Конвулекс (сироп)



Код АТХ:

- N03AG01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Вальпроевая кислота

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Сироп для детей бесцветный или слегка желтоватый, с фруктовым запахом.

	1 мл
вальпроат натрия	50 мг

Вспомогательные вещества: мальтитол жидкий (ликазин 80/55) - 800 мкг, метилпарагидроксибензоат - 1 мг, пропилпарагидроксибензоат - 400 мкг, натрия сахаринат - 1 мг, натрия цикламат - 3 мг, натрия хлорид - 400 мкг, ароматизатор малиновый 9/372710 - 400 мкг, ароматизатор персиковый 9/030307 - 1.25 мг, вода очищенная - до 1 мл.

100 мл - флаконы темного стекла (1) в комплекте с мерным шприцем - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противоэпилептический препарат. Механизм действия обусловлен ингибированием фермента GABA-трансферазы и

повышением содержания GABA в ЦНС. GABA препятствует пре- и постсинаптическим разрядам и тем самым предотвращает распространение судорожной активности в ЦНС. Кроме того, в механизме действия препарата существенная роль принадлежит воздействию вальпроевой кислоты на рецепторы $GABA_A$, а также влиянию на вольтаж-зависимые натриевые каналы. По другой гипотезе, вальпроевая кислота действует на участки постсинаптических рецепторов, имитируя или усиливая тормозящий эффект GABA. Возможное прямое влияние на активность мембран связано с изменениями проницаемости калия.

Улучшает психическое состояние и настроение больных, обладает антиаритмической активностью.

Фармакокинетика

Всасывание

Вальпроевая кислота быстро и почти полностью абсорбируется из ЖКТ, биодоступность при приеме внутрь составляет около 100%. Прием пищи не снижает скорость абсорбции. C_{max} в плазме отмечается через 3-4 ч. Терапевтическая концентрация вальпроевой кислоты в плазме крови составляет 50-100 мг/л.

Пролонгированная форма характеризуется медленной абсорбцией, более низкой (на 25%), но более стабильной концентрацией в плазме между 4 и 14 ч.

Распределение

C_{ss} достигается на 2-4 день лечения, в зависимости от интервалов между приемами доз.

При концентрации в плазме крови до 50 мг/л связывание вальпроевой кислоты с белками плазмы составляет 90-95%, при концентрации 50-100 мг/л - 80-85%.

Значения концентрации в спинномозговой жидкости коррелируют с величиной не связанной с белками фракции активного вещества. Вальпроевая кислота проникает через плацентарный барьер, выделяется с грудным молоком. Концентрация в грудном молоке составляет 1-10% концентрации в плазме крови матери.

Метаболизм

Вальпроевая кислота метаболизируется в печени путем окисления и конъюгации с глюкуроновой кислотой.

Выведение

Вальпроевая кислота (1-3% от дозы) и ее метаболиты выводятся почками, в небольших количествах - с калом и выдыхаемым воздухом. $T_{1/2}$ при монотерапии и у здоровых добровольцев составляет 8-20 ч.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

При уремии, гипопротеинемии и циррозе связывание вальпроевой кислоты с белками плазмы уменьшается.

При сочетании с другими лекарственными средствами $T_{1/2}$ может составлять 6-8 ч вследствие индукции метаболических ферментов. У пациентов с нарушениями функции печени и лиц пожилого возраста возможно значительное увеличение $T_{1/2}$.

У пациентов пожилого возраста вследствие уменьшения связывания активного вещества с сывороточным альбумином возможно повышение содержания в плазме несвязанного препарата.

Показания к применению:

— эпилепсия любого генеза;

— эпилептические припадки (в т.ч. генерализованные и парциальные, а также на фоне органических заболеваний мозга);

— расстройства поведения, связанные с эпилепсией;

— фебрильные судороги у детей;

— маниакально-депрессивный синдром с биполярным течением, не поддающийся лечению препаратами лития или другими лекарственными средствами.

Относится к болезням:

- Депрессия
- Судороги

- Эпилепсия

Противопоказания:

— тяжелые нарушения функции печени;

— тяжелые нарушения функции поджелудочной железы;

— порфирия;

— геморрагический диатез;

— выраженная тромбоцитопения;

— I триместр беременности;

— лактация (грудное вскармливание);

— повышенная чувствительность к вальпроевой кислоте.

С *особой осторожностью* следует назначать препарат при указаниях в анамнезе на заболевания печени и поджелудочной железы, поражения костного мозга; при нарушениях функции почек; пациентам с врожденными энзимопатиями; умственно отсталым детям; при органических поражениях мозга; при гипопротеинемии.

Способ применения и дозы:

Детям с массой тела более 25 кг назначают в начальной дозе 300 мг/сут с постепенным повышением до достижения клинического эффекта (исчезновения припадков), при этом доза, как правило, составляет 20-30 мг/кг/сут.

Начальная доза при монотерапии - 5-15 мг/кг/сут, затем дозу постепенно повышают на 5-10 мг/кг в неделю.

Максимальная доза составляет 30 мг/кг/сут (может быть увеличена до 60 мг/кг/сут под контролем концентрации вальпроевой кислоты в плазме крови).

Для **детей с массой тела 7.5-25 кг** при монотерапии средняя доза составляет 15-45 мг/кг/сут, максимальная - 50 мг/кг/сут. При комбинированной терапии - 30-100 мг/кг/сут.

Средние дозы Конвулекса представлены в таблице.

Масса тела пациента (кг)	Доза (мг/сут)	Кол-во сиропа (мл)
7.5-14	150-450	3-9
14-21	300-600	6-12
21-32	600-900	12-18
32-50	900-1500	-
50-90	1500-2500	-

Пациентам с почечной недостаточностью может потребоваться уменьшение дозы препарата. Дозу устанавливают мониторируя клиническое состояние пациента, т.к. значения концентрации вальпроевой кислоты в плазме крови могут оказаться недостаточно информативными.

Суточную дозу препарата распределяют на 2-3 приема. Препарат принимают независимо от приема пищи.

Сироп принимают с небольшим количеством жидкости.

Побочное действие:

Развитие побочных эффектов возможно главным образом при концентрации препарата в плазме крови более 100 мг/кг или при комбинированной терапии.

Со стороны пищеварительной системы: возможны тошнота, рвота, гастралгия, анорексия или повышение аппетита, диарея, гепатит; редко - запор, панкреатит, вплоть до тяжелых поражений с летальным исходом (в первые 6 мес лечения, чаще на 2-12 нед.).

Со стороны ЦНС: возможен тремор, диплопия, нистагм, мелькание "мушек" перед глазами; редко - изменения поведения, настроения или психического состояния (депрессия, чувство усталости, галлюцинации, агрессивность, гиперактивное состояние, психозы, необычное возбуждение, двигательное беспокойство или раздражительность), атаксия, головокружение, сонливость, головная боль, дизартрия, ступор, нарушение сознания, кома.

Со стороны системы кроветворения: возможны анемия, лейкопения, тромбоцитопения, снижение содержания фибриногена, агрегации тромбоцитов и свертываемости крови, сопровождающееся удлинением времени кровотечения, петехиальными кровоизлияниями, кровоподтеками, гематомами, кровоточивостью.

Со стороны обмена веществ: возможно уменьшение или увеличение массы тела.

Со стороны эндокринной системы: возможны дисменорея, вторичная аменорея, увеличение молочных желез, галакторея.

Со стороны лабораторных показателей: гиперкреатининемия, гипераммониемия, гипербилирубинемия, незначительное повышение активности печеночных трансаминаз, ЛДГ (дозозависимое).

Аллергические реакции: возможны кожная сыпь, крапивница, ангионевротический отек, фотосенсибилизация, синдром Стивенса-Джонсона.

Прочие: отеки, выпадение волос (как правило, восстанавливается после отмены препарата).

Побочные эффекты возможны в основном при уровне вальпроевой кислоты в плазме крови выше 100 мг/л или при сочетанной терапии.

Передозировка:

Симптомы: тошнота, рвота, головокружение, диарея, нарушение функции дыхания, мышечная гипотония, гипорефлексия, миоз, кома.

Лечение: промывание желудка (не позже 10-12 ч) с последующим назначением активированного угля, гемодиализ. Форсированный диурез, поддержание функции дыхания и сердечно-сосудистой системы.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Конвулекс противопоказан к применению в I триместре беременности.

При наступившей беременности в связи с риском ухудшения состояния лечение прерывать не следует. Конвулекс следует применять в наименьших эффективных дозах, избегать сочетания с другими противосудорожными средствами и регулярно контролировать уровень вальпроевой кислоты в плазме.

При необходимости применения Конвулекса в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Женщины детородного возраста в период лечения должны применять надежные методы контрацепции.

В *экспериментальных исследованиях* установлено тератогенное действие препарата.

Частота развития дефектов нервной трубки у детей, рожденных женщинами, принимавшими вальпроат в I триместре беременности, составляет 1-2%. В связи с этим при беременности целесообразно применение препаратов фолиевой кислоты.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Фармакодинамическое взаимодействие

При одновременном применении вальпроевой кислоты с препаратами, оказывающими угнетающее влияние на ЦНС (в т.ч. трициклическими антидепрессантами, ингибиторами МАО и антипсихотическими средствами), а также с этанолом возможно усиление депрессии ЦНС.

Гепатотоксические средства (в т.ч. этанол) повышают вероятность развития поражений печени.

Препараты, снижающие порог судорожной готовности (в т.ч. трициклические антидепрессанты, ингибиторы МАО, антипсихотические средства), уменьшают эффективность вальпроевой кислоты.

Конвулекс усиливает эффекты (в т.ч. побочные) других противосудорожных средств (фенитоин, ламотриджин), антидепрессантов, антипсихотических средств, транквилизаторов, барбитуратов, ингибиторов МАО, тимолептиков,

этанола. При применении вальпроата у пациентов, получающих клоназепам, в единичных случаях наблюдалось усиление выраженности абсансного статуса.

Фармакокинетическое взаимодействие

При одновременном применении вальпроевой кислоты с барбитуратами или с примидоном отмечается повышение их концентраций в плазме крови. Вследствие ингибирования под влиянием вальпроевой кислоты ферментов печени и замедления метаболизма ламотриджина происходит увеличение его $T_{1/2}$ до 70 ч у взрослых и до 45-55 ч - у детей.

Вальпроевая кислота снижает клиренс зидовудина на 38%, при этом его $T_{1/2}$ не изменяется.

При одновременном применении с салицилатами наблюдается усиление эффектов вальпроевой кислоты вследствие вытеснения ее из связи с белками плазмы. Конвулекс усиливает эффекты антиагрегантов (ацетилсалициловая кислота) и непрямых антикоагулянтов.

При сочетании с фенобарбиталом, фенитоином, карбамазепином, мефлохином снижается содержание вальпроевой кислоты в сыворотке крови (ускорение метаболизма).

Фелбамат повышает концентрацию вальпроевой кислоты в плазме крови на 35-50% (необходима коррекция дозы).

Вальпроевая кислота не вызывает индукции печеночных ферментов и не снижает эффективности пероральных контрацептивов.

Особые указания и меры предосторожности:

Пациентам, которые получают другие противоэпилептические средства, перевод на прием Конвулекса следует проводить постепенно, достигая клинически эффективной дозы через 2 нед, после этого возможна постепенная отмена других противоэпилептических средств. У пациентов, не получавших лечение другими противоэпилептическими средствами, клинически эффективная доза должна быть достигнута через 1 неделю терапии.

При проведении комбинированной противосудорожной терапии повышается риск развития побочных эффектов со стороны печени.

У пациентов, получающих Конвулекс, перед хирургическим вмешательством необходим общий анализ крови (в т.ч. количества тромбоцитов), определение времени кровотечения, показателей коагулограммы.

При возникновении на фоне лечения симптомокомплекса "острый живот" до начала оперативного вмешательства рекомендуется определить уровень амилазы в крови для исключения острого панкреатита.

Следует учитывать, что на фоне лечения возможно искажение результатов анализов мочи при сахарном диабете (вследствие повышения содержания кетопродуктов), показателей функции щитовидной железы.

Для уменьшения риска развития диспептических явлений возможен прием спазмолитиков и обволакивающих средств.

Пациент должен быть предупрежден о необходимости проконсультироваться с врачом о целесообразности продолжения или прекращения лечения при развитии любых острых серьезных побочных эффектов.

Резкое прекращение приема Конвулекса может привести к учащению судорожных припадков.

В период применения препарата следует избегать употребления алкоголя.

Контроль лабораторных показателей

Перед началом терапии и в период применения препарата необходимо регулярно контролировать функцию печени (активность печеночных трансаминаз, содержание билирубина), картину периферической крови, состояние системы свертывания крови, активность амилазы (каждые 3 мес, особенно при комбинации с другими противоэпилептическими средствами).

Использование в педиатрии

При применении препарата у детей повышается риск развития побочных эффектов со стороны печени.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Больным, принимающим Конвулекс, следует воздерживаться от занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Пациентам с почечной недостаточностью может потребоваться уменьшение дозы препарата. Дозу устанавливают мониторируя клиническое состояние пациента, т.к. значения концентрации вальпроевой кислоты в плазме крови могут оказаться недостаточно информативными.

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелых нарушениях функции печени. С *особой осторожностью* следует назначать препарат при указаниях в анамнезе на заболевания печени.

Применение в детском возрасте

Противопоказание: детский возраст до 3 лет (для таблеток с пролонгированным действием).

Условия хранения:

Список Б. Следует хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре от 15° до 25°С..

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Konvuleks_sirop