більше 500 м на день) 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.

Побічні реакції.

Побічні реакції найчастіше спостерігаються на початку лікування.

З боку нервової системи та органів чуття: судоми, парестезії, порушення слуху/шум у вухах, порушення смакових відчуттів, головний біль, запаморочення, дратівливість, депресія,

сплутаність свідомості, атаксія; при тривалому застосуванні – дезорієнтація, сонливість, порушення дотику та чутливості, загальна слабкість; у поодиноких випадках – відчуття волосся на язиці.

З боку шлунково-кишкового тракту: анорексія, нудота, блювання, діарея, печінкова недостатність, печінкова коліка, кишкова коліка, гепатит, холестатична жовтяниця, зміни показників функції печінки.

З боку обміну речовин: метаболічний ацидоз, втрата ваги, спрага, порушення електролітного балансу (при тривалому застосуванні).

З боку системи крові: в окремих випадках при тривалому застосуванні – гемолітична анемія, лейкопенія, агранулоцитоз, тромбоцитопенія, панцитопенія, пригнічення кісткового мозку, апластична анемія, тромбоцитопенічна пурпура.

З боку сечовидільної системи: часте сечовипускання, гематурія, глікозурія, ниркова коліка, гіпонатріємія, гіпокаліємія, кристалурія, поліурія, ниркова недостатність.

Алергічні реакції: при підвищеній чутливості до компонентів препарату – шкірний висип, свербіж, еритема, кропив'янка, мультиформна еритема, синдром Стівенса-Джонсона, синдром Лайєлла.

Інші: оборотна міопія, фотосенсибілізація, зниження лібідо, приливи, гарячка.

Передозування.

При передозуванні можливі порушення електролітного балансу, ацидоз і порушення з боку центральної нервової системи (сонливість, парестезії); іноді – зменшення діурезу.

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

Застосування у період вагітності або годування груддю.

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

При необхідності лікування ацетазоламідом годування груддю слід припинити.

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

Особливості застосування.

Застосовувати з обережністю при емболії легеневої артерії та емфіземі легенів, при нирковій недостатності, а також хворим літнього віку у зв'язку з підвищеним ризиком розвитку метаболічного ацидозу.

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

При призначенні препарату більше 5 днів поспіль підвищується ризик розвитку метаболічного ацидозу.

При тривалій терапії потрібен моніторинг рівня електролітів у сироватці крові (особливо рівня

калію і рН крові), а також контроль картини периферичної крові. У випадку появи змін у картині крові або шкірних проявів препарат необхідно терміново відмінити.

У випадку гіперчутливості можливе виникнення симптомів, 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 застосування препарату слід негайно припинити.

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

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з 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.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Сечогінний ефект ацетазоламіду підсилюється теофіліном, послаблюється кислотоутворюючими діуретиками.

Ацетазоламід може підсилювати дію антагоністів фолієвої кислоти, гіпоглікемічних засобів і антикоагулянтів, які слід приймати внутрішньо.

При одночасному застосуванні ацетазоламід підвищує ризик появи токсичних ефектів саліцилатів, препаратів наперстянки, карбамазепіну, ефедрину, недеполяризуючих міорелаксантів.

Одночасне застосування з ацетилсаліциловою кислотою може призвести до важкого ацидозу і токсичного впливу на центральну нервову систему з ризиком розвитку анорексії, тахіпноє, летаргічного стану, коми з можливим летальним наслідком.

Необхідна корекція дози ацетазоламіду при одночасному застосуванні з серцевими глікозидами або засобами, що підвищують артеріальний тиск.

Ацетазоламід порушує метаболізм фенітоїну, підвищуючи його концентрацію у сироватці крові.

У деяких пацієнтів, які приймали ацетазоламід з деякими протисудомними засобами (фенітоїном, примідоном), спостерігалася тяжка форма остеомалачії.

Одночасне застосування ацетазоламіду з амфетаминами, атропіном або хінідином може посилювати їхню побічну дію. Ацетазоламід може підвищувати або знижувати концентрацію глюкози у крові, що слід врахувати при лікуванні цукрового діабету. Може знадобитися зміна дози інсуліну або пероральних гіпоглікемізуючих препаратів.

Ацетазоламід посилює виведення літію та може послабити його дію.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Діуретичний, протиглаукомний, протиепілептичний засіб. Механізм дії зумовлений вибіркоким пригніченням карбоангідрази – ферменту, що каталізує оборотну реакцію гідратації діоксиду вуглецю і подальшу дисоціацію вугільної кислоти. Діуретичний ефект зумовлений пригніченням активності карбоангідрази у нирках (головним чином у проксимальних ниркових каналцях), що призводить до зниження реабсорбції бікарбонату, іонів натрію і калію, підсилення 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.

При внутрішньому застосуванні добре всмоктується зі шлунково-кишкового тракту. Максимальна концентрація в плазмі крові досягається через 1-3 години після застосування; концентрації ацетазоламід, що визначаються, зберігаються в крові упродовж 24 годин. Зв'язується з білками плазми великою мірою. Завдяки високому спорідненню з карбоангідразою накопичується переважно у тканинах, що містять цей фермент, зокрема в еритроцитах, нирках, м'язах, тканинах очного яблука і ЦНС. Проникає крізь плацентарний бар'єр, у невеликій кількості – у грудне молоко. Не кумулюється в організмі. Не біотрансформується, виводиться нирками у незміненому стані. Період напіввиведення становить приблизно 4-9 годин, нирковий кліренс збільшується при лужній реакції сечі. Приблизно 90 % прийнятої дози виводиться нирками упродовж 24 годин. Тривалість фармакологічної дії становить 8-12 годин.

Фармацевтичні характеристики:

основні фізико-хімічні властивості: таблетки плоскоциліндричної форми зі скошеними краями білого або майже білого кольору.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 10 таблеток у блістері; по 2 блістери в паці.

Категорія відпуску. За рецептом.

