

Состав

действующее вещество: carbimazole;

1 таблетка содержит карбимазол 5 мг;

другие составляющие:

таблетки по 5 мг: маннит (Е 421), целлюлоза микрокристаллическая, крахмал кукурузный, кислота лимонная безводная, крахмалгликолят натрия (тип А), магния стеарат.

Лекарственная форма

Таблетки.

Основные физико-химические свойства:

таблетки по 5 мг: круглые, выпуклые таблетки белого цвета с распределительной чертой с одной стороны.

Фармакотерапевтическая группа

Антитиреоидные средства. Серосодержащие производные имидазола.

Код АТХ Н03В В01.

Фармакодинамика

Карбимазол в зависимости от его дозировки тормозит встраивание йода в тирозин, следовательно, дополнительный синтез гормонов щитовидной железы. Это свойство позволяет симптоматическую терапию гиперфункции щитовидной железы независимо от ее этиологии. Влияет ли карбимазол, кроме этого, на естественное течение заболевания при иммунологически обусловленной форме гипертиреоза (базедной болезни), то есть притормаживает ли он лежащий в основе заболевания иммунопатогенетический процесс, на это время с полной уверенностью определить невозможно. На выделение синтезированных гормонов щитовидной железы он не влияет. Этим объясняется в отдельных случаях разная продолжительность латентного периода действия препарата до нормализации концентрации тироксина и трийодтиронина в сыворотке крови, то есть до клинического улучшения состояния. Препарат не влияет также на гипертиреоз вследствие выделения гормонов после деструкции клеток щитовидной железы, например после радиотерапии или при тиреоидите.

Фармакокинетика

Карбимазол быстро и полностью всасывается и после всасывания превращается в свою действующую форму – тиамазол. После приема 15 мг карбимазола в течение 24-72 мин достигается максимальный сывороточный уровень –150 нг/нл.

Связывание тиамазола белком можно пренебречь. Тиамазол накапливается в щитовидной железе, где он лишь медленно метаболизируется, и поскольку продолжительность его действия более непосредственно связана с концентрацией вещества в щитовидной железе, чем с ее периодом полувыведения из плазмы, это приводит к продлению антитиреоидной активности. Это приводит к почти 24-часовой продолжительности действия отдельной дозы и позволяет применять препарат один раз в сутки. Кинетика тиамазола, согласно имеющимся в настоящее время сведениям, не зависит от состояния функции щитовидной железы.

Период полувыведения из организма составляет около 3 часов, при недостаточной функции печени он больше. Тиамазол выводится как с мочой, так и с желчью. Но фекальная экскреция незначительна, что позволяет заключить энтерогепатическую циркуляцию. Печенью в течение 24 часов выводится 70% тиамазола, из них лишь незначительное количество в неизменной форме. Сведений о фармакологической активности метаболитов в настоящее время нет.

Показания

- Нарушения функции щитовидной железы связаны с гиперпродукцией ее гормонов (гипертиреоз).
- Подготовка к тиреоидэктомии при гипертиреозе.
- Терапия до и после лечения радиоактивным йодом.

Противопоказания

- Повышенная индивидуальная чувствительность к карбимазолу, тиамазолу или другим компонентам препарата.
- Тяжелые нарушения со стороны системы крови, тяжелая печеночная недостаточность, холестаз.
- Одновременное применение препаратов радиоактивного йода.
- Дополнительная терапия с применением гормонов щитовидной железы в период беременности.
- Острый панкреатит в анамнезе после употребления карбимазола или тиамазола.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Нет достаточных данных по взаимодействию карбимазола с другими лекарственными средствами.

Следует с осторожностью применять карбимазол со средствами, которые могут вызвать агранулоцитоз.

Поскольку карбимазол является антагонистом витамина К, может усиливаться эффект антикоагулянтов.

Возможен рост уровня теофиллина в сыворотке крови и возможно развитие токсичности, если пациенты получают терапию антитиреоидными препаратами без снижения дозы теофиллина.

Существует риск перекрестной аллергии между карбимазолом, тиамазолом и пропилтиоурацилом.

Особенности применения

При возникновении первых признаков расстройства печени (боли в верхнем участке живота, отсутствие аппетита, общий зуд) прием препарата следует прекратить и немедленно провести мониторинг функции печени.

Карбимазол следует применять с осторожностью пациентам с легкой и умеренной печеночной недостаточностью.

При тяжелом нарушении функции печени лечение следует прекратить. Период полувыведения может увеличиваться в связи с нарушениями функции печени.

В результате применения карбимазола или его активного метаболита тиамазол может возникнуть острый панкреатит. В этом случае следует немедленно прекратить прием карбимазола. Во избежание рецидива не следует назначать карбимазол пациентам, имеющим в анамнезе острый панкреатит вследствие предварительного применения карбимазола или тиамазола. У таких больных повторный прием может привести к рецидиву острого панкреатита с сокращенным временем появления первых симптомов.

При назначении радиоактивного йода следует на этот период прекратить лечение карбимазолом.

Больным, которые не могут выполнять инструкции по применению препарата или не могут регулярно обследоваться, не следует лечиться карбимазолом.

Пациентам, у которых возможно возникновение судорог или ухудшение памяти, следует регулярно проводить анализ крови.

Пациентам с редкими наследственными формами непереносимости галактозы, дефицитом лактазы или синдромом глюкозо-галактозной мальабсорбции не следует принимать этот препарат.

Меры предосторожности необходимы пациентам с внутригрудным зобом, что может ухудшить начальное лечение карбимазолом. Обструкция трахеи может возникнуть из-за внутригрудного зоба.

При лечении небеременные женщины репродуктивного возраста должны использовать надежный метод контрацепции.

Существует риск перекрестной аллергии между карбимазолом, тиамазолом и пропилтиоурацилом.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Влияние на способность управлять автотранспортом или работать с другими механизмами неизвестно.

Применение в период беременности или кормления грудью

Карбимазол и его активный метаболит тиамазол проникают через плаценту и попадают в кровь плода в той же концентрации, что и в сыворотке крови матери. Женщинам во время беременности можно использовать карбимазол только в самых низких эффективных дозах без дополнительного употребления гормонов щитовидной железы и при придиричивой индивидуальной оценке пользы и риска. Если доза для матери в пределах стандартного диапазона и состояние ее щитовидной железы контролируется, нет доказательств развития нарушения щитовидной железы у новорожденных. Исследования показали, что частота врожденных пороков развития выше у детей, матери которых имели нелеченный гипертиреоз, чем у тех, кому проводили терапию карбимазолом.

Однако в очень редких случаях врожденные пороки развития наблюдались после применения карбимазола или его активного метаболита метимазола в период беременности. Возможна взаимосвязь возникновения мальформаций, в частности, атрезии хоан и врожденной аплазии кулис, что не может быть исключено при трансплацентарном воздействии карбимазола и метимазола. Применение карбимазола у женщин во время беременности, особенно в течение первого триместра и в высокой дозе, может привести к врожденным порокам

развития. К сообщенным порокам развития относятся: врожденная аплазия кожи, черепно-лицевые пороки развития (артезия хоан, лицевая дисморфия), омфалоцеле, артезия пищевода, аномалия желчно-кишечного протока, дефект межжелудочковой перегородки, гипопластическая форма груди и гипопластическая форма груди. Таким образом, применение карбимазола беременным и женщинам репродуктивного возраста возможно только тогда, когда ожидаемая польза матери превышает потенциальный риск для плода.

Сообщения о случаях нарушения функции почек, черепа, врожденных пороков сердечно-сосудистой системы, пупочной грыжи, желудочно-кишечных пороков развития, пупочных пороков и атрезии двенадцатиперстной кишки также поступали. Таким образом, карбимазол следует назначать в период беременности только тогда, когда пропилтиоурацил не подходит. Если карбимазол необходимо применять в период беременности, дозу следует откорректировать в зависимости от клинической картины пациентки. Можно применять низкие дозы и прекратить лечение за 3-4 недели раньше срока, чтобы снизить риск неонатальных осложнений. Прекращать лечение в период беременности нельзя, поскольку очень мало тироксина проникает через плаценту в последнем триместре.

Запрещается дополнительное лечение гормонами щитовидной железы (не применяется схема блокировки-замещения, поскольку незначительное количество тироксина способно проходить через плаценту в последнем триместре беременности).

Использование карбимазола у женщин во время беременности обязательно требует тщательного наблюдения за состоянием женщины, плода или новорожденного.

При терапии с применением карбимазола можно продолжать кормление, однако разрешается прием только малых доз (до 10 мг/сут) без дополнительного приема гормонов щитовидной железы. При этом необходимо контролировать функции щитовидной железы ребенка.

Способ применения и дозы

ЕСПА-КАРБ® применяют только при гиперфункции щитовидной железы, подтвержденной лабораторными тестами.

Взрослые

Доза в начале лечения должна составлять 20-60 мг, ее следует титровать в зависимости от функции щитовидной железы до достижения эутиреоидного

состояния пациента, чтобы уменьшить риск избыточного лечения и, как следствие, гипотиреоза. При необходимости распределения таблетки пополам следует положить на твердую поверхность риской вверх и слегка нажать большим пальцем.

Последующее лечение проводят одним из двух способов.

Поддерживающая терапия: конечная доза, как правило, составляет 5-15 мг/сут, которую можно принять как однократную суточную дозу. Терапию продолжают не менее 6-18 месяцев. Рекомендуется постоянный контроль функции щитовидной железы вместе с подходящим подбором дозы для поддержания эутиреоидного состояния.

Схема блокировки-замещения: поддерживаются начальные дозы 20-60 мг в сутки, дополнительно назначают L-тироксин 50-150 мкг в сутки, чтобы предотвратить гипотиреоз. Терапия длится не менее 6-18 месяцев.

Пациенты пожилого возраста

Если нет каких-либо противопоказаний или оговорок, то такие пациенты не нуждаются в специальной дозировке.

Дети

Нет достаточного опыта применения карбимазола детям, поэтому препарат не назначают этой возрастной категории пациентов.

Передозировка

Случаи передозировки не описаны.

Побочные реакции

При частотном анализе возникновения побочных действий выделены следующие категории:

очень часто ($\geq 10\%$);

часто ($\geq 1\% - < 10\%$);

нечасто ($\geq 0,1\% - < 1\%$);

редко ($\geq 0,01\% - < 0,1\%$);

очень редко ($< 0,01\%$);

неизвестно (частота не оценена из-за отсутствия данных).

Со стороны крови и лимфатической системы:

Нечасто: около 0,3–0,6 % случаев случаются агранулоцитозы. Они могут возникать через недели или месяцы после начала терапии и заставляют отказаться от приема лекарственного средства. В большинстве случаев они произвольно исчезают. Для лечения индуцированного медикаментозного агранулоцитоза по последним данным подтверждается применение факторов стимуляции колоний гранулоцитов (гранулоцитарный колониестимулирующий фактор «Филграстим»). Однако использование таких факторов должно происходить при согласовании с гематологом.

Очень редко: тромбопения, панцитопения, апластическая анемия, гемолитическая анемия.

Со стороны эндокринной системы:

В результате повышенной дозировки возможно возникновение субклинического или клинического гипотиреоза, а также рост зоба, связанный с повышением тиреостимулирующего гормона (ТСГ). В связи с этим после достижения эутиреоидного состояния дозу препарата ЭСПА-КАРБ необходимо уменьшить и/или дополнительно применять левотироксин натрия. Нецелесообразно полностью прекращать прием ЭСПА-КАРБ и продолжать терапию гормонами щитовидной железы.

Рост зоба в течение терапии ЭСПА-КАРБ при угнетенном ТСГ следует воспринимать как следствие основного заболевания и не лечить дополнительным приемом гормонов щитовидной железы.

После однократной тиреостатической терапии существует незначительный процент появления постгипотиреоза. В таких случаях речь идет не о побочном действии лекарственного средства, а о воспалительно-деструктивных процессах в паренхиме щитовидной железы в рамках основного заболевания.

Со стороны органов зрения:

Возможно возникновение или ухудшение эндокринной орбитопатии независимо от течения заболевания щитовидной железы: подобное осложнение само по себе не является поводом изменения терапевтической программы (тиреостатика, операция, радиоактивный йод), и его не следует воспринимать как побочное действие квалифицированно проводимой терапии.

Со стороны нервной системы: головные боли.

Со стороны пищеварительного тракта: тошнота, незначительные желудочно-кишечные расстройства, острый панкреатит.

Общие нарушения: лихорадка, недомогание, ушиб.

Нечасто: медикаментозная лихорадка, нарушения вкуса (дисгевзия, агевзия) или нарушения обоняния, которые проходят после прекращения лечения, причем нормализация может длиться несколько недель.

Очень редко: Артралгия и миалгия, которые обычно развиваются медленно и продолжаются после многомесячной длительной терапии. Клинические признаки воспаления суставов отсутствуют.

Генерализованные лимфаденопатия, артриты, нефриты, острые опухание слюнной железы, васкулит, невриты и полиневропатии, инсулино-аутоиммунный синдром (с сильным падением показателя сахара крови).

При приеме ЭСПА-КАРБ, вследствие сокращения патологически повышенной при гипертиреозе энергетической потребности, возможно возникновение (в целом, желательное) повышения веса тела. Пациентам следует сообщить, что при улучшении картины заболевания нормализуется энергетическая потребность организма.

Со стороны гепатобилиарной системы:

Очень редко: холестатическая желтуха или токсический гепатит. В целом симптомы исчезают после прекращения приема лекарственного средства. Клинически скрытые признаки холестаза при лечении следует отличать от уже повышенной к началу терапии активности гамма-глутамилтрансферазы в сыворотке крови как признака ферментной индукции вследствие гипертиреоза, а также повышения щелочной фосфатазы или ее костных изоферментов.

Со стороны кожи и ее производных:

Очень часто: аллергические проявления на коже (зуд, экзантема, крапивница) периодического характера. В большинстве случаев они обладают легкой формой и часто исчезают при продолжении терапии.

Очень редко: тяжелые формы проявлений к генерализованному дерматиту.

Выпадение волос, медикаментозно индуцированная эритематозная волчанка.

Со стороны костно-мышечной системы: в редких случаях – миопатия.

Пациенты, у которых после лечения карбимазолом возникает боль в мышцах, должны постоянно контролировать уровень креатинин-фосфокиназы.

Реакции гиперчувствительности: отек Квинке, мультисистемные реакции гиперчувствительности (кожный васкулит, реакции со стороны печени, легких и почек).

Со стороны сосудов: кровотечения.

Срок годности

Таблетки по 5 мг: 18 месяцев.

Условия хранения

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка

По 25 таблеток в блистере, по 2 блистера в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Линдофарм ГмбХ.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Нойштрассе 82, 40721 Гильден, Германия.

Источник инструкции

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