Топирамат Сандоз



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой белого цвета, круглые, плоскоцилиндрической формы.

	1 таб.
топирамат	100 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 74.85 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 20 мг, крахмал прежелатинизированный - 30 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) - 12.75 мг, магния стеарат - 2.4 мг.

Состав оболочки: опадрай белый 13В58802 - 7.2 мг (гипромеллоза 6 СР - 59.75% (4.302 мг), титана диоксид - 31.25% (2.25 мг), макрогол - 8% (0.576 мг), полисорбат 80 - 1% (0.072 мг)).

10 шт. - блистеры Ал/Ал (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры Ал/Ал (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры Ал/Ал (3) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры Ал/Ал (6) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры Ал/Ал (10) - пачки картонные.

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.

Фармакокинетика

После приема внутрь топирамат всасывается быстро и эффективно. Биодоступность - 81%. Прием пищи не оказывает клинически значимого действия на биодоступность топирамата. Связывание с белками плазмы составляет 13-17%.

После однократного приема в дозах до 1.2 г средний V_d составляет 0.55-0.8 л/кг. Величина V_d зависит от пола: у женщин он составляет примерно 50% от значений, наблюдаемых у мужчин, что связывают с более высоким содержанием жировой ткани в организме женщин. Фармакокинетика топирамата носит линейный характер. Плазменный клиренс остается постоянным, при этом AUC в диапазоне доз от 100 до 400 мг возрастает пропорционально дозе. C_{ss} в плазме достигается через 4-8 дней. После многократного приема внутрь в дозе 100 мг 2 раза/сут C_{max} в среднем составляет 6.76 мкг/мл. После приема внутрь метаболизируется около 20% от принятой дозы. В плазме, моче и кале человека идентифицировано 6 практически неактивных метаболитов. Выводится в основном почками в неизмененном виде (70%) и в виде метаболитов. Плазменный клиренс составляет 20-30 мл/мин. После многократного приема в дозах по 50 мг и 100 мг 2 раза/сут $T_{1/2}$ топирамата из плазмы в среднем составляет 21 ч.

Показания к применению:

Эпилепсия: в качестве средства монотерапии для начального лечения у пациентов старше 2 лет - парциальные или первичные генерализованные тонико-клонические припадки; в составе комплексной терапии у пациентов старше 2 лет - парциальные или генерализованные тонико-клонические припадки, а также припадки на фоне синдрома Леннокса-Гасто.

Мигрень: профилактика приступов мигрени у взрослых.

Относится к болезням:

- Мигрень

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 нервной системы: парестезии, сонливость, головокружение, нарушение внимания, нарушение памяти, амнезия, психомоторные нарушения, судороги, неправильная координация, тремор, летаргия, гипестезия, нистагм, дисгевзия, нарушение равновесия, расстройство артикуляции, интенционное дрожание (динамическое), седативный эффект, угнетение сознания, судороги по типу больших судорожных припадков, дефект поля зрения, сложные парциальные припадки, расстройство речи, психомоторная гиперактивность, обморок, сенсорные нарушения, слюнотечение, афазия, повторяющиеся речь, гипокинезия, дискинезия, постуральное головокружение, плохое качество сна, чувство жжения, потеря чувствительности, паросмия, мозжечковый синдром, дизестезия, гипогевзия, ступор, неуклюжесть, аура, агевзия, дисграфия, дисфазия, периферическая невропатия, предобморочные состояния, дистония, апраксия, нарушение циркадного ритма сна, гиперестезия, гипосмия, аносмия, эссенциальный тремор, акинезия, отсутствие реакции на стимулы, затруднения при обучении.

Нарушения психики: депрессия, замедленное мышление, когнитивные расстройства, бессонница, выраженные нарушения речи, беспокойство, спутанность сознания, дезориентация, агрессия, лабильность настроения, тревожное возбуждение, эмоциональная лабильность, депрессивное настроение, гнев, неадекватное поведение, суицидальные идеи или попытки, слуховые и зрительные галлюцинации, психотическое расстройство, апатия, отсутствие спонтанной речи, нарушения сна, аффективная лабильность, снижение либидо, беспокойство, плаксивость, дисфемия, эйфория, параноидальные состояния, персеверация мышления, паническая атака, слезливость, нарушение навыков чтения, уплощение эмоций, расстройство засыпания, патологическое мышление, потеря либидо, вялость, интрасомническое расстройство, патологически повышенная отвлекаемость, ранние пробуждения по утрам, паническая реакция, мания, паническое расстройство, чувство отчаяния, гипоманиакальное состояние.

Со стороны органа зрения: нечеткость зрения, диплопия, нарушение зрения, уменьшение остроты зрения, скотома, миопия, патологические ощущения в глазах, сухость глаз, фотофобия, блефароспазм, повышенное слезотечение, фотопсия, мидриаз, пресбиопия, односторонняя слепота, преходящая слепота, глаукома, нарушение аккомодации, нарушение зрительного восприятия глубины, мерцательная скотома, отек век, ночная слепота, амблиопия, закрытоугольная глаукома, макулопатия, глазодвигательные нарушения.

Со стороны системы кроветворения: анемия, лейкопения, тромбоцитопения, лимфаденопатия, эозинофилия, нейтропения.

Со стороны иммунной системы: повышенная чувствительность, аллергический отек, отек конъюнктивы.

Со стороны обмена веществ: анорексия, снижение аппетита, метаболический ацидоз, гипокалиемия, повышение аппетита, полидипсия, ацидоз гиперхлоремический.

Со стороны органа слуха и равновесия: вертиго, звон в ушах, боль в ухе, глухота, односторонняя глухота, нейросенсорная глухота, дискомфорт в ушах, нарушение слуха.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: брадикардия, синусовая брадикардия, учащенное сердцебиение, ортостатическая гипотензия, приливы крови, гиперемия, феномен Рейно.

Со стороны дыхательной системы: назофарингит, диспноэ, носовое кровотечение, заложенность носа, ринорея, кашель, одышка при физической нагрузке, гиперсекреция в околоносовых пазухах, дисфония.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, диарея, рвота, запор, боль в верхней части живота, диспепсия, боль в животе, сухость во рту, дискомфорт в желудке, оральная парестезия, гастрит, неприятные ощущения в животе, панкреатит, метеоризм, гастроэзофагеальная рефлюксная болезнь, боль в нижней части живота, оральная гипестезия, кровоточивость десен, вздутие живота, дискомфорт в эпигастральной области, болезненность по всему животу, гиперсекреция слюнных желез, боль в ротовой полости, неприятный запах изо рта, глоссодиния, гепатит, печеночная недостаточность.

Со стороны кожи и подкожных тканей: алопеция, зуд, сыпь, ангидроз, гипестезия лица, крапивница, эритема, генерализованный зуд, макулезная сыпь, изменение цвета кожи, аллергический дерматит, отек лица, синдром Стивенса-Джонсона, многоформная эритема, неприятный запах кожи, периорбитальный отек, крапивница локализованная, токсический эпидермальный некролиз.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, мышечные спазмы, миалгия, мышечные судороги, мышечная слабость, мышечные боли в груди, отечность суставов, скованность мышц, боль в боку, мышечное утомление, дискомфорт в конечностях.

Со стороны мочевыделительной системы: нефролитиаз, поллакиурия, дизурия, мочевые конкременты, недержание мочи при напряжении, гематурия, неотложный болезненный позыв к мочеиспусканию, почечная колика, боли в области почек, конкременты мочеточника, почечный канальцевый ацидоз.

Со стороны репродуктивной системы: эректильная дисфункция, сексуальная дисфункция.

Общие реакции: усталость, пирексия, астения, раздражительность, нарушение походки, необычные ощущения, недомогание, гипертермия, жажда, гриппоподобное состояние, инерционность, похолодание конечностей, чувство опьянения, ощущение тревоги, отек лица, кальциноз.

Со стороны лабораторных показателей: уменьшение массы тела, увеличение массы тела, кристаллурия, аномальный тест тандем-походка, лейкопения, повышение активности печеночных ферментов, гипокалиемия, уменьшение содержания гидрокарбонатов в крови.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Диагнозы

- Алкоголизм
- Аутизм
- Булимия
- Депрессия

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.

У пациентов, принимающих метформин, пиоглитазон, глибенкламид при одновременном применении или отмене топирамата возможны колебания уровня глюкозы в плазме. При данных комбинациях следует контролировать уровень глюкозы в плазме.

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

Особые указания и меры предосторожности:

Применение топирамата для лечения острых приступов мигрени не изучено.

С осторожностью следует применять при почечной и печеночной недостаточности, нефроуролитиазе (в т.ч. в личном и семейном анамнезе), гиперкальциурии.

Пациентам с нарушениями функции почек и пациентам, находящимся на гемодиализе требуется коррекция режима дозирования топирамата.

Отменять топирамат следует постепенно, чтобы свести к минимуму возможность повышения частоты судорожных припадков. В клинических исследованиях у взрослых при лечении эпилепсии дозы уменьшали на 50-100 мг с интервалом 1 нед. и на 25-50 мг у взрослых, получающих топирамат в дозе 100 мг/сут для профилактики мигрени. У детей в клинических исследованиях топирамат постепенно отменяли в течение 2-8 нед. Если по медицинским показаниям необходима быстрая отмена топирамата, то рекомендуется контролировать состояние пациента.

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

На фоне применения топирамата возможны уменьшение потоотделения и гипертермия, особенно у детей младшего возраста, в условиях повышенной температуры окружающей среды. Достаточное восполнение потери жидкости до и во время такой деятельности, как физические упражнения или пребывание в условиях высоких температур, может сократить риск обусловленных перегреванием осложнений.

В период лечения необходимо контролировать состояние пациентов с целью выявления признаков суицидальной идеализации и назначать соответствующее лечение. Необходимо рекомендовать пациентам (и при необходимости лицам, ухаживающим за пациентами) сразу же обращаться за медицинской помощью в случае появления признаков суицидальной идеализации или суицидального поведения.

При возникновении нарушений со стороны органа зрения, в т.ч. синдрома, включающего миопию, связанную с закрытоугольной глаукомой, следует отменить топирамат, как только лечащий врач сочтет это возможным. При необходимости, следует принять меры, направленные на понижение внутриглазного давления.

Во избежание возникновения метаболического ацидоза, в период лечения топираматом рекомендуется проводить необходимые исследования, включая определение концентрации гидрокарбонатов в сыворотке. При возникновении метаболического ацидоза и его персистировании, рекомендуется снизить дозу или прекратить прием топирамата. У детей хронический метаболический ацидоз может приводить к замедлению роста. Эффект топирамата на рост и возможные осложнения, связанные с костной системой, не изучались систематически у детей и у взрослых.

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

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

В период лечения пациент должен избегать употребления алкоголя.

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, нарушения зрения.

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