

KISA ÜRÜN BİLGİSİ

1. BEŞERİ TIBBİ ÜRÜNÜN ADI

DİAZOMİD® 250 mg tablet

2. KALİTATİF VE KANTİTATİF BİLEŞİM

Etkin madde:

Asetazolamid 250 mg

Yardımcı maddeler:

Laktoz 85 mg

Tartrazin 0.15 mg

Yardımcı maddeler için 6.1'e bakınız.

3. FARMASÖTİK FORM

Tablet

Sarı renkli bir yüzü çentikli, bikonveks yuvarlak tablet

4. KLİNİK ÖZELLİKLER

4.1 Terapötik endikasyonlar

DİAZOMİD, açık aç veya sekonder glokomun tedavisinde kullanılır.

Akut konjestif glokomun preoperatif evresinde, konjestif kalp yetmezliği ve ilaçlarla oluşan sekonder ödemin tedavisinde diğer ilaçlarla birlikte, epilepsi tedavisinde diğer ilaçlarla birlikte yardımcı olarak ve akut yükseklik hastalığında semptomların önlenmesi ve iyileştirilmesinde kullanılır.

4.2 Pozoloji ve uygulama şekli

Oral yoldan uygulanır.

Pozoloji/uygulama sıklığı ve süresi:

Glokomda:

Yetişkinlerde açık aç glokomda ek tedavi olarak günde 1-4 defa 250 mg'lık 1 tablet verilir. Sekonder glokomlu ve akut kapalı aç glokomlu erişkinlere ameliyattan önce her 4 saatte bir 1 tablet verilir. Bazı akut glokom vakalarında 500 mg'lık başlangıç dozunu takiben her 4 saatte bir 125-250 mg verilir. 1000 mg/gün'ü aşan dozların fazladan bir etki sağlamadığı görülmüştür.

Epilepside:

Yetişkinlerde çeşitli epilepsi formlarının tedavisinde günlük 250 ila 1000 mg'lık dozlarda kullanılır.

Yetişkinlerde diğer antikonvülzanlarla birlikte verildiğinde başlangıç dozu günde 250 mg'lık 1 tablettir. Bazı hastalar daha düşük dozlara cevap verdikleri halde, optimum günlük doz 375 mg -1000 mg arasındadır.

Konjestif kalp yetmezliği ya da ilaçlara bağlı olarak oluşan sekonder ödemde:

Olağan diürez dozu 250-375 mg'dır (1-1,5 tablet). Ya günde bir kez ya da gün aşırı verilir; etkinin sürekli olması için aralıklı tedavi önerilir.

Konjestif kalp yetmezliğinde kısa süreli kullanılmalı, asidoz ve elektrolit düzeyleri çok iyi takip edilmelidir.

Akut yükseklik hastalığında:

Günlük doz 500-1000 mg'dır (2- 4 tablet).

Kurtarma ya da askeri operasyonlarda olduğu gibi süratli bir tırmanış söz konusuysa günde 1 g kullanılması önerilir. Tedaviye tercihan 24-48 saat önce başlanmalı, tırmanış sırasında ve zirveye ulaşıktan sonra en az 48 saat devam edilmelidir.

Eğer hızlı bir tırmanış gerçekleştiriliyorsa ve asetazolamid kullanılıyorsa, yüksek irtifa akciğer ödemi ya da yüksek irtifa beyin ödemi gibi yüksek irtifa hastalığının ağır formlarının ortaya çıkması halinde, bu ilacın kullanımı hemen aşağıya inilmesi gerekliliğini ortadan kaldırmaz.

Uygulama şekli:

Ağızdan uygulanır. Gastrointestinal etkileşimi önlemek için yiyecekler ile birlikte alınabilir.

Özel popülasyona ilişkin ek bilgiler:

Böbrek yetmezliği:

Belirgin böbrek hastalığı ve fonksiyon bozukluğu olan hastalarda kullanılmamalıdır.

Kreatinin klirensi 10-50 ml/dak: Her 12 saatte uygulanır.

Kreatinin klirensi <10 ml/dak: Kullanımından kaçınılmalıdır. Etkisi yoktur.

Hemodiyaliz: Orta derecede diyaliz edilebilir. (%20-%50)

Peritoneal diyaliz: Ek doz uygulanmasına gerek yoktur.

Karaciğer yetmezliği:

Ağır karaciğer bozukluğu (Child Pugh C) olan hastalarda kullanılmamalıdır.

Pediyatrik popülasyon:

Epilepside:

Ek tedavi olarak çocuklara günde kg başına 8-30 mg, bölünmüş dozlar halinde (1-4 defada) verilir. Çocuklarda toplam günlük doz 750 mg'ı aşmamalıdır.

12 yaşın altındaki pediyatrik hastalarda etkililik ve güvenlilik ile ilgili yeterli çalışma bulunmamaktadır. Sınırlı veriler çocuklarda kronik metabolik asidoza ikincil olarak büyüme geriliğinin olabileceğini önermektedir.

Geriatrik popülasyon:

Böbrek fonksiyonları azalmış olan yaşlı hastalarda ciddi olabilen metabolik asidoz meydana gelebilir.

Genellikle yaşlı hastalarda doz ayarı dikkatli yapılmalıdır. Hastanın genel klinik durumu ve birlikte kullanılan ilaçlar dikkate alınarak doz aralığının en düşük seviyesinden başlanmalıdır.

Başlangıç dozu olarak günde 2 kez 250 mg uygulanır, en düşük etkili doz kullanılmalıdır.

4.3 Kontrendikasyonlar

DİAZOMİD aşağıdaki durumlarda kontrendikedir:

- Asetazolamide ya da ilaç içindeki yardımcı maddelerden birine karşı aşırı duyarlılık hikayesi olanlarda. Bir sülfonamid türevidiğinden, asetazolamid, sülfonamid ve diğer sülfonamid türevleri arasında, çapraz duyarlılık reaksiyonları görülebilir.
- Serum sodyum ve/veya potasyum düzeylerinin düştüğü durumlarda, belirgin böbrek, karaciğer hastalığı ve fonksiyon bozukluğu vakalarında, böbrek üstü bezi yetmezliğinde ve hiperkloremik asidozda.
- Hepatik ansefalopati gelişme riski nedeniyle, sirozlu hastalarda (Child Pugh C)

- Kronik non-konjestif kapalı açı glokomu olan hastalarda uzun süreli asetazolamid kullanımı, açının organik olarak kapanmasına yol açarken göz içi basıncının düşmesiyle glokomdaki kötüleşmeyi maskeleyebileceğinden, kontrendikedir.

4.4 Özel kullanım uyarıları ve önlemleri

- Bütün sülfonamid türevleriyle görülebilen aşağıdaki advers reaksiyonlar asetazolamidle de ortaya çıkabilir: Anafilaksi, ateş, döküntü (eritema multiforme, Stevens-Johnson sendromu, toksik epidermal nekroliz dahil), kristalüri, böbrek taşı, kemik iliği depresyonu, trombositopenik purpura, hemolitik anemi, lökopeni, pansitopeni ve agranülositoz. Böylesi bir reaksiyon saptandığında ilaç kesilmeli ve uygun bir tedavi uygulanmaya başlanmalıdır.

- Asetazolamid alan hastalarda bilateral akut açı kapanması glokomu ve/veya miyopi bildirilmiştir. Akut açı kapanması glokomu ve/veya miyopi için önerilen mekanizma, diğer sülfonamid türevleri için de tarif edildiği gibi, sülfü bileşenine karşı oluşan alerjik veya idiosinkratik reaksiyondan dolayı siliokoroidal ödemdir. Bu durumda DİAZOMİD kesilmelidir ve tedavi eden doktorun tavsiyesi alınmalıdır.

- Asetazolamidle tedavi edilen hastalarda kan glukozunda yükselmeler ve düşüşler görülmüştür.

Asidoz gelişme riski olan ya da diabetes mellituslu hastalara asetazolamid verilirken dikkatli olunmalıdır; yaşlılarda ve böbrek fonksiyon bozukluğu olan hastalarda ciddi metabolik asidoz ortaya çıkabilir. Uzun süreli tedavi sırasında periyodik olarak plazma elektrolitleri ve kan sayımı kontrol edilmeli ve hastalar herhangi bir olağandışı deri döküntüsünü bildirmeleri konusunda uyarılmalıdırlar.

- Dozun artırılması diürezi artırmaz, ancak sersemlik ve/veya parestezi oluşma insidansını artırabilir.

- Alveoler ventilasyonunun bozulmuş olma olasılığı olan pulmoner tıkanması ya da amfizemi olan hastalarda, asetazolamid, asidozu ağırlaştırabileceğinden dikkatle uygulanmalıdır.

- Dağ tırmanışları sırasında, akut dağ hastalığını önlemek amacıyla kademeli bir tırmanış gerçekleştirilmelidir. Eğer hızlı bir tırmanış gerçekleştiriliyorsa ve asetazolamid kullanılıyorsa, yüksek irtifa akciğer ödemi ya da yüksek irtifa beyin ödemi gibi yüksek irtifa hastalığının ağır formlarının ortaya çıkması halinde, bu ilacın kullanımı hemen aşağıya inilmesi gerekliliğini ortadan kaldırmaz.

- Eş zamanlı olarak yüksek dozda aspirin kullanan hastalarda asetazolamid uygulanırken dikkatli olunmalıdır, çünkü anoreksi, taşipne, letarji, metabolik asidoz, koma ve ölüm vakaları bildirilmiştir.

- Asetazolamid idrardaki kristallerin düzeyinde artışa yol açabilir. Asetazolamid teofilinin HPLC yöntemiyle ölçümünde hatalı sonuç alınmasına yol açar.

- Karaciğer fonksiyon bozukluğunda kullanımı koma ile sonuçlanabilir.

- Nadir kalıtsal galaktoz intoleransı, Lapp laktoz yetmezliği ya da glikoz-galaktoz malabsorbsiyon problemi olan hastaların bu ilacı kullanmamaları gerekir.

- Bu tıbbi ürün tartrazin içerir. Alerjik reaksiyonlara sebep olabilir.

4.5 Diğer tıbbi ürünler ile etkileşim ve diğer etkileşim şekilleri

- Asetilsalisilik asit ile asetazolamidin birlikte kullanımı, ciddi asidoza neden olabilir ve MSS toksisitesi riski artar (bkz. bölüm 4.4).
- Asetazolamid fenitoin düzeylerini yükseltir ve kronik fenitoin tedavisi uygulanan hastalarda, antiepileptiğe bağlı osteomalazi oluşma riskini artırır.
- Primidon ve metabolitlerinin serum konsantrasyonlarını düşürerek, antikonvülzan etkiyi azaltabilir.
- Olası aditif etkiler nedeniyle, diğer karbonik anhidraz inhibitörleriyle kombinasyon halinde kullanımı önerilmez.
- Asetazolamid diğer folik asit antagonistlerinin etkilerini artırabilir.
- Asetazolamid kan glukoz düzeylerinde yükselme veya düşmeye neden olabileceğinden, antidiyabetik ilaç kullanan hastalarda dikkatli olunmalıdır.
- Asetazolamid amfetamin ve kinidinin idrarla atılımını azalttığından etkilerini artırabilir.
- Asetazolamid metenaminin üriner antiseptik etkisini önleyebilir.
- Asetazolamid lityum atılımını artırır ve lityum düzeyi azalabilir.
- Asetazolamid ile sodyum bikarbonatın birlikte kullanılması, böbrek taşı oluşumu riskini artırır.
- Asetazolamid siklosporin düzeylerini yükseltebilir.

4.6 Gebelik ve laktasyon

Genel tavsiye

Gebelik kategorisi: C.

Çocuk doğurma potansiyeli bulunan kadınlar /Doğum kontrolü (Kontrasepsiyon)

Çocuk doğurma potansiyeli bulunan kadınlarda planlanmış bir gebelikten önce uygun bir alternatif tedaviye geçilmelidir.

Hayvanlar üzerinde yapılan araştırmalar üreme toksisitesinin bulunduğunu göstermiştir. İnsanlara yönelik potansiyel risk bilinmemektedir.

Gebelik dönemi:

Gebe kadınlarda yapılmış yeterli ve iyi-kontrollü çalışmalar bulunmamaktadır.

Asetazolamid gebelerde ancak, olası yararın, fötüsle ilgili olası risklerden daha baskın olduğu durumlarda kullanılabilir.

Laktasyon dönemi:

Asetazolamid anne sütüne geçtiğinden anne sütü alan bebeklerde ciddi advers etki oluşturma potansiyeli bulunur; ilacın annenin tedavisindeki önemi ve bebek için potansiyel riski göz önünde bulundurularak, ya emzirmeye ya da ilacın kullanımına son verilmelidir.

Üreme yeteneği/ Fertilité

Erkek ve dişi sıçanlara diyet içinde uygulanan asetazolamid, 50 kg ağırlığındaki bir erişkin için maksimum doz olarak önerilen 1000 mg'lık dozun 4 katına kadar olan dozlarda doğurganlık üzerinde bir etki göstermemiştir.

4.7 Araç ve makine kullanımı üzerindeki etkiler

Dikkat isteyen işlerde çalışan hastaların asetazolamid kullanırken uyarılmaları gerekir.

4.8 İstenmeyen etkiler

Çok yaygın ($\geq 1/10$); yaygın ($\geq 1/100$, $< 1/10$), yaygın olmayan ($\geq 1/1.000$, $< 1/100$), seyrek ($\geq 1/10.000$, $< 1/1.000$) ve çok seyrek ($< 1/10.000$), bilinmiyor (eldeki verilerden hareketle tahmin edilemiyor) olarak tanımlanmaktadır.

Kan ve lenf sistemi hastalıkları:

Yaygın: Lökopeni

Bilinmiyor: Aplastik anemi, agranülositoz, trombositopeni, trombositopenik purpura.

Bağışıklık sistemi hastalıkları

Bilinmiyor: Anafilaksi

Metabolizma ve beslenme hastalıkları:

Çok yaygın: Metabolik asidoz, elektrolit dengesizliği

Yaygın: İştah kaybı, hipokalemi, hiperglisemi

Yaygın olmayan: Hiponatremi

Bilinmiyor: Hipoglisemi, osteomalazi

Sinir sistemi hastalıkları:

Çok yaygın: Uyuşukluk (parestezi)

Yaygın: Sersemlik, tat alma bozukluğu, baş ağrısı, depresyon

Yaygın olmayan: Huzursuzluk (ajitasyon), zihin karışıklığı (konfüzyon)

Bilinmiyor: Duyu azalması (hipoestezi), karıncalanma, yumuşak/gevşek felç, aktivite veya motor işlevlerin azalması (hipokinezi), hareket kontrolünde zorluğa bağlı yürüme bozukluğu (ataksi), konvülziyon

Göz hastalıkları:

Bilinmiyor: Bilateral akut açılı kapanması glokomu ve/veya miyopi

Kulak ve iç kulak hastalıkları:

Yaygın olmayan: İşitme bozuklukları

Bilinmiyor: Tinnitus

Vasküler hastalıklar:

Bilinmiyor: Al basması (flushing)

Gastrointestinal hastalıklar:

Çok yaygın: Gastrointestinal bozukluk

Yaygın: Mide bulantısı, diyare

Yaygın olmayan: KusmaBilinmiyor: Melena

Hepato-biliyer hastalıklar:

Bilinmiyor: Anormal karaciğer fonksiyonları, kolestatik sarılık, karaciğer yetmezliği, fulminan hepatik nekroz.

Deri ve deri altı dokusu hastalıkları:

Bilinmiyor: Ürtiker, ışığa duyarlılık, Stevens-Johnson sendromu, toksik epidermal nekroliz, akut yaygın ekzantematöz püstülozis dahil alerjik deri reaksiyonları.

Kas-iskelet bozuklukları, bağ doku ve kemik hastalıkları

Yaygın: Büyüme geriliği

Böbrek ve idrar yolları hastalıkları:

Çok yaygın: Poliüri

Yaygın olmayan: Uzun süreli tedaviyle artmış böbrek taşı riski

Bilinmiyor: Böbrek yetmezliği, hematüri, kristalüri, glikozüri

Genel bozukluklar ve uygulama bölgesine ilişkin hastalıklar:

Çok yaygın: Yorgunluk

Bilinmiyor: Kuvvetsizlik/güçten düşme, ateş, susuzluk

4.9. Doz aşımı ve tedavisi

Doz aşımı halinde semptomatik ve destekleyici tedavi yapılmalıdır. Asetazolamidin bilinen spesifik antidotu yoktur. Elektrolit dengesizliği, asidoz gelişmesi ve merkezi sinir sistemi etkilerinin ortaya çıkması beklenebilir. Serum elektrolit düzeyleri (özellikle potasyum) ve kan pH düzeyi izlenmelidir.

Elektrolit ve pH dengesini düzeltmek için destekleyici önlemler almak gerekir. Asidoz genellikle bikarbonat uygulamasıyla düzeltilebilir.

Yüksek eritrosit içi dağılım ve plazma proteinlere bağlanma düzeyine rağmen, asetazolamid diyaliz edilebilir. Bu, özellikle böbrek yetmezliğinin mevcut olduğu doz aşımı vakalarında önem taşır.

5. FARMAKOLOJİK ÖZELLİKLER

5.1 Farmakodinamik özellikler

Farmakoterapötik grup: Karbonik anhidraz inhibitörleri

ATC kodu: S01EC01

Asetazolamid, potent bir karbonik anhidraz inhibitörüdür. Asetazolamid civalı bir diüretik değildir; bakteriyostatik sülfonamidlerden tamamen ayrı bir kimyasal yapıya ve farmakolojik etkinliğe sahip olan bakteriyostatik olmayan bir sülfonamiddir.

Asetazolamid, karbondioksidin hidrasyonu ve karbonik asidin dehidrasyonunu içeren geri dönüşümlü reaksiyonu katalize eden enzim olan karbonik anhidraz üzerinde spesifik olarak etkili olan enzim inhibitörüdür. Gözde bu inhibitör etki göz içi sıvısının oluşumunu azaltarak, göz içi basıncını düşürür.

Merkezi sinir sistemindeki karbonik anhidraz inhibisyonunun merkezi sinir sistemi nöronlarından anormal, paroksizmal, aşırı deşarjı geciktirdiği görülmüştür. Buna bağlı olarak asetazolamid merkezi sinir sistemindeki bazı fonksiyon bozukluklarının (epilepsi gibi) tedavisinde yardımcı olarak işlev görür.

Asetazolamidin diüretik etkisi, böbreklerdeki karbondioksit hidrasyonu ve karbonik asit dehidrasyonunu içeren geri dönüşümlü reaksiyon üzerindeki etkisine bağlıdır. Bu yolla, bikarbonat iyonu, sodyum, su ve potasyumu beraberinde taşıyarak böbreklerden atılır.

5.2. Farmakokinetik özellikler

Emilim:

Asetazolamid, sindirim sisteminden oldukça hızlı emilir; doruk plazma konsantrasyonlarına ağızdan alındıktan 2 saat sonra ulaşılır.

Dağılım:

Plazma proteinlerine yüksek oranda bağlanır. Karbonik anhidraza sıkıca bağlıdır ve bu enzimi içeren dokularda, özellikle alyuvarlar ve böbrek korteksinde, yüksek konsantrasyonlarda bulunur.

Biyotransformasyon:

Asetazolamid biyotransformasyona uğramaz.

Eliminasyon:

Plazma yarılanma ömrünün 3-6 saat arasında olduğu tahmin edilmektedir. İdrarla değişmeden atılır ve anne sütüne geçer.

5.3 Klinik öncesi güvenlilik verileri

Asetazolamidin karsinojenik potansiyelini değerlendirmek için hayvanlarda yürütülmüş uzun süreli çalışmalar bulunmamaktadır. Bir bakteriyel mutajenisite incelemesinde, asetazolamid, metabolik aktivasyon ile birlikte ve metabolik aktivasyon olmaksızın değerlendirildiğinde, mutajenik bulunmamıştır. Erkek ve dişi sıçanlara diyet içinde uygulanan asetazolamid, 50 kg ağırlığındaki bir erişkin için maksimum doz olarak önerilen 1000 mg'lık dozun 4 katına kadar olan dozlarda doğurganlık üzerinde bir etki göstermemiştir.

6. FARMASÖTİK ÖZELLİKLER

6.1 Yardımcı maddelerin listesi

Laktoz
Mısır nişastası
PVP - K 30
Tartrazin
Magnezyum stearat.

6.2 Geçimsizlikler

Belirtilmemiştir.

6.3 Raf ömrü

60 ay

6.4 Saklamaya yönelik özel tedbirler

25°C'nin altındaki oda sıcaklığında saklayınız.

6.5 Ambalajın niteliği ve içeriği

10 tablet içeren PVC ve alüminyum blister ambalajlarda ambalajlanmıştır.

6.6 Beşeri Tıbbi üründen arta kalan maddelerin imhası ve diğer özel önlemler

Kullanılmamış olan ürünler ya da atık materyaller "Tıbbi Atıkların Kontrolü Yönetmeliği" ve "Ambalaj ve Ambalaj Atıklarının Kontrolü Yönetmelikleri"ne uygun olarak imha edilmelidir.

7. RUHSAT SAHİBİ

Sanofi aventis İlaçları Ltd. Şti.
Büyükdere Cad. No: 193 Levent
34394 Şişli - İstanbul
Tel: 0212 339 10 00
Faks: 0212 339 10 89

8. RUHSAT NUMARASI:

210/79

9. İLK RUHSAT TARİHİ/RUHSAT YENİLEME TARİHİ:

İlk ruhsat tarihi: 28.03.2007

Ruhsat yenileme tarihi:

10. KÜB'ÜN YENİLENME TARİHİ: