

Эпитропил



Код АТХ:

- [N03AX14](#)

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Леветирацетам](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндекс](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)
[Госреестр](#)^{МНН} [Википедия](#)^{МНН}
[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого или почти белого цвета, двояковыпуклые, овальные, без риса; на поперечном разрезе - белого или почти белого цвета.

	1 таб.
леветирацетам	1000 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 86.4 мг, кросповидон - 188 мг, макрогол 6000 (полиэтиленгликоль 6000) - 72 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 7.2 мг, кроскармеллоза натрия - 72 мг, магния стеарат - 14.4 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай II 85F48105 белый - (спирт поливиниловый - 20.63 мг, макрогол - 10.39 мг, тальк - 7.66 мг, титана диоксид - 5.32 мг).

10 шт. - упаковки контурные ячейковые (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (4) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (5) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (6) - пачки картонные.
15 шт. - упаковки контурные ячейковые (1) - пачки картонные.
15 шт. - упаковки контурные ячейковые (2) - пачки картонные.
15 шт. - упаковки контурные ячейковые (3) - пачки картонные.
15 шт. - упаковки контурные ячейковые (4) - пачки картонные.
15 шт. - упаковки контурные ячейковые (5) - пачки картонные.
15 шт. - упаковки контурные ячейковые (6) - пачки картонные.
25 шт. - упаковки контурные ячейковые (1) - пачки картонные.
25 шт. - упаковки контурные ячейковые (2) - пачки картонные.
25 шт. - упаковки контурные ячейковые (3) - пачки картонные.
25 шт. - упаковки контурные ячейковые (4) - пачки картонные.
25 шт. - упаковки контурные ячейковые (5) - пачки картонные.
25 шт. - упаковки контурные ячейковые (6) - пачки картонные.
30 шт. - упаковки контурные ячейковые (1) - пачки картонные.

30 шт. - упаковки контурные ячейковые (2) - пачки картонные.
30 шт. - упаковки контурные ячейковые (3) - пачки картонные.
30 шт. - упаковки контурные ячейковые (4) - пачки картонные.
30 шт. - упаковки контурные ячейковые (5) - пачки картонные.
30 шт. - упаковки контурные ячейковые (6) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- [Нейротропные средства](#)

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противоэпилептическое средство, производное пирролидона (S-энантиомер α -этил-2-оксо-1-пирролидин-ацетамида). По химической структуре отличается от известных противоэпилептических лекарственных средств. Механизм действия леветирацетама до конца не изучен, но очевидно, что он отличается от механизма действия известных противоэпилептических препаратов.

Исследования *in vitro* показали, что леветирацетам влияет на внутринейрональную концентрацию ионов Ca^{2+} , частично тормозя ток Ca^{2+} через каналы N-типа и снижая высвобождение кальция из внутринейрональных депо. Кроме того, леветирацетам частично восстанавливает токи через GABA- и глицин-зависимые каналы, сниженные цинком и β -карболинами.

Один из предполагаемых механизмов основан на доказанном связывании с гликопротеином синаптических везикул SV2A, содержащемся в сером веществе головного и спинного мозга. Считается, что таким образом реализуется противосудорожный эффект, который выражен в противодействии гиперсинхронизации нейронной активности. Не изменяет нормальную нейротрансмиссию, однако подавляет эпилептиформные нейрональные вспышки, индуцированные GABA-агонистом бикукулином, и возбуждение глутаматных рецепторов. Активность леветирацетама подтверждена в отношении как фокальных, так и генерализованных эпилептических припадков (эпилептиформные проявления/фотопароксизмальная реакция).

Фармакокинетика

После приема внутрь леветирацетам хорошо всасывается из ЖКТ. Абсорбция полная и носит линейный характер, поэтому концентрация в плазме крови может быть предсказана исходя из применяемой дозы препарата в мг/кг массы тела. Степень абсорбции не зависит от дозы и времени приема пищи. Биодоступность составляет около 100%.

После приема в дозе 1 г C_{max} в плазме крови достигается через 1.3 ч и составляет 31 мкг/мл, после повторного приема (2 раза/сут) – 43 мкг/мл.

Связывание с белками плазмы леветирацетама и его основного метаболита составляет менее 10%. V_d леветирацетама составляет около 0.5-0.7 л/кг. Равновесное состояние достигается через 2 сут при приеме 2 раза/сут.

Образование первичного фармакологически неактивного метаболита происходит без участия изоферментов цитохрома P450 в печени. Леветирацетам не влияет на ферментативную активность гепатоцитов.

У взрослых $T_{1/2}$ из плазмы крови составляет 7 ± 1 ч и не изменяется в зависимости от дозы, способа применения или повторного приема. Средняя величина клиренса составляет 0.96 мл/мин/кг. 95% дозы выводится почками. Почечный клиренс леветирацетама и его неактивного метаболита составляет 0.6 мл/мин/кг и 4.2 мл/мин/кг соответственно.

У пациентов пожилого возраста $T_{1/2}$ увеличивается на 40% и составляет 10-11 ч, что связано со снижением функции почек у этой категории больных. У пациентов с нарушением функции почек клиренс леветирацетама и его первичного метаболита коррелирует с КК. В терминальной стадии почечной недостаточности у взрослых пациентов $T_{1/2}$ составляет 25 ч в период между сеансами диализа и 3.1 ч во время диализа. В течение 4-часового сеанса диализа удаляется до 51% леветирацетама.

В процессе 4-часового диализа из организма удаляется 51% леветирацетама.

У пациентов с легкими и умеренными нарушениями функции печени значимых изменений клиренса леветирацетама не происходит. При тяжелых нарушениях функции печени при сопутствующей почечной недостаточности клиренс леветирацетама снижается более чем на 50%.

Фармакокинетика леветирацетама у детей носит линейный характер в диапазоне доз от 20 до 60 мг/кг/сут. C_{max} достигается через 0.5-1 ч. $T_{1/2}$ у детей после однократного приема внутрь в дозе 20 мг/кг массы тела составляет 5-6 ч. Общий клиренс леветирацетама у детей примерно на 40% выше, чем у взрослых и находится в прямой зависимости от массы тела.

Показания к применению:

В качестве монотерапии для лечения парциальных судорог с вторичной генерализацией или без нее у пациентов с 16 лет с впервые установленным диагнозом эпилепсия.

В качестве вспомогательной терапии: парциальные судороги с вторичной генерализацией или без нее у пациентов с эпилепсией с 4 лет (для в/в введения) или с 6 лет (для приема внутрь); миоклонические судороги у пациентов с ювенильной миоклонической эпилепсией с 12 лет; первично генерализованные тонико-клонические судороги у пациентов с идиопатической генерализованной эпилепсией у взрослых и подростков старше 12 лет.

Относится к болезням:

- [Судороги](#)
- [Эпилепсия](#)

Противопоказания:

Детский возраст до 4 лет (для инфузий), детский возраст до 6 лет (для приема внутрь) повышенная чувствительность к леветирацетаму, повышенная чувствительность к другим производным пирролидона.

Способ применения и дозы:

Для приема внутрь или в/в введения в виде инфузий.

В зависимости от показаний и возраста пациента разовая доза - 250-750 мг. Кратность применения - 2 раза/сут.

Переход от перорального к в/в применению и обратно может быть осуществлен с сохранением дозы и кратности введения.

При почечной недостаточности требуется коррекция дозы. Пациентам с нарушениями функции печени легкой и средней степени тяжести коррекция режима дозирования не требуется. У пациентов с нарушениями функции печени тяжелой степени значение КК может не отражать истинной степени нарушения функции почек, поэтому при КК<50 мл/мин рекомендуется уменьшение суточной дозы на 50%.

У детей леветирацетам следует применять в соответствующей лекарственной форме.

Побочное действие:

Со стороны системы кроветворения: нечасто - тромбоцитопения, лейкопения; редко - нейтропения, панцитопения.

Со стороны обмена веществ: часто - анорексия; нечасто - увеличение/снижение массы тела.

Со стороны ЦНС: очень часто - сонливость, головная боль; часто - перепады настроения, эмоциональная лабильность, депрессия, агрессивность, бессонница, нервозность; нечасто - расстройство поведения, озлобленность, тревога, галлюцинации, психотические расстройства, нарушение памяти, суицидальная попытка, навязчивые идеи, амнезия, расстройство тактильной чувствительности, головокружение, головная боль, гиперкинезия, тремор, нарушение равновесия, рассеянность, парестезии; редко - расстройство личности, в т.ч. нарушение мышления, суицид, гиперкинез, хореоатетоз.

Со стороны органов чувств: часто - головокружение; нечасто - диплопия, затуманивание зрения.

Со стороны дыхательной системы: часто - кашель.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота, рвота, диарея, боль в животе, диспепсия; нечасто - отклонения лабораторных показателей функции печени от нормы; редко - панкреатит, гепатит, печеночная недостаточность.

Со стороны кожи и подкожных тканей: часто - кожная сыпь; нечасто - экзема, кожный зуд; редко - алопеция (в некоторых случаях проходящая после отмены леветирацетама), токсический эпидермальный некролиз, многоформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона.

Со стороны костно-мышечной системы: нечасто - миалгия, мышечная слабость.

Прочие: часто - общая слабость, утомляемость; нечасто - назофарингит, случайная травматизация.

У детей наиболее часто: рвота, агитация, перепады настроения, агрессия, эмоциональная лабильность, расстройство

поведения, вялость.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых клинических исследований по безопасности применения леветирацетама у беременных женщин не проводилось, поэтому не следует применять леветирацетам при беременности, за исключением случаев крайней необходимости.

Физиологические изменения в организме женщины во время беременности могут влиять на концентрацию в плазме леветирацетама, также как и других противоэпилептических препаратов. При беременности отмечено снижение концентрации леветирацетама в плазме. Это снижение более выражено в I триместре (до 60% от базовой концентрации в период, предшествующий беременности).

Лечение леветирацетамом беременных следует проводить под особым контролем. Следует учитывать, что перерывы в проведении противоэпилептической терапии могут привести к ухудшению течения заболевания, что вредно для как для матери, так и для плода.

Леветирацетам выделяется с грудным молоком, поэтому грудное вскармливание в период лечения не рекомендуется. Однако, если лечение леветирацетамом необходимо в период лактации, то следует тщательно взвесить соотношение риск/польза лечения относительно важности грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Диагнозы

- Алкоголизм
- Аутизм
- Булимия
- Депрессия

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью следует применять у пациентов пожилого возраста (старше 65 лет), при заболеваниях печени в стадии декомпенсации, почечной недостаточности.

Сопутствующие противоэпилептические лекарственные препараты (в период перевода пациентов на прием леветирацетама) желательно отменять постепенно.

Пациентам с заболеваниями почек и декомпенсированными заболеваниями печени рекомендуется исследование функции почек перед началом лечения. В связи с имеющимися сообщениями о случаях суицида, суицидальных намерений и попыток суицида при лечении леветирацетамом следует предупреждать пациентов о необходимости немедленно сообщать лечащему врачу о появлении любых симптомов депрессии или суицидальных намерений.

Использование в педиатрии

Имеющиеся сведения о применении леветирацетама у детей не свидетельствуют о каком-либо его отрицательном влиянии на развитие и половое созревание. Однако отдаленные последствия лечения на способность детей к обучению, их интеллектуальное развитие, рост, функции эндокринных желез, половое развитие и фертильность остаются неизвестными.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В связи с различной индивидуальной чувствительностью к леветирацетаму со стороны ЦНС в период лечения пациентам следует воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Источник: <http://drugs.thead.ru/Epitropil>