Диакарб



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Ацетазоламид

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки белого цвета, круглые, двояковыпуклые.

	1 таб.
ацетазоламид	250 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 80.76 мг, повидон - 8.64 мг, кремния диоксид коллоидный - 1.8 мг, кроскармеллоза натрия - 7 мг, магния стеарат - 1.8 мг.

10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Ацетазоламид является ингибитором карбоангидразы со слабой диуретической активностью. Механизм действия связан с угнетением высвобождения ионов натрия (Na^+) и водорода (H^+) в молекуле угольной кислоты. Ингибирование активности карбоангидразы ацетазоламидом подавляет синтез угольной кислоты в проксимальном канальце нефрона. Недостаток угольной кислоты, которая является источником ионов H^+, необходимых для замены на ионы Na^+, повышает экскрецию почками натрия и воды. В результате выделения больших количеств натрия в дистальной части нефрона, вызванного ацетазоламидом, увеличивается замещение ионов Na^+ на ионы калия (K^+), что приводит к большим потерям K^+ и развитию гипокалиемии. Ацетазоламид повышает экскрецию гидрокарбонатов, что может привести к развитию метаболического ацидоза. Ацетазоламид вызывает выведение почками фосфатов, магния, кальция, что также может привести к метаболическим нарушениям.

Через 3 дня от начала применения ацетазоламид теряет свои диуретические свойства. После перерыва в лечении на несколько дней вновь назначенный ацетазоламид возобновляет диуретическое действие из-за восстановления нормальной активности карбоангидразы.

Ацетазоламид используется для лечения глаукомы. Угнетение карбоангидразы реснитчатого тела снижает секрецию водянистой влаги передней камеры глаза, что снижает внутриглазное давление. Толерантность к этому эффекту не развивается. Офтальмотонус при приеме ацетазоламида начинает снижаться через 40-60 мин, максимум действия наблюдают через 3-5 ч, внутриглазное давление остается ниже исходного уровня в течение 6-12 ч. В среднем внутриглазное давление снижается на 40-60% от исходного уровня.

Препарат применяется как вспомогательное средство при лечении эпилепсии, т.к. ингибирование карбоангидразы в нервных клетках головного мозга тормозит патологическую возбудимость.

Ацетазоламид используется для лечения ликвородинамических нарушений и внутричерепной гипертензии. Препарат подавляет активность карбоангидразы в головном мозге, в частности, в сосудистом сплетении желудочков со снижением продукции спинномозговой жидкости.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь ацетазоламид хорошо абсорбируется из ЖКТ. После приема Диакарба в дозе 500 мг C_{max} активного вещества составляет 12-27 мкг/мл и достигается через 1-3 ч. Минимальная концентрация ацетазоламида в плазме сохраняется в течение 24 ч после приема препарата.

Распределение и метаболизм

Распределяется главным образом в эритроцитах, почках, мышцах, тканях глазного яблока и ЦНС. Проникает через плацентарный барьер, в небольшом количестве выделяется с грудным молоком.

Не кумулирует в тканях и не метаболизируется в организме.

Выведение

Выводится почками в неизмененном виде. Около 90% дозы выводится с мочой в течение 24 ч.

Показания к применению:

— отечный синдром (слабой или умеренной выраженности, в сочетании с алкалозом);

— купирование острого приступа глаукомы, предоперационная подготовка больных, упорные случаи течения глаукомы (в комплексной терапии);

— при эпилепсии в качестве дополнительной терапии к противоэпилептическим средствам;

— острая "высотная" болезнь (препарат сокращает время акклиматизации);

— внутричерепная гипертензия (доброкачественная внутричерепная гипертензия, внутричерепная гипертензия после шунтирования желудочков) в комплексной терапии.

Относится к болезням:

- Гипертензия
- Глаукома
- Эпилепсия

Противопоказания:

— острая почечная недостаточность;

— уремия;

— печеночная недостаточность (риск развития энцефалопатии);

— гипокалиемия;

— гипонатриемия;

— метаболический ацидоз;

— болезнь Аддисона;

— сахарный диабет;

— беременность (I триместр);

— период лактации;

— детский возраст до 3 лет;

— повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью:* отеки печеночного и почечного генеза, одновременный прием с ацетилсалициловой кислотой (дозы более 300 мг/сут), легочная эмболия и эмфизема легких (риск развития ацидоза), беременность (II и III триместр).

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь, строго по назначению врача.

В случае пропуска приема препарата, при очередном приеме не увеличивать дозу.

Отечный синдром

В начале лечения принимают по 250 мг утром. Для достижения максимального диуретического эффекта необходимо принимать Диакарб 1 раз/сут через день или 2 дня подряд с однодневным перерывом. Повышение дозы не усиливает диуретический эффект.

Глаукома

Диакарб следует принимать в составе комплексной терапии.

Взрослым при открытоугольной глаукоме препарат назначают в дозе 250 мг 1-4 раза/сут. Дозы, превышающие 1000 мг, не увеличивают терапевтический эффект. При *вторичной глаукоме* препарат назначают в дозе 250 мг каждые 4 ч в течение дня. У некоторых пациентов терапевтический эффект проявляется после кратковременного приема препарата в дозе 250 мг 2 раза/сут. При *острых приступах глаукомы* - по 250 мг 4 раза/сут.

Детям старше 3 лет при *приступах глаукомы* - 10-15 мг/кг массы тела/сут в 3-4 приема.

После 5 дней приема делают перерыв на 2 дня. При длительном лечении необходимо назначение препаратов калия, калийсберегающей диеты.

При подготовке к операции назначают по 250-500 мг накануне и утром в день операции.

Эпилепсия

Дозы для **взрослых**: 250-500 мг/сут в 1 прием в течение 3 дней, на 4-й день перерыв.

При одновременном применении ацетазоламида с другими противосудорожными препаратами в начале лечения применяют 250 мг 1 раз/сут, постепенно увеличивая дозу в случае необходимости.

Дозы для **детей старше 3 лет**: 8-30 мг/кг/сут, разделенные на 1-4 приема. Максимальная суточная доза - 750 мг.

Острая "высотная" болезнь

Рекомендуется применение препарата в дозе 500-1000 мг/сут. В случае *быстрого восхождения* - 1000 мг/сут.

Препарат следует применять за 24-48 ч до восхождения. В случае появления симптомов болезни лечение продолжают в течение следующих 48 ч или дольше, если это необходимо.

Внутричерепная гипертензия

Рекомендуется применение препарата в дозе 250 мг/сут или 125-250 мг каждые 8-12 ч. Максимальный терапевтический эффект достигается при приеме дозы 750 мг/сут.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: парестезии, нарушения слуха или шум в ушах, усталость, головокружение, атаксия, сонливость и дезориентация, судороги, вялый паралич и светобоязнь, нарушение осязания, печеночная энцефалопатия (на фоне печеночной недостаточности).

Со стороны пищеварительной системы: возможны тошнота, рвота, диарея, снижение аппетита, нарушение вкуса, фульминантный некроз печени.

Со стороны мочевыделительной системы: учащенное мочеиспускание, нефролитиаз.

Со стороны кроветворной системы: агранулоцитоз, тромбоцитопения, лейкопения и апластическая анемия, недостаточность костномозгового кроветворения, панцитопения, геморрагический диатез.

Аллергические реакции: кожная сыпь в форме многоформной эритемы, крапивница, синдром Стивенса-Джонсона,

синдром Лайелла, анафилаксия.

Лабораторные показатели: гематурия, глюкозурия, гипергликемия, гипокалиемия, гипонатриемия, нарушение водно-электролитного баланса и кислотно-основного состояния (метаболический ацидоз).

Прочие: преходящая близорукость, мышечная слабость.

Передозировка:

Симптомы передозировки не описаны. Вероятными *симптомами* передозировки могут быть нарушения водно-электролитного баланса, метаболический ацидоз, а также нарушения со стороны центральной нервной системы.

Лечение: специфического антидота не существует. Лечение должно быть симптоматическое и поддерживающее. Следует контролировать содержание электролитов в крови, особенно калия, натрия, а также pH крови. В случае метаболического ацидоза применяется гидрокарбонат натрия. Ацетазоламид выводится с помощью гемодиализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Хорошо контролируемых клинических исследований применения препарата Диакарб у беременных не проводилось. Поэтому при беременности препарат Диакарб противопоказан в I триместре, а во II и III триместрах применяется с осторожностью и только в тех случаях, когда потенциальная польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Ацетазоламид в небольшом количестве выделяется с грудным молоком, поэтому при необходимости применения препарата Диакарб в период лактации, грудное вскармливание необходимо прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

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

Одновременное применение ацетазоламида и ацетилсалициловой кислоты может вызывать метаболический ацидоз и усиливать токсические эффекты на ЦНС.

При совместном применении с сердечными гликозидами или препаратами, повышающими АД, следует корректировать дозу ацетазоламида.

Ацетазоламид, повышает содержание фенитоина в сыворотке крови.

Ацетазоламид усиливает проявления остеомаляции, вызванной приемом противоэпилептических лекарственных средств.

Одновременное применение ацетазоламида и амфетамина, атропина или хинидина может усилить их побочное действие.

Потенциирование диуретического эффекта возникает при совместном применении с метилксантинами (аминофиллином).

Уменьшение диуретического эффекта происходит при комбинированном применении с хлоридом аммония и другими кислотообразующими диуретиками.

Усиление гипотензивного эффекта в отношении внутриглазного давления возможно при одновременном применении с холинергическими препаратами и бета-адреноблокаторами.

Ацетазоламид усиливает действие эфедрина.

Увеличивает концентрацию в плазме крови карбамазепина, недеполяризующих миорелаксантов.

Увеличивает выведение лития.

Особые указания и меры предосторожности:

В случае повышенной чувствительности к препарату могут проявиться опасные для жизни побочные эффекты, например, синдром Стивенса-Джонсона, синдром Лайелла, фульминантный некроз печени, агранулоцитоз, апластическая анемия и геморрагический диатез. В случае проявления этих симптомов следует немедленно

прекратить прием препарата.

Диакарб, применяемый в дозах, превышающих рекомендуемые, не повышает диуреза, а может усилить сонливость и парестезии, а иногда также снизить диурез.

Препарат может вызвать ацидоз, поэтому должен с осторожностью применяться у больных с легочной эмболией и эмфиземой легких.

Препарат защелачивает мочу, Диакарб следует осторожно применять у пациентов с сахарным диабетом в связи с повышенным риском гипергликемии.

В случае назначения на протяжении более 5 дней высок риск развития метаболического ацидоза.

Рекомендуется контроль картины крови и тромбоцитов в начале лечения, и в регулярные интервалы времени в ходе лечения, а также периодический контроль электролитов в сыворотке крови.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Диакарб, особенно в высоких дозах, может вызвать сонливость, реже усталость, головокружение, атаксию и дезориентацию, поэтому во время лечения пациенты не должны управлять автотранспортом и работать с механизмами, требующими повышенной концентрации внимания и скорости психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Противопоказан при острой почечной недостаточности. С осторожностью следует применять препарат больных с нарушениями функции почек из-за повышенного риска развития метаболического ацидоза.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при печеночной недостаточности.

Применение в детском возрасте

Препарат применяют по показаниям и в дозе, откорректированной в соответствии с возрастом.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в сухом, защищенном от света и недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Diakarb