

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Ацетазоламид, 250 мг, таблетки

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: ацетазоламид.

Каждая таблетка содержит 250 мг ацетазоламида.

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Таблетки.

Круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или почти белого цвета с риской и фаской.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению.**

- Отечный синдром (слабой или умеренной выраженности, в сочетании с алкалозом);
- Купирование острого приступа глаукомы, предоперационная подготовка пациентов, упорные случаи течения глаукомы (в комплексной терапии);
- При эпилепсии в качестве дополнительной терапии к противоэпилептическим средствам;
- Острая «высотная» болезнь (препарат сокращает время акклиматизации);
- Ликвородинамические нарушения, внутричерепная гипертензия (доброкачественная внутричерепная гипертензия, внутричерепная гипертензия после шунтирования желудочков) в комплексной терапии.

4.2. Режим дозирования и способ применения.Режим дозирования*Отечный синдром*

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

При уменьшении ранее достигнутого ответа на терапию ацетазоламидом следует отменить препарат на сутки (для восстановления активности карбоангидразы почек).

Применение ацетазоламида не отменяет необходимость применения других лекарственных средств, соблюдения постельного режима и ограничения приема хлорида натрия.

Глаукома

Ацетазоламид следует принимать в составе комплексной терапии.

Взрослым при открытоугольной глаукоме препарат назначают в дозе 250 мг 1-4 раза в сутки. Дозы, превышающие 1000 мг, не увеличивают терапевтический эффект. При вторичной глаукоме препарат назначают в дозе 250 мг каждые 4 часа в течение дня. У некоторых пациентов терапевтический эффект проявляется после кратковременного приема препарата в дозе 250 мг 2 раза в сутки.

При острых приступах глаукомы: препарат назначают по 250 мг 4 раза в сутки.

Детям старше 3-х лет при приступах глаукомы препарат назначают в дозе 10-15 мг/кг массы тела в сутки 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/сутки в один 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 в сутки, постепенно увеличивая дозу в случае необходимости. Максимальная суточная доза у взрослых 1000 мг.

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

Острая «высотная» болезнь

Рекомендуется применение препарата в дозе 500-1000 мг в сутки.

В случае быстрого восхождения - 1000 мг в сутки.

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

Ликвородинамические нарушения, внутричерепная гипертензия

Рекомендуется применение препарата в дозе 250 мг в сутки или 125-250 мг каждые 8-12 часов. Максимальный терапевтический эффект достигается при приеме дозы 750 мг в сутки. Для достижения оптимального эффекта может потребоваться ежедневный безинтервальный прием препарата.

Способ применения

Препарат принимают внутрь, строго по назначению врача.

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

4.3. Противопоказания.

- повышенная чувствительность к ацетазоламиду, другим сульфонидами и/или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- острая почечная недостаточность;
- тяжелая хроническая почечная недостаточность (клиренс креатинина менее 10 мл/мин);
- уремия;
- печеночная недостаточность (риск развития энцефалопатии);
- рефрактерная гипокалиемия;
- рефрактерная гипонатриемия;
- метаболический ацидоз;
- гипокортицизм;
- болезнь Аддисона;
- декомпенсированный сахарный диабет;
- длительное применение при закрытоугольной глаукоме, поскольку снижение внутриглазного давления может маскировать утяжеление течения глаукомы и способствовать развитию органического закрытия угла глаза;
- беременность;
- период грудного вскармливания;
- детский возраст до 3 лет.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении.

С осторожностью

Отеки печеночного и почечного генеза, одновременный прием с ацетилсалициловой кислотой (дозы свыше 300 мг/сутки), тромбоэмболия легочной артерии и эмфизема легких (риск развития ацидоза), пожилой возраст, нарушение водно-электролитного баланса, нарушение функции печени, у пациентов с риском обструкции мочевыводящих путей.

Препарат Ацетазамид, применяемый в дозах, превышающих рекомендуемые, не увеличивают диурез, но может усилить сонливость и/или парестезию. Увеличение дозы ацетазоламида часто приводит к снижению диуреза. Имеются редкие сообщения о

серьезных реакциях гиперчувствительности, иногда с летальным исходом, к сульфаниламидам (включая ацетазоламид), таких как синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз и фульминантный печеночный некроз. Пациент должен быть предупрежден о необходимости сообщать лечащему врачу о любых необычных кожных высыпаниях. При возникновении токсических кожных реакций терапию препаратом Ацетазоламид следует немедленно прекратить. Появление в начале лечения генерализованной лихорадочной эритемы с пустулами может быть симптомом острого генерализованного экзантематозного пустулеза. В случае подтверждения диагноза прием ацетазоламида следует немедленно прекратить. Пациентам, перенесшим острый генерализованный экзантематозный пустулез, применение ацетазоламида в дальнейшем противопоказано. При длительном применении ацетазоламида рекомендуется соблюдать меры предосторожности, связанные с риском развития гематологических нежелательных реакций (острая гемолитическая анемия, агранулоцитоз, апластическая анемия, тромбоцитопения и эозинофилия). Рекомендуется регулярный контроль общего анализа крови до и во время терапии препаратом Ацетазоламид. Если наблюдаются значительные изменения в анализе крови, то прием препарата следует прекратить и начать проведение соответствующего лечения. Терапия ацетазоламидом может привести к нарушению электролитного баланса, включая гипонатриемию, транзиторную гипокалиемию и метаболический ацидоз. Риск развития метаболического ацидоза возрастает в случае применения препарата Ацетазоламид на протяжении более 5 дней. Поэтому при длительном применении препарата рекомендуется регулярно контролировать концентрацию электролитов в плазме крови. Следует соблюдать осторожность при применении препарата Ацетазоламид у пациентов с состояниями, которые сопряжены с электролитными или кислотно-щелочными нарушениями, или предрасполагают к возникновению последних, в частности: у пациентов с нарушением функции почек (включая пожилых людей), сахарным диабетом, бронхиальной обструкцией и эмфиземой легких (состояния, сопровождающиеся нарушением альвеолярной вентиляции) – в связи с возможностью усиления ацидоза. Тяжелый метаболический ацидоз может возникнуть у пациентов с нормальной функцией почек при одновременном применении ацетазоламида и салицилатов. Не рекомендуется совместное применение ацетазоламида с высокими дозами ацетилсалициловой кислоты (более 300 мг в сутки) из-за высокого риска тяжелых нежелательных реакций. Ацетазоламид защелачивает мочу. У пациентов с мочекаменной болезнью в анамнезе следует оценить баланс пользы терапии ацетазоламидом и риска камнеобразования. При появлении преходящего нарушения слуха следует прекратить прием ацетазоламида. На фоне лечения эпилепсии специфическими

противоэпилептическими препаратами отмечается небольшое возрастание риска суицидального мышления и суицидального поведения. Механизм данного явления неизвестен, но существующие данные не исключают такой риск при применении ацетазоламида. Поэтому при применении ацетазоламида для лечения эпилепсии следует осуществлять наблюдение за пациентами, выявлять возможные признаки суицидального поведения и мышления и, при необходимости, немедленно обращаться за медицинской помощью. Ацетазоламид нельзя применять у пациентов с заболеваниями печени или печеночной недостаточностью, включая цирроз печени, так как это может увеличить риск развития печеночной энцефалопатии. При применении ацетазоламида были описаны как повышение, так и снижение концентрации глюкозы в крови, это следует учитывать при применении препарата у пациентов с нарушением толерантности к глюкозе или сахарным диабетом. Препарат Ацетазоламид следует с осторожностью применять у пациентов с сахарным диабетом в связи с повышенным риском гипергликемии. Ацетазоламид может вызывать повышение содержания кристаллов в анализе мочи.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами.

Действие ацетазоламида усиливается при совместном применении с пробенецидом. В свою очередь, ацетазоламид усиливает действие антагонистов фолиевой кислоты, препаратов сульфонилмочевины, пероральных антикоагулянтов и барбитуратов, а также токсичность метотрексата. Одновременное применение ацетазоламида и ацетилсалициловой кислоты в высоких дозах может привести к тяжелому метаболическому ацидозу и повышению токсичности для центральной нервной системы. При совместном применении с сердечными гликозидами или препаратами, повышающими артериальное давление, следует корректировать дозу ацетазоламида. При одновременном применении ацетазоламид влияет на метаболизм фенитоина, что приводит к повышению его концентрации в плазме крови. Тяжелая остеомалация наблюдалась у некоторых пациентов, получающих ацетазоламид в сочетании с другими противоэпилептическими препаратами. Увеличивая рН почечной канальцевой мочи, ацетазоламид уменьшает экскрецию амфетамина и хинидина с мочой и, таким образом, может увеличивать величину и продолжительность действия амфетаминов и усиливать действие хинидина. Ацетазоламид оказывает диуретическое действие, сопровождающееся выведением калия с мочой. В связи с чем, следует соблюдать осторожность при применении ацетазоламида у пациентов, уже получающих диуретики (например, фуросемид или гидрохлоротиазид) или глюкокортикостероиды, так как это может увеличить риск развития электролитных нарушений и дегидратации. Следует соблюдать

меры предосторожности при применении ацетазоламида у пациентов, получающих дигоксин по поводу мерцательной аритмии или кардиомиопатии, так как гипокалиемия увеличивает риск сопутствующей брадикардии или других форм токсичности дигоксина. Одновременное применение ацетазоламида с дропериДОлом и калийсберегающими диуретиками повышает риск удлинения интервала QT и последующих аритмий. Уменьшение диуретического эффекта происходит при комбинированном применении с хлоридом аммония и другими кислотообразующими диуретиками. Увеличение гипотензивного эффекта в отношении внутриглазного давления возможно при одновременном применении с холинергическими препаратами и бета-адреноблокаторами. Ацетазоламид усиливает действие эфедрина. Повышает концентрацию в плазме крови карбамазепина, недеполяризующих миорелаксантов. Ацетазоламид может повышать концентрацию циклоспорина. Увеличивает выведение лития. Ацетазоламид может снижать антисептическое действие метенамина на мочевыводящую систему. Одновременное использование ацетазоламида и натрия гидрокарбоната увеличивает риск формирования камней в почках. Одновременное применение ацетазоламида с другими ингибиторами карбоангидразы не рекомендуется из-за возможных аддитивных эффектов. При совместном применении ацетазоламида с метенамином существует риск образования конкрементов в моче. Были отдельные сообщения о снижении содержания примидона в плазме крови при одновременном применении с ацетазоламидом.

4.6. Фертильность, беременность и лактация.

Беременность

В исследованиях на животных выявлено тератогенное и эмбриотоксическое действие ацетазоламида. Адекватных контролируемых клинических исследований безопасности и эффективности ацетазоламида у беременных не проводилось. Применение ацетазоламида в период беременности противопоказано.

Лактация

Ацетазоламид в небольших количествах проникает в грудное молоко. Применение ацетазоламида в период грудного вскармливания противопоказано.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами.

Ацетазоламид, 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.

4.8. Нежелательные реакции.

Резюме профиля безопасности

Нежелательные реакции классифицированы согласно частоте встречаемости и по органам и системам. Принято следующее определение частоты появления нежелательных реакций: очень часто $>1/10$, часто от $>1/100$ до $<1/10$, нечасто от $>1/1000$ до $<1/100$, редко от $>1/10000$ до $<1/1000$, очень редко от $<1/10000$, частота неизвестна (не может быть определена на основании доступных данных).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы: редко - апластическая анемия, тромбоцитопения, агранулоцитоз, лейкопения, тромбоцитопеническая пурпура, миелосупрессия, панцитопения.

Нарушения со стороны иммунной системы: частота неизвестна – анафилактические реакции.

Нарушения метаболизма и питания: часто – снижение аппетита, нарушение вкуса, метаболический ацидоз и электролитные нарушения (обычно могут быть скорректированы применением натрия бикарбоната); *нечасто* – жажда; *редко* – глюкозурия; *частота неизвестна* – гипокалиемия, гипонатриемия.

Психические нарушения: нечасто – депрессия, раздражительность; *частота неизвестна* – возбуждение, спутанность сознания, дезориентация.

Нарушения со стороны нервной системы: часто – головокружение, парестезия, в частности ощущение «покалывания» в конечностях; *нечасто* – «приливы», головная боль; *очень редко* – сонливость, периферический парез, судороги; *частота неизвестна* – атаксия.

Нарушения со стороны органа зрения: редко – транзиторная миопия (это состояние полностью исчезало при снижении дозы либо отмене ацетазоламида).

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта: редко – нарушение слуха и звон в ушах.

Желудочно-кишечные нарушения: нечасто – тошнота, рвота, диарея, мелена; *частота неизвестна* – сухость во рту, дисгевзия.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей: редко – фульминантный некроз печени, нарушение функции печени, гепатит, холестатическая желтуха; *частота неизвестна* – печеночная недостаточность, печеночная колика.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: редко – фотосенсибилизация; *частота неизвестна* – кожный зуд, кожная сыпь, мультиформная эритема, синдром

Стивенса-Джонсона, острый генерализованный экзантематозный пустулез, токсический эпидермальный некролиз, крапивница.

Нарушения со стороны мышечной, скелетной и соединительной ткани: частота неизвестна – артралгия.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: частота неизвестна – образование конкрементов в почках, кристаллурия, почечная и мочеточниковая колика, поражение почек, полиурия, гематурия, почечная недостаточность.

Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез: нечасто – снижение либидо.

Общие нарушения и реакции в месте введения: часто – усталость; нечасто – лихорадка, слабость.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза - риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств - членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

109074, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Телефоны: +7 (495) 698-45-38, +7 (499) 578-02-30

Факс: +7 (495) 698-15-73

E-mail: pharm@roszdravnadzor.ru

www.roszdravnadzor.ru/people

4.9. Передозировка.

Симптомы

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 плазме крови,

особенно калия, натрия, а также pH крови. В случае метаболического ацидоза применяется гидрокарбонат натрия. Ацетазоламид выводится с помощью гемодиализа.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства.

Фармакотерапевтическая группа: диуретическое средство.

Код АТХ: S01EC01

Механизм действия

Ацетазоламид является системным ингибитором карбоангидразы со слабой диуретической активностью. Карбоангидраза (КА) - фермент, участвующий в процессе гидратации диоксида углерода и дегидратации угольной кислоты. Ингибирование карбоангидразы уменьшает образование ионов бикарбоната с последующим снижением транспорта натрия внутрь клеток.

Фармакодинамические эффекты

Эффекты применения препаратов ацетазоламида обусловлены точкой приложения молекулы: сосудистые сплетения головного мозга, проксимальный отдел нефрона, ресничное тело глаза, эритроциты.

Ацетазоламид используется для лечения ликвородинамических нарушений и внутричерепной гипертензии за счет снижения избыточной продукции ликвора на уровне сосудистых сплетений головного мозга. Угнетение карбоангидразы в эпендимоцитах сосудистого сплетения понижает избыточный отрицательный заряд в клетках эпендимы и уменьшает градиентную фильтрацию плазмы в полость желудочков мозга.

Ацетазоламид используется в терапии отеочного синдрома за счет слабого диуретического эффекта. В результате угнетения активности карбоангидразы в проксимальном отделе нефрона происходит уменьшение образования угольной кислоты и снижение реабсорбции бикарбоната и ионов натрия эпителием канальцев, в связи с чем значительно увеличивается выделение воды. 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. В течение последующих трех дней терапии компенсаторно активируется реабсорбция ионов натрия в дистальном отделе нефрона, снижая мочегонный эффект ацетазоламида.

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 проксимального отдела нефрона.

Ацетазоламид применяется для лечения глаукомы. В процессе образования водянистой влаги глаза ионы бикарбоната (HCO_3^-) активно транспортируются в заднюю камеру из цитоплазмы беспигментных клеток, чтобы компенсировать градиент положительных ионов, обусловленный активным транспортом ионов натрия.

Ингибиторы КА блокируют образование угольной кислоты, таким образом снижая продукцию ионов HCO_3^- . В отсутствие достаточного количества ионов HCO_3^- увеличивается позитивный ионный градиент, что вызывает снижение секреции водянистой влаги. 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 наблюдается через 3-5 часов, внутриглазное давление остается ниже исходного уровня в течение 6-12 часов. В среднем внутриглазное давление снижается на 40-60% от исходного уровня.

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

5.2. Фармакокинетические свойства.

Абсорбция

Ацетазоламид хорошо всасывается из желудочно-кишечного тракта. После приема внутрь в дозе 500 мг максимальная концентрация (12-27 мкг/мл) достигается через 1-3 часа. В минимальных концентрациях удерживается в крови в течение 24 часов с момента введения.

Распределение

Ацетазоламид распределяется в эритроцитах, плазме крови и в почках, в меньшей степени - в печени, мышцах, глазном яблоке и центральной нервной системе. Ацетазоламид проникает через плацентарный барьер, в небольшом количестве выделяется с грудным молоком.

Биотрансформация

Не кумулирует в тканях и не метаболизируется в организме.

Элиминация

Выводится почками в неизмененном виде. После приема внутрь около 90% принятой дозы выделяется почками в течение 24 часов.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ.

Целлюлоза микрокристаллическая (МКЦ-101 Премиум)

Повидон-К25

Кроскармеллоза натрия

Магния стеарат

Кремния диоксид коллоидный.

6.2. Несовместимость.

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения).

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении.

При температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки.

По 10, 12, 24 или 30 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной, либо пленки поливинилхлоридной/поливинилиденхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

Или по 10, 12, 24 или 30 таблеток в контурную ячейковую упаковку из материала комбинированного на основе фольги (трехслойный материал, включающий алюминиевую фольгу, пленку из ориентированного полиамида, поливинилхлоридную пленку) и фольги алюминиевой печатной лакированной.

1, 2, 3, 4, 5 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в картонную упаковку (пачку).

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата и другие манипуляции с препаратом.

Нет особых требований к утилизации.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

ООО «Атолл»

Россия, 445351, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел.: +79874599991, +79874599992

E-mail: ozon@ozon-pharm.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения.

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ООО «Озон»

Россия, 445351, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел.: +79874599991, +79874599992

E-mail: ozon@ozon-pharm.ru

www.ozonpharm.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

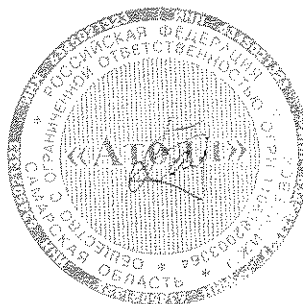
**9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ
РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)**

Дата первой регистрации

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Ацетазоламид доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <http://www.eurasiancommission.org>.

Представитель ООО «Атолл»
по доверенности



Бадина Е.Ю.