

## [Эпитропил](#)



### **Код АТХ:**

- [N03AX14](#)

### **Международное непатентованное название (Действующее вещество):**

- [Леветирацетам](#)

### **Полезные ссылки:**

[Цена в Яндексе](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)

[Госреестр<sup>МНН</sup>](#) [Википедия<sup>МНН</sup>](#)

[PLC VIDAL](#) [Mail.Ru Drugs.com<sup>англ</sup>](#)

### **Форма выпуска:**

#### **Форма выпуска, описание и состав**

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

	<b>1 таб.</b>
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

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

Исследования *in vitro* показали, что леветирацетам влияет на внутринейрональную концентрацию ионов  $\text{Ca}^{2+}$ , частично тормозя ток  $\text{Ca}^{2+}$  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 эpileптиформные нейрональные вспышки, индуцированные GABA-агонистом бикубулином, и возбуждение глутаматных рецепторов. Активность леветирацетата подтверждена в отношении как фокальных, так и генерализованных эpileптических припадков (эpileптиформные 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%.  $V_d$  леветирацетата 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  $7 \pm 1$  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 введение 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 следуют 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, суициdalная попытка, навязчивые идеи, амнезия, расстройство тактильной чувствительности, головокружение, головная боль, гиперкинезия, трепор, нарушение равновесия, рассеянность, парестезии; редко - расстройство личности, в т.ч. нарушение мышления, суицид, гиперкинез, хореоатетоз.

*Со стороны органов чувств:* часто - головокружение; нечасто - дипlopия, 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, ажитация, 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 противоэpileптических 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 противоэpileптической терапии могут привести к ухудшению течения заболевания, что вредно 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 риска/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 противоэpileптические 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 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 fertильность 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>