

Состав

действующее вещество: ацетазоламид;

1 таблетка содержит ацетазоламида 250 мг;

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

Лекарственная форма

Таблетки.

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

Фармакотерапевтическая группа

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

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 лекарственного средства при повышенном внутричерепном давлении связано с подавлением карбоангидразы в сосудистых сплетениях желудочков головного мозга и снижением продуцирования спинномозговой жидкости.

Фармакокинетика

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

Распределение. Ацетазоламид распределяется во многих тканях. Благодаря высокому сродству с карбоангидразой накапливается преимущественно в тканях, содержащих этот фермент, в частности в эритроцитах, почках, мышцах, тканях глазного яблока и центральной нервной системе.

Лекарственное средство не накапливается в тканях.

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

Ацетазоламид проникает через плацентарный барьер.

Ацетазоламид в небольших количествах проникает в грудное молоко.

Метаболизм. Ацетазоламид не метаболизируется.

Выведение. Лекарственное средство выводится почками в неизмененном виде. После приема внутрь около 90 % принятой дозы выводится с мочой в течение 24 часов.

Показания

Лечение глаукомы:

- хроническая открытоугольная глаукома;
- вторичная глаукома;
- закрытоугольная глаукома (для кратковременной предоперационной терапии и перед офтальмологическими процедурами, 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 лекарственного средства и сульфонидам, нарушения функции печени и почек, острая почечная недостаточность, печеночная недостаточность, мочекаменная болезнь (при гиперкальциурии), гиперхлоремический ацидоз, гипокалиемия, хроническая декомпенсированная закрытоугольная глаукома (для длительной терапии), сахарный диабет, уремия, недостаточность надпочечных желез, болезнь Аддисона. Ацетазоламид не следует применять пациентам с циррозом печени, поскольку это может повышать риск печеночной энцефалопатии.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

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

Одновременное применение ацетазоламида 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.

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, которые принимают ацетазоламид с определенными противосудорожными средствами (фенитоином, примидоном), наблюдалась тяжелая форма остеомалации.

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.

Ацетазоламид может повышать концентрацию карбамазепина в плазме крови.

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

Мочегонный эффект ацетазоламида усиливается теофиллином, ослабляется кислотообразующими диуретиками.

Были одиночные сообщения о снижении уровня прамидона 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 метенамина по моче.

Бикарбонат натрия: одновременное применение ацетазоламида с бикарбонатом натрия повышает риск образования почечных конкрементов.

Особенности применения

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 прием лекарственного средства 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 летального исхода.

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

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.

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

Лекарственное средство алкиризует мочу.

Рекомендуется контролировать уровень тромбоцитов.

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

Были сообщения о суицидальных мыслях и поведении у пациентов, которые лечились противоэпилептическими 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 относительно 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.

При определенных условиях, необходимо давать очень большие дозы в комбинации с другими диуретиками для того, чтобы защитить диурез при полном стойком поражении.

Имели место летальные последствия из-за серьезных реакций на сульфонамиды, хотя такие случаи были редкие.

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

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 лекарственного средства в период беременности противопоказано.

Кормление грудью. Ацетазоламид в небольшом количестве проникает в грудное молоко. Во время применения лекарственного средства кормление грудью следует прекратить.

Способ применения и дозы

Лекарственное средство принимать внутрь.

Лечение глаукомы.

Дозу лекарственного средства определять индивидуально, в зависимости от внутриглазного давления.

Рекомендованные дозы для взрослых:

При открытоугольной глаукоме	250 мг (1 таблетка) 1-4 раза в сутки. 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 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 лекарственное средство через день или через 2 дня с однодневным перерывом.

При лечении сердечной недостаточности ацетазоламид назначать на фоне общепринятой терапии (например, назначение сердечных гликозидов наперстянки, 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 метров в день) рекомендованная доза составляет 1000 мг (4 таблетки), разделенная на несколько приемов.

Лекарственное средство 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.

Дети

Лекарственное средство применять для лечения детей с 3 лет только как вспомогательную терапию при эпилепсии.

Передозировка

В случае передозировки возможны нарушения электролитного баланса, ацидоз и нарушения со стороны ЦНС (сонливость, парестезии); иногда – уменьшение диуреза.

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

Побочные реакции

Побочные реакции чаще всего наблюдаются в начале лечения.

Со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности, включая анафилактические реакции.

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, периферический паралич; в единичных случаях – ощущение волос на языке, вялый паралич, усталость.

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

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

Со стороны кожи и слизистых оболочек: кожная сыпь, зуд, эритема, крапивница, мультиформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла.

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

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.

Производитель

АО «КИЕВСКИЙ ВИТАМИННЫЙ ЗАВОД».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

04073, Украина, г. Киев, ул. Копыловская, 38.

Источник инструкции

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