Топирамат



Код АТХ:

- N03AX11

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Топирамат

Полезные ссылки:

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противоэпилептическое средство, относится к классу сульфат-замещенных моносахаридов.

Топирамат уменьшает частоту возникновения потенциалов действия, характерных для нейрона в состоянии стойкой деполяризации, что свидетельствует о зависимости блокирующего действия препарата на натриевые каналы от состояния нейрона. Топирамат потенцирует активность GABA в отношении некоторых подтипов GABA-рецепторов (в т.ч. $GABA_A$-рецепторов), а также модулирует активность самих $GABA_A$-рецепторов, препятствует активации каинатом чувствительности каинат/АМПК-рецепторов к глутамату, не влияет на активность N-метил-D-аспартата в отношении NMDA-рецепторов. Эти эффекты топирамата являются дозозависимыми при концентрации топирамата в плазме от 1 мкМ до 200 мкМ, с минимальной активностью в пределах от 1 мкМ до 10 мкМ.

Кроме того, топирамат угнетает активность некоторых изоферментов карбоангидразы, однако этот эффект у топирамата более слабый, чем у ацетазоламида и, по-видимому, не является главным в противоэпилептической активности топирамата.

Показания к применению:

Парциальные или генерализованные тонико-клонические припадки у взрослых и детей (в качестве монотерапии или в комбинации с другими противосудорожными средствами); припадки, связанные с синдромом Леннокса-Гасто, у взрослых и детей (в качестве средства дополнительной терапии).

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к топирамату.

Способ применения и дозы:

Индивидуальный, в зависимости от показаний, возраста пациента, функции почек и эффективности проводимой терапии.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: часто (особенно в период подбора дозы) - атаксия, нарушение концентрации внимания, спутанность сознания, головокружение, чувство усталости, парестезии, сонливость, нарушение мышления; редко - возбуждение, амнезия, анорексия, афазия, депрессия, эмоциональная лабильность, нарушения речи, диплопия, нистагм, нарушение зрения, извращение вкуса.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота; в отдельных случаях - повышение показателей функциональных печеночных проб (у пациентов, принимавших топирамат в комбинации с другими лекарственными препаратами или в качестве монотерапии), гепатит, печеночная недостаточность (при применении топирамата одновременно с проведением массивной лекарственной терапии).

Прочие: нефролитиаз, уменьшение массы тела.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых клинических исследований безопасности применения топирамата при беременности не проводилось. Применение топирамата при беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Выведение топирамата с грудным молоком не изучалось в ходе контролируемых исследований. Ограниченное число наблюдений позволяет предположить, что топирамат выделяется с грудным молоком. При необходимости применения в период лактации следует решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с топираматом фенитоин и карбамазепин снижают его концентрацию в плазме крови. Это связано с индукцией под влиянием фенитоина и карбамазепина ферментов, при участии которых осуществляется метаболизм топирамата. В отдельных случаях при применении топирамата наблюдалось повышение концентрации фенитоина в плазме крови.

При одновременном применении однократной дозы топирамата и дигоксина возможно уменьшение AUC дигоксина.

При одновременном применении перорального контрацептива, содержащего норэтиндрон и этинилэстрадиол, топирамат не оказывал существенного влияния на клиренс норэтиндрона, однако плазменный клиренс этинилэстрадиола значительно возрастал. Таким образом, при одновременном приеме топирамата с пероральными контрацептивами их эффективность может быть снижена.

При одновременном приеме метформина и топирамата средние значения C_{max} и $AUC_{0\text{-}12ч}$ метформина повышаются соответственно на 18% и 25%, тогда как среднее значение клиренса уменьшается на 20%, при этом плазменный клиренс топирамата уменьшается. Клиническая значимость этого взаимодействия неясна.

У пациентов, принимающих метформин, при необходимости применения или отмены топирамата следует регулярно контролировать уровень глюкозы в организме.

При одновременном применении топирамата с препаратами, предрасполагающими к развитию нефролитиаза, возможно повышение риска образования камней в почках.

Особые указания и меры предосторожности:

Отменять топирамат следует постепенно, чтобы свести к минимуму возможность повышения частоты судорожных припадков. При проведении клинических испытаний дозу препарата уменьшали на 100 мг 1 раз в неделю.

Для уменьшения риска развития нефролитиаза в период лечения следует увеличить объем потребляемой жидкости.

Если на фоне лечения уменьшается масса тела, следует скорректировать режим питания.

С осторожностью применять у пациентов с нарушениями функции печени из-за возможного снижения клиренса топирамата.

В период лечения следует избегать употребления алкоголя.

Не рекомендуется одновременное применение других препаратов, оказывающих угнетающее действие на ЦНС.

Не применять у детей в возрасте до 2 лет.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

С осторожностью следует применять у пациентов, занимающихся потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций, т.к. топирамат может вызвать сонливость, головокружение.

При нарушениях функции печени

С осторожностью применять у пациентов с нарушениями функции печени из-за возможного снижения клиренса топирамата.

Применение в детском возрасте

Не применять у детей в возрасте до 2 лет.

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