Инструкция по применению
Суксимид Капсулы 250 мг 100 шт

Характеристики



Форма выпуска: Капсулы
Страна: Россия
Производитель: МОСКОВСКАЯ ФФ
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Этосуксимид
Количество в упаковке: 1

Описание

Твердые желатиновые капсулы № 0, корпус и крышечка белого цвета. Содержимое капсул - затвердевшая масса белого цвета.

Действующее вещество

Этосуксимид

Состав

Состав на 1 капсулу Действующее вещество: этосуксимид - 250 мг Вспомогательное вещество: макрогол 400 (полиэтиленгликоль 400) - 25 мг Масса содержимого капсулы: - 275 мг Состав оболочки капсулы (корпус и крышечка): титана диоксид (Е 171), желатин.

Форма выпуска

Капсулы

Фармакокинетика

Всасывание После приема внутрь этосуксимид всасывается практически полностью. У взрослых после приема этосуксимида в однократной дозе 1 г максимальная концентрация в плазме крови (Cmax) определялась через 2-4 часа и составляла 18-24 мкг/мл. У детей в возрасте от 7 до 8,5 лет при массе тела 12,9-24,4 кг после приема этосуксимида в однократной дозе 500 мг (Cmax) максимальная концентрация в плазме крови достигалась через 3-7 часов и составляла 28-50,9 мкг/мл. Между дозой и повышением концентрации в плазме крови существует линейная зависимость, у взрослых при повышении пероральной дозы на I мг/кг/сут предполагается повышение концентрации в плазме крови на 2-3 мкг/мл, у детей - на 1-2 мкг/мл. Поэтому детям младшего возраста требуются несколько более высокие дозы, чем детям старшего возраста. Терапевтические концентрации этосуксимида в плазме крови находятся в диапазоне от 40 до 100 мкг/мл. При концентрациях в плазме крови более 150 мкг/мл возможно развитие токсических эффектов. Распределение У детей при длительном применении этосуксимида в дозе 20 мг/кг концентрация в плазме крови возрастала почти до 50 мкг/мл. У взрослых эта концентрация достигалась при приеме этосуксимида в дозе 15 мг/кг. Равновесное состояние, как ожидается, наступает через 8-10 дней после начала терапии. Имеются значительные межиндивидуальные различия концентраций в плазме крови при применении этосуксимида в одних и тех же дозах в виде пероральных лекарственных форм. этосуксимид незначительно связывается с белками плазмы крови. Этосуксимид обнаруживается в ликворе и в слюне в таких же концентрациях, как в плазме крови. Кажущийся объем распределения составляет 0,7 л/кг. Этосуксимид проникает через плацентарный барьер, выделяется с грудным молоком (соотношение концентраций этосуксимида в плазме крови и в грудном молоке составляет 0,94 ±0,06). Метаболизм Этосуксимид подвергается выраженному окислительному метаболизму в печени. Образуется несколько, по-видимому, фармакологически неактивных метаболитов. Основными образовавшимися метаболитами являются 2 диастереомера: 2-(1-гидроксиэтил)-2-метил-сукцинимид и 2-этил-2-метил-3-гидроксисукцинимид. Выведение У взрослых после приема этосуксимида внутрь в однократной дозе 13,1-18 мг/кг период полувыведения (T1/2) из плазмы крови составлял 38,3-66,6 ч. У детей после приема внутрь этосуксимида в однократной дозе 500 мг T1/2 из плазмы составлял 25,7-35,9 ч. Фармакологически неактивные метаболиты выводятся почками, частично в виде конъюгатов с глюкуроновой кислотой. В неизменном виде почками выводится 10-20%.

Показания

Приступы пикнолептических абсансов, а также сложные и атипичные судорожные припадки. Миоклонико-астатические малые припадки (petit mal). Юношеские миоклонические припадки (импульсивные малые припадки).

Способ применения и дозы

Разовые и суточные дозы Доза этосуксимида зависит от клинической картины заболевания, индивидуальной реакции пациента на лечение и переносимости. Лечение начинают с небольших начальных доз. Дозы постепенно повышают. И у детей и у взрослых лечение начинают с общей суточной дозы этосуксимида, находящейся в диапазоне от 5 до 10 мг/кг массы тела. Общая суточная доза этосуксимида может повышаться на 5 мг/кг с интервалами от 4 до 7 дней (либо в зависимости от достижения равновесного состояния: 8-10 дней). Для поддерживающей терапии обычно достаточно суточной дозы этосуксимида из расчета 20 мг/кг у детей и 15 мг/кг у взрослых. Не следует превышать максимальную суточную дозу этосуксимида 40 мг/кг массы тела у детей и 30 мг/кг - у взрослых. Суточную дозу принимают в 2-3 приема. В связи с длительным периодом полувыведения этосуксимида при хорошей его переносимости всю суточную дозу можно принимать одномоментно. Терапевтическая концентрация этосуксимида в плазме крови составляет 40-100 мкг/мл. Примеры расчета суточной дозы для взрослых и детей старше 12 лет при поддерживающей дозе этосуксимида 15 мг/кг приведены в Таблице 1. Таблица 1 Масса тела Средняя суточная доза, мг (капс.) Максимальная суточная доза, мг (капс.) 50 кг 750 (3) 1500 (6) 67 кг 1000 (4) 2000 (8) 83 кг 1250 (5) 2500 (10) Примеры расчета суточной дозы для детей в возрасте до 12 лет при поддерживающей дозе этосуксимида 20 мг/кг приведены в Таблице 2. Таблица 2 Масса тела Средняя суточная доза, мг (капе.) Максимальная суточная доза, мг (капе.) 13 кг 250 (1) 500 (2) 25 кг 500 (2) 1000 (4) 38 кг 750 (3) 1500 (6) 50 кг 1000 (4) 2000 (8) Примечание: этосуксимид подвергается диализу. Поэтому у пациентов, находящихся на гемодиализе, требуется дополнительная доза или изменение режима дозирования. 39-52 % от введенной дозы удаляется в течение 4-часового периода гемодиализа. Способ применения Капсулы следует проглатывать целиком с достаточным количеством жидкости (например, стакан воды) во время или после приема пиши. В основном противоэпилептическая терапия проводится длительно. Вопрос о коррекции, продолжительности и отмене терапии этосуксимидом должен решать специалист с опытом лечения эпилепсии. Уменьшение дозы этосуксимида, а также уменьшение дозы с последующей отменой препарата не следует предпринимать до тех пор, пока период, в течение которого не возникают судороги, не составит 2 или 3 года. Уменьшение дозы с целью отмены препарата должно быть проведено в

несколько этапов в течение периода от 1 до 2 лет. Для детей допускается "вырастать" из своей дозы (доза остается постоянной, в то время как масса тела увеличивается). Однако не должно отмечаться ухудшения показателей электроэнцефалограммы. Особые группы пациентов Пожилые пациенты Нет определенных рекомендаций по дозированию для пожилых пациентов, однако, как и для любого лекарственного средства, рекомендуется использовать наименьшую эффективную дозу. Пациенты с печеночной и/или почечной недостаточностью Этосуксимид следует назначать с особой осторожностью пациентам с диагностированными заболеваниями печени или почек. Нет определенных рекомендаций по дозированию для пациентов с печеночной или почечной недостаточностью, однако, как и для любого лекарственного средства, рекомендуется использовать наименьшую эффективную дозу. Всем пациентам, получающим препарат, рекомендуется периодический контроль анализа мочи и функции печени. Пациенты на гемодиализе Этосуксимид может выводиться из крови при гемодиализе. В течение 4-часового сеанса гемодиализа из организма выводится 39-52% принятой дозы. Поэтому у пациентов, находящихся на гемодиализе, требуется дополнительная доза или изменение режима дозирования. Дети от 6 лет и старше: Начальная доза, схема наращивания дозы и режим дозирования у взрослых и детей от 6 лет и старше совпадают. Для детей допускается "вырастать" из своей дозы (доза остается постоянной, в то время как масса тела увеличивается). Однако не должно отмечаться ухудшения показателей энцефалограммы.

Противопоказания

Гиперчувствительность к этосуксимиду, сукцинимидам в анамнезе или к любому из вспомогательных веществ препарата. Детский возраст до 6 лет (в связи с невозможностью точного дозирования данной лекарственной формы).

Применение при беременности и кормлении грудью

Беременность Специфическая эмбриопатия у детей, матери которых получали этосуксимид в качестве монотерапии, не выявлена. На фоне применения противоэпилептических средств повышается риск пороков развития. При комбинированной терапии этот риск выше, поэтому при беременности рекомендуется проведение монотерапии. Следует назначать минимальную эффективную дозу, контролирующую приступы, особенно между 20 и 40 днями беременности. Необходимо регулярно определять концентрацию этосуксимида в сыворотке крови матери. В последнем триместре беременности женщина должна принимать препарат витамина К1. Это предотвращает развитие у новорожденного дефицита витамина К, который может привести к кровотечениям. Следует предупредить пациентку о необходимости немедленного обращения к врачу при наступлении беременности на фоне терапии. Грудное вскармливание На фоне лечения этосуксимидом следует отказаться от грудного вскармливания, т.к. концентрация в грудном молоке может достигать до 94% концентрации в плазме крови матери.

Побочные действия

Нежелательные реакции, представленные ниже, перечислены в соответствии с поражением органов и систем органов. Распределение по частоте встречаемости нежелательных реакций произведено в соответствии с классификацией ВОЗ: очень часто (⩾ 1/10), часто (⩾ 1/100, но Дозозависимые нежелательные эффекты Нарушения со стороны обмена веществ, печени и почек: часто - нарушение аппетита, уменьшение массы тела. Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: очень часто: тошнота, рвота, боли в животе, часто - диарея или запор. Нарушения со стороны центральной нервной системы: часто - сильная головная боль, очень редко =дискинезия в течение первых 12 часов лечения, которая исчезает после отмены этосуксимида или контролируется дифенгидрамином. Нарушения со стороны психики: часто - вялость, эмоциональное отчуждение, беспокойство, нарушения сна, атаксия, нечасто - развитие галлюцинаторно-параноидных идей в течение нескольких дней и недель. Нарушения со стороны дыхательной системы: очень часто - икота. Нежелательные эффекты, не зависящие от дозы Нарушения со стороны системы кроветворения: редко - лейкопения, эозинофилия, тромбоцитопения, агранулоцитоз, очень редко - апластическая анемия и панцитопения. Нарушения со стороны иммунной системы: редко - системная красная волчанка различной интенсивности. Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: неизвестно - могут наблюдаться кожные аллергические реакции, такие как экзантема. Возможно развитие синдрома Стивенса-Джонсона (CCD), а также лекарственная сыпь с эозинофилией и системными симптомами (DRESS). Прекратите прием и немедленно обратитесь за медицинской помощью, если вы заметили любой из следующих симптомов: красноватые пятна на туловище, пятна похожие на мишени, часто с центральными волдырями и шелушением кожи, на слизистой полости рта, носа, носоглотки, половых органах, конъюнктивы глаз. Этим серьезным кожным высыпаниям могут предшествовать лихорадка и симптомы гриппа (синдром Стивенса-Джонсона). распространенная сыпь, высокая температура тела и увеличение лимфатических узлов (лекарственная реакция с эозинофилией и системными симптомами (DRESS), изменения в крови (кровоподтеки или кровотечение, повышенная температура, боль в горле, язвы во рту, усталость, часто возникающие инфекции). У Вас могут периодически брать кровь на анализ.

Передозировка

Всякий раз, когда установлен диагноз передозировки, следует рассматривать возможность множественной интоксикации в результате приема нескольких лекарственных препаратов (например, при суицидальной попытке). Симптомы передозировки значительно усиливаются под влиянием алкоголя и других средств, угнетающих деятельность ЦНС. Симптомы интоксикации Усталость, летаргия, депрессивные состояния и состояния ажитации, иногда раздражительность, а также другие дозозависимые нежелательные эффекты выражены наиболее сильно после передозировки. Имеющиеся симптомы можно расценивать как передозировку, если концентрация этосуксимида в плазме крови составляет более 150 мкг/мл. Лечение интоксикации При выраженной передозировке в начале показано, промывание желудка и введение активированного угля. Необходимо проведение реанимационных мероприятий для поддержания функций сердечно-сосудистой и дыхательной систем.

Взаимодействие с другими препаратами

Этосуксимид обычно не вызывает изменений концентраций в плазме крови других противоэпилептических средств (например, примидона, фенобарбитала, фенитоина), т. к. не является индуктором ферментов. Однако в отдельных случаях возможно повышение концентрации фенитоина в плазме крови. Прием карбамазепина приводит к повышению плазменного клиренса этосуксимида. На фоне терапии вальпроевой кислотой возможно изменение концентрации этосуксимида в сыворотке крови. Нельзя исключить, что при одновременном применении препаратов, оказывающих угнетающее влияние на деятельность ЦНС и этосуксимида, усилятся их седативные эффекты.

Особые указания

Во избежание развития генерализованных тонико-клонических судорог, которые часто усугубляют течение сложных и атипичных судорожных припадков, можно использовать комбинацию этосуксимида с противосудорожными средствами (например, примидоном, фенобарбиталом). Дополнительную профилактику генерализованных тонико-клонических судорог можно проводить без исключения в случае приступов пикнолептических абсансов у детей школьного возраста. Особое внимание следует уделять любым проявлениям миелотоксичности (например, повышение температуры тела, тонзиллит, аденоидит, а также склонность к кровоточивости), в таких случаях пациенту может потребоваться консультация врача. Для определения возможных миелотоксических эффектов следует периодически проводить анализ клеточного состава крови (вначале ежемесячно, а спустя 12 месяцев - с интервалом 6 месяцев). Если количество лейкоцитов менее 3500/мкл или

количество гранулоцитов менее 25%, показано уменьшение дозы этосуксимида или его отмена. Также следует регулярно контролировать показатели функции печени и почек. Риск возникновения дозозависимых нежелательных эффектов может быть уменьшен, если терапию начинают медленно, дозу повышают постепенно, и пациенты принимают этосуксимид во время или после еды. Если развиваются дозозависимые обратимые побочные эффекты, этосуксимид следует отменить, если лечение препаратом возобновляется, следует учитывать возможность их повторного возникновения. При развитии дискинезий этосуксимид следует отменить. Кроме того, может потребоваться внутривенная инъекция дифенгидрамина. Преимущественно у пациентов с указаниями в анамнезе на психические заболевания, возможно развитие соответствующих побочных эффектов со стороны психики (тревожные состояния, галлюцинаторные симптомы). У этой категории пациентов этосуксимид следует применять с особой осторожностью. При продолжительной терапии возможно уменьшение физической активности пациента и интереса к окружающему (например, у детей и подростков может наблюдаться ухудшение способности к обучению в школе). При терапии этосуксимидом сообщалось о серьезных нежелательных реакциях, таких как развитие синдрома Стивенса-Джонсона (CCD), а также лекарственная сыпь с эозинофилией и системными симптомами (DRESS). Следует прекратить прием препарата при появлении первых признаков и симптомов, указанных в разделе Побочные реакции. Следует избегать употребления алкоголя при лечении этосуксимидом.Влияние на способность управлять трансп. ср. и мех.:Даже при применении этосуксимида в соответствии с инструкцией, возможно изменение реактивности до такой степени, что способность к вождению и работе с механизмами нарушается. Это проявляется более сильно при одновременном приеме с алкоголем. Поэтому пациентам, получающим этосуксимид, следует воздержаться от управления транспортными средствами и механизмами, а также от занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций, по крайней мере, в течение фазы стабилизации. В каждом случае решение принимает лечащий врач, учитывая индивидуальную реакцию и соответствующую дозу.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °C. Хранить в недоступном для детей месте.