

## **Состав**

*действующее вещество:* ацетазоламид;

1 таблетка содержит 250 мг ацетазоламиду;

*вспомогательные вещества:* целлюлоза микрокристаллическая, повидон, кремния диоксид коллоидный, кроскармеллоза, магния стеарат.

## **Лекарственная форма**

Таблетки.

*Основные физико-химические свойства:* круглые двояковыпуклые таблетки белого цвета.

## **Фармакотерапевтическая группа**

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

## **Фармакодинамика**

Диуретический, противоглаукомные, противоэпилептическое средство. Механизм действия обусловлен избирательным угнетением карбоангидразы - фермента, который катализирует обратную 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, усиление диуреза, повышение рН мочи, увеличение реабсорбции аммиака. Не влияет на выведение ионов хлора. В результате угнетения карбоангидразы цилиарного тела уменьшает секрецию водянистой влаги и снижает внутриглазное давление. Угнетение карбоангидразы в головном мозге приводит к накоплению  $\text{CO}_2$  в мозге и торможения чрезмерных пароксизмальных разрядов нейронов, что приводит противоэпилептическую активность препарата. Применение препарата при повышенном внутричерепном давлении связано с подавлением карбоангидразы в сосудистых сплетениях желудочков головного мозга и снижением выработки спинномозговой жидкости.

## **Фармакокинетика**

## *Всасывания*

Ацетазоламид хорошо всасывается из пищеварительного тракта. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 1-3 часа после применения. Небольшие концентрации ацетазоламида хранятся в крови в течение 24 часов.

## *Распределение*

Ацетазоламид распределяется во многих тканях. Благодаря высокому родству с Карбоангидраза накапливается преимущественно в тканях, содержащих этот фермент, в частности в эритроцитах, почках, мышцах, тканях глазного яблока и ЦНС. Препарат не накапливается в тканях.

Фракция с белками составляет 70-90% от общего содержания ацетазоламида в крови. Период полувыведения составляет 4-9 часов.

Ацетазоламид проникает через плацентарный барьер.

В небольших количествах проникает в грудное молоко.

## *Метаболизм*

Ацетазоламид не метаболизируется.

## *Вывод*

Препарат выделяется почками в неизменном виде. После приема внутрь около 90% принятой дозы выводится с мочой в течение 24 часов.

## **Показания**

Лечение глаукомы:

- хроническая открытоугольная глаукома;
- вторичная глаукома;
- глаукома (для кратковременной предоперационной терапии и перед офтальмологическими процедурами, для уменьшения внутриглазного давления).

Лечение отеков:

- при сердечной недостаточности;
- отеков, вызванных приемом лекарственных средств.

Лечение эпилепсии (в комбинации с другими противосудорожными средствами):

- petit mal (малые припадки) у детей;
- grand mal (большие припадки) у взрослых;
- смешанной формы.

Лечение высотной болезни (препарат сокращает время акклиматизации, но его влияние на проявления этой болезни незначительный).

### **Противопоказания**

- Повышенная чувствительность к компонентам препарата и сульфаниламидам, нарушение функции печени и почек, острая почечная недостаточность, печеночная недостаточность, гипонатриемия и / или гипокалиемия, болезнь Аддисона, недостаточности надпочечников, гиперхлоремический ацидозе. Ацетазоламид противопоказан пациентам с циррозом печени, поскольку это может повышать риск печеночной энцефалопатии.
- Длительное применение ацетазоламида противопоказано пациентам с хронической декомпенсированной закрытоугольной глаукомой, поскольку в случае полного закрытия угла камеры глаза ухудшение течения глаукомы будет маскироваться пониженным внутриглазным давлением.
- Мочекаменная болезнь (при гиперкальциурии), сахарный диабет, уремия.

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

- Ацетазоламид может усиливать действие антагонистов фолиевой кислоты, гипогликемических средств и антикоагулянтв, которые принимают внутрь.
- Одновременное применение ацетазоламида с ацетилсалициловой кислотой может привести к тяжелому ацидозу и токсично повлиять на центральную нервную систему с риском развития анорексии, тахипноэ, летаргического состояния, комы с возможным летальным исходом.
- При одновременном применении ацетазоламида с сердечными гликозидами или лекарственными средствами, повышающими артериальное давление, дозу первого необходимо изменить.
- Ацетазоламид нарушает метаболизм фенитоина, повышая концентрации последнего в сыворотке крови. У пациентов, принимающих ацетазоламид с определенными ПСП (фенитоином, примидоном), наблюдалась тяжелая форма остеомаляции.
- Одновременное применение ацетазоламида с амфетаминами, атропином или хинидином может усиливать их побочное действие. Снижается выведение амфетамина и хинидина, поэтому возможно увеличение времени

действия амфетамина и усиления действия хинидина путем повышения уровня рН мочи в почечных канальцах.

- Ацетазоламид может повышать или снижать концентрацию глюкозы в крови, что следует учитывать при лечении сахарного диабета. Может потребоваться изменение дозы инсулина или пероральных гипогликемических препаратов.
- Ацетазоламид усиливает выведение лития и может уменьшить уровень лития в плазме крови.
- Ацетазоламид может повышать концентрацию карбамазепина в плазме крови.
- При одновременном применении ацетазоламид повышает риск появления токсических эффектов салицилатов, препаратов наперстянки, карбамазепина, эфедрина, недеполяризующих миорелаксантов.
- Мочегонный эффект ацетазоламида усиливается теофиллином, ослабляется кислотоутворяющими диуретиками.
- Были единичные сообщения о снижении уровня прамидону в сыворотке крови и повышение уровня карбамазепина при их одновременном применении с ацетазоламидом.
- Из-за возможных аддитивных эффектов не рекомендуется одновременное применение с другими ингибиторами карбоангидразы.
- Циклоспорин: ацетазоламид может повышать уровень циклоспорина.
- Метенамин: ацетазоламид может нарушать антисептический эффект Метенамин по моче.
- Бикарбонат натрия: одновременное применение ацетазоламида с бикарбонатом натрия повышает риск образования почечных конкрементов.

## **Особенности применения**

Были сообщения о суицидальных мыслях и поведении у пациентов, лечившихся противоэпилептическими лекарственными средствами по разным показаниям. Мета-анализ рандомизированных плацебо-контролируемых исследований также показал небольшое повышение риска суицидальных мыслей и поведения. Механизм такого риска неизвестен, и доступные данные не исключают возможности повышения риска для ацетазоламида.

Поэтому следует проводить мониторинг признаков суицидальных мыслей и поведения, а также рассмотреть необходимость соответствующего лечения. Пациентам (и лицам, которые присматривают за пациентами) следует рекомендовать немедленно обращаться за медицинской помощью при возникновении признаков суицидальных мыслей или поведения.

Ацетазоламид, назначенный в дозах, превышающих рекомендуемые, не приводит к увеличению диуреза, однако может вызвать сонливость и парестезии, иногда может привести даже к уменьшению диуреза. При определенных условиях, однако, необходимо применять очень большие дозы в комбинации с другими диуретиками для обеспечения диуреза при полной рефрактерной сердечной недостаточности.

Во время лечения ацетазоламидом отмечали как снижение, так и повышение уровня глюкозы в плазме крови, это следует учитывать при назначении лекарственного средства с нарушением толерантности к глюкозе или сахарным диабетом.

При длительной терапии необходимы особые меры предосторожности. Следует предупредить пациента о необходимости сообщать обо всех случаях появления изменений со стороны кожи. Рекомендуется проводить периодический мониторинг картины крови и уровня электролитов в сыворотке крови (особенно уровня калия и рН крови), а также контроль картины периферической крови. Имели место летальные исходы из-за серьезных реакции на сульфаниламиды, хотя такие случаи были редкими. В случае резкого уменьшения количества форменных элементов крови или появления токсических изменений со стороны кожи препарат необходимо срочно отменить.

Применять с осторожностью при эмболии легочной артерии и эмфиземе легких, непроходимостью / обтурацией нижних дыхательных путей, в которых может быть снижена альвеолярная вентиляция, при почечной недостаточности, а также больным пожилого возраста в связи с повышенным риском развития метаболического ацидоза.

У пациентов с конкрементами в почках в анамнезе следует оценить соотношение риск / польза для дальнейшего осаждения конкрементов.

Препарат алкиризуе мочу.

Развитие генерализованной эритемы на фоне применения лекарственного средства, сопровождающееся появлением пустул и лихорадки, может быть симптомом острого генерализованного экзематозного пустулез. При диагностике такого состояния лечения ацетазоламидом следует отменить, в дальнейшем назначения лекарственного средства противопоказано.

В случае гиперчувствительности возможно возникновение симптомов, которые могут угрожать жизни пациента, например, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла, молниеносный некроз печени, агранулоцитоз, апластическая анемия и геморрагический диатез.

В случае развития кожных или гематологических проявлений прием препарата следует немедленно прекратить.

Ацетазоламид следует с осторожностью назначать пациентам, принимающим ацетилсалициловую кислоту (высокие дозы), поскольку существует вероятность развития анорексии, учащение дыхания, летаргического состояния, комы и даже летальному исходу.

При пропуске очередной дозы не следует повышать дозу в следующий прием.

Если пациент принимает ацетазоламид более 5 дней, есть риск развития метаболического ацидоза.

#### *Лабораторные исследования*

Рекомендуется проводить контроль картины крови и уровня тромбоцитов в начале лечения и периодически во время лечения, также рекомендуется контролировать уровень электролитов плазме в крови.

#### **Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с 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.

#### **Применение в период беременности или кормления грудью**

##### *Беременность*

Ацетазоламид проникает через плацентарный барьер. Применение препарата в период беременности противопоказано.

##### *Кормление грудью*

Ацетазоламид в небольшом количестве проникает в грудное молоко. Во время применения препарата кормление грудью следует прекратить.

#### **Способ применения и дозы**

Препарат принимают внутрь.

##### *Лечение глаукомы*

Дозу препарата определяют индивидуально в зависимости от внутриглазного давления.

Рекомендуемые дозы для взрослых:

При открытоугольной глаукоме	250 мг (1 таблетка) 1-4 раза в сутки. Доза более 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 сутки (длительное назначение не показано).
При острых приступах закрытоугольной глаукомы	250 мг (1 таблетка) 4 раза в сутки.

#### *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 сутки. Дозу при необходимости повышать постепенно. Для детей доза не должна превышать 750 мг в сутки.	

#### *Лечение отеков при сердечной недостаточности и отеков, вызванных применением лекарственных средств*

Начальная доза 250 мг в сутки (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 гликозидов наперстянки, низкосолевая диета и восполнения дефицита калия).

#### *Лечение высотной болезни*

Рекомендуемая суточная доза составляет 500-1000 мг (2-4 таблетки), разделенная на несколько приемов. В случае предполагаемого быстрого подъема на высоту (более 500 м в сутки) рекомендуемая 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 продолжить еще 48 часов или более при необходимости.

## **Дети**

Препарат применять для лечения детей в возрасте от 3 лет только как вспомогательную терапию при эпилепсии.

## **Передозировка**

Не описанные симптомы передозировки и острого отравления у людей. В случае передозировки возможны нарушения электролитного баланса, ацидоз и нарушения со стороны центральной нервной системы (сонливость, парестезии) иногда - уменьшение диуреза. Поэтому следует контролировать концентрацию, электролитов в плазме крови, особенно калия, а также pH мочи.

## *Лечение*

Отмена препарата, симптоматическая терапия, при ацидоз назначать бикарбонаты. Эффективный гемодиализ. Специфического антидота не существует.

## **Побочные реакции**

Во время лечения ацетазоламид наблюдались следующие Побочные явления, Указанные ниже, с такой частотой возникновения: очень часто ( $\geq 1/10$ ), часто ( $\geq 1/100$ ,  $<1/10$ ), нечасто ( $\geq 1/1000$ ,  $<1/100$ ), редко ( $\geq 1/10000$ ,  $<1/1000$ ), очень редко ( $\geq 1/100000$ ,  $<1/10000$ ), частота неизвестна (не может быть определена согласно имеющейся информации).

### *Со стороны крови*

Редко: апластическая анемия, тромбоцитопения, агранулоцитоз, лейкопения, тромбоцитопеническая пурпура, угнетение костного мозга, панцитопения.

В ОТДЕЛЬНЫХ случаях при длительном применении - гемолитическая анемия.

### *Со стороны обмена веществ*

Часто: анорексия, метаболический ацидоз, нарушение водно-электролитного баланса (в сочетании с гипонатриемией и гипокалиемией).

Частота неизвестна: гипокальциемия, уменьшение массы тела (при длительном применении).

*Со стороны психики*

Нечасто: депрессия.

*Со стороны нервной системы и органов чувств*

Часто: головокружение, нарушение вкусовых ощущений, парестезии (ощущение ползания мурашек в конечностях).

Нечасто: приливы, жажда, головная боль, раздражительность, снижение либидо.

Сообщалось о единичных случаях: сонливость, спутанность сознания, Вялый паралич, судороги.

Частота неизвестна: атаксия; при длительном применении - дезориентация, нарушение осязания, общая слабость, периферический паралич; в единичных случаях - ощущение волос на языке.

*Со стороны органов зрения*

Редко: обратная миопия.

*Со стороны органов слуха и равновесия*

Редко: шум в ушах, нарушение слуха.

*Со стороны желудочно-кишечного тракта*

Нечасто тошнота, рвота, диарея, мелена.

*Со стороны печени и желчевыводящих путей*

Нечасто: нарушение функции печени.

Редко молниеносный некроз печени, гепатит, механическая желтуха.

Частота неизвестна: печеночная недостаточность, печеночная колика.

*Со стороны кожи и ее производных*

Редко: мультиформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, фотосенсибилизация, кожная сыпь, синдром Лайелла, крапивница.

Частота неизвестна: острый генерализованный экзематозная пустулез, зуд, эритема.

#### *Со стороны мочевыделительной системы*

Нечасто: нефролитиаз, кристаллурия, почечная колика, повреждения почки, полиурия, гематурия, почечная недостаточность.

Редко: глюкозурия.

Частота неизвестна: частое мочеиспускание.

#### *Общие расстройства*

Часто утомляемость.

Нечасто: лихорадка.

#### *Со стороны иммунной системы*

Редко реакции гиперчувствительности, включая анафилактические реакции.

#### *Исследования*

Очень редко: гипогликемия, гипергликемия.

Ацетазоламид, как производное сульфонамида, может вызывать побочные реакции, характерные для сульфонамидов.

#### **Срок годности**

5 лет.

#### **Условия хранения**

Хранить при температуре не выше 25 ° С в оригинальной упаковке.

Хранить в недоступном для детей месте.

#### **Упаковка**

По 10 таблеток в блистере, по 3 блистера в картонной коробке.

#### **Категория отпуска**

По рецепту.

## **Производитель**

Производство готового лекарственного средства, первичное, вторичное упаковки, контроль качества и выпуск серии:

Фармацевтический Завод «Польфарма» С.А., Польша.

Первичное, вторичное упаковки, контроль качества и выпуск серии:

Медана Фарма Акционерное Общество.

## **Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

Ул. Пельплиньска 19 83-200, Старогард Гданьски, Польша.

## **Источник инструкции**

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).