

[Леветирацетам Канон](#)



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Леветирацетам](#)

Полезные ссылки:

[Цена в Яндексе](#) [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 синего цвета, овальные, двояковыпуклые, с риской; на поперечном разрезе - почти белого цвета.

	1 таб.
леветирацетам	1000 мг

Вспомогательные вещества: кремния диоксид коллоидный 12 мг, кроскармеллоза натрия 40 мг, кальция стеарат 12 мг, маннитол 80.8 мг, повидон 25.2 мг, целлюлоза микрокристаллическая 70 мг.

Состав пленочной оболочки: Опадрай II синий 20 мг, в том числе: поливиниловый спирт 16 мг, макрогол 8.08 мг, тальк 5.92 мг, титана диоксид 8.2 мг, алюминиевый лак на основе красителя индигокармин 1.72 мг, алюминиевый лак на основе красителя красный очаровательный 0.08 мг.

10 шт. - блистеры из ПВХ/алюминиевой фольги (1) - пачки картонные.

10 шт. - блистеры из ПВХ/алюминиевой фольги (3) - пачки картонные.

10 шт. - блистеры из ПВХ/алюминиевой фольги (6) - пачки картонные.

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 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 бикубулином, и возбуждение глютаматных рецепторов. Активность леветирацетата 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 леветирацетами 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 ± 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. Почекный клиренс леветирацетата 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 леветирацетата 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% леветирацетата.

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

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

Фармакокинетика леветирацетата 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 леветирацетата 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 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, 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 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 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 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 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/Levetiracetam_Kanon