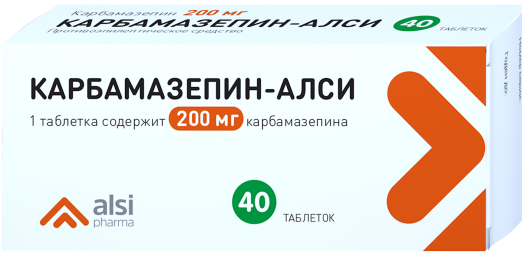
Инструкция по применению
Карбамазепин-Алси Таблетки 200 мг 40 шт

Характеристики



Форма выпуска: Таблетки
Страна: Россия
Производитель: Алси Фарма
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Карбамазепин
Количество в упаковке: 40
Дозировка действующего вещества: 200 мг

Описание

Противосудорожный препарат

Действующее вещество

Карбамазепин

Состав

карбамазепин 200 мг Вспомогательные вещества: крахмал картофельный - 80.5 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 16.4 мг, тальк - 3.1 мг, магния стеарат - 3.1 мг, повидон (поливинилпирролидон) - 14.4 мг, полисорбат (твин-80) - 2.5 мг.

Форма выпуска

Таблетки

Фармакокинетика

Абсорбция - медленная, но достаточно полная (приtм пищи существенно не влияет на скорость и степень всасывания). После однократного приема Cmax в плазме крови достигается через 12 ч. Равновесные концентрации препарата в плазме достигаются через 1-2 недели. Среди пациентов наблюдаются существенные индивидуальные различия значения равновесных концентраций в терапевтическом диапазоне. Связь с белками плазмы крови составляет 70-80%. Концентрация неизмененного карбамазепина в спинномозговой жидкости и слюне пропорциональна количеству несвязанного с белками активного вещества (20-30%). Концентрация в грудном молоке составляет 25-60 % от таковой в плазме. Проникает через плацентарный барьер. Метаболизируется в печени, преимущественно по эпоксидному пути с образованием метаболитов: активного - карбамазепин-10,11-эпоксида и малоактивного - 9-гидрокси-метил-10 карбамоилакридан. Основным изоферментом, обеспечивающим биотрансформацию карбамазепина в карбамазепин-10,11-эпоксид, является изофермент цитохрома Р 450 3 А 4. Содержание карбамазепин-10,11-эпоксида составляет около 30% от уровня карбамазепина в плазме. Биотрансформация карбамазепин-10,11-эпоксида в карбамазепин-10,11-трансдиол происходит при помощи микросомального фермента эпоксид гидролазы. Другой путь метаболизма карбамазепина - образование различных моногидроксилированных производных, а также N -глюкуронидов. Т 1/2 после разового приема составляет в среднем около 36 ч (колеблется от 25 до 65 ч), после повторного приема - 16-24 ч. У пациентов, получающих дополнительно другие противоэпилептические препараты, индуцирующие ферменты печени, в среднем 9-10 ч. Выводится преимущественно в виде неактивных метаболитов с мочой (примерно 70%) и калом (примерно 30%). Около 2% выводится с мочой в виде неизмененного карбамазепина и 1% в виде карбамазепин-10,11- эпоксида. У детей вследствие более быстрого выведения карбамазепина может потребоваться применение более высоких доз препарата из расчета на кг массы тела по сравнению с взрослыми. Нет данных о том, что фармакокинетика карбамазепина меняется у пациентов пожилого возраста. Данных по фармакокинетике карбамазепина у пациентов с нарушениями функции почек или печени нет.

Показания

Эпилепсия (монотерапия или в составе комплексной терапии): сложные и простые парциальные припадки (с потерей или без потери сознания) с вторичной генерализацией или без нее, а также генерализованные тонико-клонические припадки. Смешанные формы эпилептических припадков. Острые маниакальные состояния и поддерживающая терапия биполярных аффективных расстройств с целью профилактики обострений или снижения выраженности клинических проявлений, в комплексной терапии синдрома алкогольной абстиненции, невралгия тройничного нерва (идиопатическая, при рассеянном склерозе), идиопатическая невралгия языкоглоточного нерва, болевой синдром при диабетической невропатии, полиурия и полидипсия нейрогормональной природы при несахарном диабете.

Способ применения и дозы

Внутрь, вне зависимости от приема пищи с небольшим количеством жидкости. Эпилепсия: По возможности, карбамазепин следует назначать в виде монотерапии. Лечение начинают с небольшой суточной дозы, которую в последующем медленно повышают до достижения оптимального эффекта. Присоединение карбамазепина к уже проводящейся противоэпилептической терапии следует проводить постепенно. Для взрослых начальная доза 100-200 мг 1-2 раза/сут. Затем дозу медленно повышают до 400 мг 2-3 раза/сут. Максимальная суточная доза 2000 мг. Для детей в возрасте до 5 лет начальная доза 20-60 мг/сут с повышением на 20-60 мг каждые два дня. У детей с 5 лет начальная доза составляет 100 мг/сут, с последующим повышением на 100 мг в неделю. Поддерживающая доза для детей составляет 10-20 мг/кг массы тела/сут за 2-3 приема. Для обеспечения точного дозирования, у детей до 5 лет, необходимо использовать жидкие пероральные лекарственные формы карбамазепина. Невралгия тройничного или языкоглоточного нервов: Начальная доза 200-400 мг/сут, затем дозу постепенно повышают не более чем на 200 мг в день вплоть до прекращения болей (в среднем, до 600-800 мг), затем уменьшают до минимальной эффективной дозы. При лечении больных пожилого возраста начальная доза 100 мг 2 раза/сут. Алкогольный абстинентный синдром: Средняя доза - 200 мг 3 раза/сут. В тяжелых случаях, в первые дни, дозу можно повысить до 400 мг 3 раза/сут. В начале лечения при тяжелых явлениях абстиненции назначается в сочетании с дезинтоксикационной терапией, седативными и снотворными препаратами. Полиурия и полидипсия при несахарном диабете: Средняя доза для взрослых - 200 мг 2-3 раза /сут. У детей доза подбирается с учетом массы тела и возраста. Болевой синдром при диабетической невропатии: 200 мг 2-4 раза/сут. Острые маниакальные состояния и поддерживающая терапия биполярных аффективных расстройств: Суточная доза 400-1600 мг (средняя суточная доза 200-600 мг) за 2-3 приема/сут. В острых случаях дозу повышают достаточно быстро. При поддерживающей терапии повышение дозы должно быть постепенным и небольшим.

Противопоказания

AV-блокада угнетение костномозгового кроветворения в анамнезе печеночные порфирии одновременный прием ингибиторов МАО и в течение 2-х недель после их отмены период грудного вскармливания гиперчувствительность к любому из компонентов препарата или сходным в химическом отношении лекарственным препаратам (трициклические антидепрессанты). С осторожностью применять при: низком уровне лейкоцитов или тромбоцитов смешанных формах эпилептических приступов, включающих абсанс в пожилом возрасте при сердечной, печеночной или почечной недостаточности повышенном внутриглазном давлении гипонатриемии разведения гипотиреозе гиперплазии предстательной железы беременности (повышенный риск развития нарушений внутриутробного развития, включая пороки развития).

Побочные действия

Нарушения со стороны нервной системы: головокружение, атаксия, сонливость, чувство усталости, головная боль, диплопия, нарушения аккомодации, тремор, мышечная дистония, тики, нистагм, орофациальная дискинезия, глазодвигательные нарушения, дизартрия, хореоатетоидные расстройства, периферическая нейропатия, парестезии, парез, нарушения вкуса, злокачественный нейролептический синдром. Нарушения со стороны психики: галлюцинации (зрительные или слуховые), депрессия, анорексия, беспокойство, агрессивное поведение, ажитация, дезориентация, усиление психоза. Со стороны кожи и ее придатков: аллергический дерматит, крапивница, эксфолиативный дерматит, эритродермия, системная красная волчанка, зуд, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, реакции фотосенсибилизации, мультиформная и узловатая эритема, нарушения пигментации кожи, пурпура, акне, потливость, выпадение волос. Сообщалось о редких случаях гирсутизма, однако причинная взаимосвязь этого осложнения с приемом препарата остается неясной. Со стороны системы кроветворения: лейкопения, тромбоцитопения, эозинофилия, лейкоцитоз, лимфоаденопатия, дефицит фолиевой кислоты, агранулоцитоз, апластическая анемия, панцитопения, анемия, истинная эритроцитарная аплазия, мегалобластная анемия, вариегатная порфирия, поздняя кожная порфирия, острая перемежающаяся порфирия, ретикулоцитоз, гемолитическая анемия. Со стороны гепатобилиарной системы: повышение показателей ГГТ, ЩФ, трансаминаз, гепатит (холестатического, паренхиматозного (гепатоцеллюлярного) или смешанного типа), желтуха, гранулематозный гепатит, печеночная недостаточность. Со стороны ЖКТ: тошнота, рвота, сухость во рту, диарея, запор, боли в животе, глоссит, стоматит, панкреатит. Реакции повышенной чувствительности: мультиорганная гиперчувствительность замедленного типа с лихорадкой, кожными высыпаниями,

васкулитом, лимфоаденопатией, артралгией, лейкопенией, эозинофилией, гепатоспленомегалией и измененными показателями функции печени (указанные проявления встречаются в различных комбинациях). Могут вовлекаться и другие органы (легкие, почки, поджелудочная железа, миокард, толстая кишка). Асептический менингит с миоклонусом и эозинофилией, анафилактическая реакция, ангионевротический отек. Со стороны сердечно-сосудистой системы: нарушения внутрисердечной проводимости, снижение или повышение АД, брадикардия, аритмия, AV-блокада с обмороками, коллапс, застойная сердечная недостаточность, ухудшение течения ИБС, тромбофлебит, тромбоэмболия. Со стороны эндокринной системы и обмена веществ: отеки, задержка жидкости, увеличение массы тела, гипонатриемия и снижение осмолярности плазмы вследствие эффекта, сходного с действием антидиуретического гормона, что в редких случаях приводит к водной интоксикации (гипонатриемии разведения), сопровождающейся летаргией, рвотой, головной болью, дезориентацией и неврологическими нарушениями, повышение уровня пролактина, сопровождающееся или не сопровождающееся галактореей, гинекомастией, снижение концентрации трийодтиронина и тироксина, повышение концентрации тиреотропного гормона, что обычно не сопровождается клиническими проявлениями, нарушения метаболизма костной ткани (снижение концентрации кальция и 25-гидроксиколекальциферола в плазме крови), что приводит к остеомаляции, повышение концентрации холестерина, включая холестерин липопротеидов высокой плотности и триглицеридов. Со стороны мочеполовой системы: интерстициальный нефрит, почечная недостаточность, альбуминурия, гематурия, олигурия, азотемия, учащенное мочеиспускание, задержка мочи, расстройства половой функции, нарушения сперматогенеза. Со стороны органов чувств: нарушения вкусовых ощущений, помутнение хрусталика, повышение внутриглазного давления, конъюнктивит, расстройства слуха. Со стороны скелетно-мышечной системы: артралгии, мышечные боли, мышечная слабость, судороги. Со стороны дыхательной системы: реакции гиперчувствительности, характеризующиеся лихорадкой, одышкой, пневмонитом или пневмонией. Изменение результатов лабораторных исследований: гипогаммаглобулинемия.

Передозировка

Симптомы: ЦНС: угнетение функций центральной нервной системы вплоть до комы, дезориентация, сонливость, ажитация, галлюцинации, ощущение «тумана» перед глазами, дизартрия, нистагм, атаксия, дискинезия, гиперрефлексия сменяющаяся на гипорефлексию, судороги, психомоторные расстройства, миоклонус, гипотермия, мидриаз, дыхательная система: угнетение дыхания, отек легких, сердечно-сосудистая система: тахикардия, снижение или повышение АД, нарушение проводимости сердца с расширением комплекса QRS, остановка сердца, пищеварительная система: рвота, задержка эвакуации пищи из желудка, снижение моторики толстой кишки, мочевыделительная система: задержка мочи, олигурия или анурия, задержка жидкости, гипонатриемия разведения, лабораторные показатели: метаболический ацидоз, гипергликемия, повышение мышечной фракции КФК, гипонатриемия. Лечение: специфический антидот отсутствует. Промывание желудка, назначение активированного угля (поздняя эвакуация желудочного содержимого может привести к отсроченному всасыванию на 2-3 сут и повторному появлению симптомов интоксикации), госпитализация, симптоматическая терапия. Неэффективны форсированный диурез, гемодиализ и перитонеальный диализ (диализ показан при сочетании тяжелого отравления и почечной недостаточности). Рекомендуется проведение гемосорбции на угольных сорбентах.

Взаимодействие с другими препаратами

Одновременное применение с ингибиторами изофермента CYP 3 A 4 может привести к повышению концентрации карбамазепина в плазме. Совместное применение индукторов изофермента CYP 3 A 4 может привести к ускорению метаболизма карбамазепина и к возможному снижению его концентрации в плазме. Отмена одновременно принимаемых индукторов изофермента CYP 3 A 4 может снижать скорость биотрансформации карбамазепина и приводить к повышению уровня карбамазепина в плазме крови. При одновременном применении с препаратами, метаболизирующимися изоферментом CYP 3 A 4, возможна индукция метаболизма и снижение их концентрации в плазме. Препараты, которые могут повысить концентрацию карбамазепина или карбамазепина-10,11-эпоксида в плазме: декстропропоксифен, ибупрофен, даназол, макролидные антибиотики (например, эритромицин, тролеандомицин, джозамицин, кларитромицин), флуоксетин, флувоксамин, нефазодон, пароксетин, тразодон, вилоксазин, стирипентол, вигабатрин, азолы (например, итраконазол, кетоконазол, флуконазол, вориконазол), лоратадин, терфенадин, локсапин, оланзапин, кветиапин, изониазид, ингибиторы вирусной протеазы для терапии ВИЧ-инфекции (например, ритонавир), ацетазоламид, верапамил, дилтиазем, омепразол, оксибутинин, дантролен, тиклопидин, никотинамид

(у взрослых, только в высоких дозах), возможно - циметидин, дезипрамин, примидон, вальпроевая кислота. Препараты, которые могут снижать концентрацию карбамазепина в плазме: фелбамат, метсуксимид, окскарбазепин, фенобарбитал, фенсуксимид, фенитоин, фосфенитоин, примидон, прогабид, теофиллин, аминофиллин, изотретиноин, рифампицин, цисплатин, доксорубицин, растительные препараты, содержащие зверобой продырявленный и, хотя данные противоречивы, возможно, также клоназепам, вальпроевая кислота или вальпромид. Влияние карбамазепина на концентрацию в плазме препаратов, применяемых в качестве сопутствующей терапии: Карбамазепин может снизить концентрацию в плазме или уменьшить или даже полностью нивелировать эффекты следующих препаратов: метадон, парацетамол, антипирин, трамадол, доксициклин, пероральные анти коагулянты (варфарин, фенпрокумон, дикумарол, аценокумарол), бупропион, циталопрам, тразодон, трициклические антидепрессанты (имипрамин, амитриптилин, нортриптилин, кломипрамин), клобазам, клоназепам, этосуксимид, фелбамат, ламотриджин, окскарбазепин, примидон, тиагабин, топирамат, вальпроевая кислота, зонизамид, итраконазол, празиквантел, иматиниб, клозапин, галоперидол, бромперидол, оланзапин, кветиапин, рисперидон, зипрасидон, применяемые при терапии ВИЧ-инфекции (индинавир, ритонавир, саквинавир), алпразолам, мидазолам, теофиллин, блокаторы кальциевых каналов группы дигидропиридинов (например, фелодипин), дигоксин, пероральные контрацептивные средства (необходим подбор альтернативных методов контрацепции), глюкокортикостероиды (например, преднизолон, дексаметазон), циклоспорин, эверолимус, левотироксин натрия, эстрогены и/или прогестерон. Имеются сообщения о том, что на фоне приема карбамазепина уровень фенитоина в плазме крови может как повышаться, так и снижаться, а уровень мефенитоина - повышаться (в редких случаях). Комбинации, которые следует принимать во внимание: Возможно усиление гепатотоксичности, вызванной изониазидом, в случае одновременного применения с карбамазепином. В случае совместного назначения с леветирацетамом, возможно усиление токсического действия карбамазепина. Комбинированное применение карбамазепина и лития или метоклопрамида, а также карбамазепина и нейролептических средств (галоперидола, тиоридазина) может привести к повышению частоты нежелательных неврологических реакций (в случае последней комбинации - даже при терапевтических концентрациях активных веществ в плазме крови). Одновременное применение карбамазепина с некоторыми диуретическими средствами (гидрохлоротиазидом, фуросемидом) может приводить к гипонатриемии, сопровождающейся клиническими проявлениями. Карбамазепин может проявлять антагонизм действию недеполяризующих миорелаксантов (например, панкурония бромид). В случае применения такой комбинации лекарственных средств может возникнуть необходимость в повышении дозы указанных миорелаксантов, следует осуществлять внимательное наблюдение за

пациентами, так как возможно более быстрое, чем ожидалось, прекращение действия миорелаксантов. Совместный прием с грейпфрутовым соком может повысить уровень карбамазепина в плазме.

Особые указания

Перед началом лечения, а также периодически в процессе лечения следует проводить клинические анализы крови (включая подсчет числа тромбоцитов, ретикулоцитов, а также концентрации железа в сыворотке крови), общие анализы мочи и определение уровня мочевины в крови. Препарат обладает слабой антихолинергической активностью. Поэтому в случае применения препарата у пациентов с повышенным внутриглазным давлением необходим постоянный контроль этого показателя. Рекомендуется периодическое определение концентрации карбамазепина в плазме крови в случаях повышения частоты возникновения эпилептических приступов, при лечении детей, у беременных, в случае его применения в составе комплексной терапии, развитии выраженных побочных эффектов. Имеются отдельные сообщения о нарушениях мужской фертильности и/или нарушениях сперматогенеза. Однако причинная взаимосвязь этих нарушений с приемом препарата к настоящему времени не доказана. Перекрестные реакции повышенной чувствительности могут возникнуть между карбамазепином и фенитоином или окскарбазепином. На время терапии необходимо отказаться от приема алкоголя, так как карбамазепин усиливает угнетающее действие алкоголя на центральную нервную систему. Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами В период лечения необходимо воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.