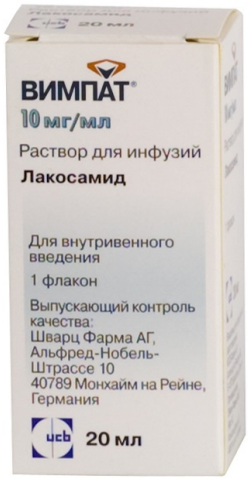
Инструкция по применению
Вимпат Раствор для инфузий 10 мг/мл 20 мл 1 шт

Характеристики



Форма выпуска: Раствор
Страна: Беларусь
Производитель: ЮСБ Фарма
Порядок отпуска: по рецепту
Действующее вещество: Лакосамид
Количество в упаковке: 1
Дозировка действующего вещества: 10 мг/мл

Описание

Противосудорожное средство

Действующее вещество

Лакосамид

Состав

лакосамид Вспомогательные вещества: натрия хлорид, хлористоводородная кислота разведенная (10%) до pH 4.0, вода д/и.

Форма выпуска

Раствор

Фармакокинетика

Фармакокинетические параметры прямо пропорционально зависят от используемой дозы, не меняются со временем и характеризуются низкой индивидуальной вариабельностью. Всасывание Лакосамид быстро и полностью всасывается после приема внутрь. Биодоступность лакосамида в таблетках составляет примерно 100%. После приема внутрь концентрация лакосамида в плазме быстро увеличивается, Cmax достигается через 0.5-4 ч. Прием пищи не влияет на скорость и степень всасывания. После в/в введения в дозе 50-300 мг концентрация лакосамида в плазме увеличивается пропорционально дозе. Распределение Связывание с белками плазмы менее 15%. Vd составляет примерно 0.6 л/кг. При применении 2 раза/сут Css в плазме достигаются в течение 3 дней. Метаболизм Образование О-дезметилового метаболита происходит, в основном, под действием изофермента CYP2C19. Другие ферменты, участвующие в метаболизме лакосамида, не установлены. Концентрация О-дезметилового метаболита в плазме составляет примерно 15% от концентрации лакосамида. Этот метаболит не обладает фармакологической активностью. Выведение 95% дозы выводится с мочой, как в неизмененном виде (около 40% от дозы), так и в виде метаболитов (О-дезметиловый метаболит - менее 30%). Доля полярной фракции в моче (предположительно сериновые производные) составила примерно 20%. Другие метаболиты определяются в моче в количестве 0.5-2%. T1/2 составляет примерно 13 ч.

Показания

в составе комплексной терапии парциальных судорожных припадков, сопровождающихся или не сопровождающихся вторичной генерализацией, у пациентов с эпилепсией в возрасте от 16 лет и старше. Вимпат® в виде инфузий назначают в тех случаях, когда временно невозможен прием препарата внутрь.

Способ применения и дозы

Для приема внутрь Суточную дозу делят на 2 приема - утром и вечером, вне зависимости от времени приема пищи. Рекомендуемая стартовая доза составляет 50 мг 2 раза/сут. Через 1 неделю дозу увеличивают до 100 мг 2 раза/сут. С учетом эффективности и переносимости поддерживающую дозу можно увеличить при приеме таблеток можно увеличить до 150 мг 2 раза/сут на третьей неделе приема, при приеме сиропа - на 50 мг 2 раза/сут каждую неделю, до максимальной суточной дозы 400 мг/сут (200 мг 2 раза/сут) с четвертой недели. Отменять Вимпат® рекомендуется постепенно, снижая дозу на 200 мг в неделю. Для в/в введения В/в вводят в течение 15-60 мин 2 раза/сут. Рекомендуемая начальная доза составляет 50 мг 2 раза/сут. Через 1 неделю дозу увеличивают до 100 мг 2 раза/сут. С учетом эффективности и переносимости поддерживающую дозу можно увеличивать каждую

неделю на 50 мг 2 раза/сут до максимальной суточной дозы 400 мг (по 200 мг 2 раза /сут). Отменять Вимпат® рекомендуется постепенно (снижая дозу на 200 мг в неделю). Раствор можно вводить без дополнительного разведения или разведенным. Имеется опыт использования раствора для инфузий длительностью до 5 дней. Следует переходить на прием препарата внутрь сразу, как только это станет возможным. Лечение препаратом Вимпат® может быть начато как с приема таблеток внутрь, так и с в/в введения раствора для инфузий. При необходимости можно заменять прием таблеток в/в введением без повторного титрования дозы и наоборот. При этом не следует менять суточную дозу и кратность применения (2 раза/сут). При приеме внутрь и при в/в введении пациентам с легким и умеренным нарушением функции почек (КК >30 мл/мин) коррекция дозы не требуется. У пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК ⩽30 мл/мин) максимальная доза составляет 300 мг/сут. Лакосамид удаляется из плазмы при гемодиализе, в течение 4 ч после процедуры AUC снижается приблизительно на 50%. Пациентам, находящимся на гемодиализе, рекомендуется назначить дополнительно до 50% разовой дозы сразу после окончания процедуры. Лечение больных с почечной недостаточностью тяжелой степени следует проводить с осторожностью, т.к. клинический опыт применения препарата у таких пациентов небольшой, и возможно накопление метаболита, не обладающего известной фармакологической активностью. Всем пациентам с нарушенной функцией почек титрование дозы рекомендуется проводить с осторожностью. При приеме внутрь и при в/в введении пациентам с легким и умеренным нарушением функции печени коррекция дозы не требуется. Титровать дозу таким пациентам следует с осторожностью, учитывая, что нарушению функции печени часто сопутствует нарушение функции почек. Фармакокинетика лакосамида у больных тяжелой печеночной недостаточностью не изучалась. При приеме внутрь и при в/в введении пациентам пожилого возраста снижение дозы не требуется. Опыт применения лакосамида у пожилых пациентов с эпилепсией ограничен. У пожилых людей необходимо учитывать возможность возрастного снижения почечного клиренса и, как следствие, повышения концентрации лакосамида в плазме крови. Правила приготовления инфузионного раствора Перед введением препарата убедитесь, что раствор во флаконе прозрачный, бесцветный и не содержит посторонних примесей. В противном случае не используйте данный флакон. Вимпат® раствор для инфузий совместим со следующими растворителями: 0.9% раствор натрия хлорида, 5% раствор декстрозы, раствор Рингера лактат. Приготовленный раствор следует использовать в течение 24 ч после растворения при хранении во флаконах из стекла или поливинилхлорида при температуре не выше 25°C. Неиспользованный раствор следует утилизировать в соответствии с существующими правилами.

Противопоказания

AV-блокада II или III степени, возраст до 16 лет, наследственная непереносимость фруктозы, дефицит сахаразы-изомальтазы, глюкозо-галактозная мальабсорбция (т.к. в состав сиропа входит фруктоза), фенилкетонурия (т.к. в состав сиропа входит аспартам), повышенная чувствительность к компонентам препарата, в т.ч. к сое (входит в состав оболочки таблетки), а также к арахису. С осторожностью следует применять препарат у пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени (КК≤30 мл/мин), с нарушениями проводимости, сердечной недостаточностью и инфарктом миокарда в анамнезе. Особую осторожность следует соблюдать у пациентов пожилого возраста, у которых повышен риск заболеваний сердца, а также при использовании лакосамида в комбинации с препаратами, которые вызывают удлинение интервала PR.

Применение при беременности и кормлении грудью

Клинических данных о применении лакосамида при беременности не имеется. Лакосамид не следует применять при беременности, за исключением тех случаев, когда польза для матери явно перевешивает возможный риск для плода. Если женщина планирует беременность, то необходимо тщательно взвесить целесообразность применения этого препарата. В экспериментальных исследованиях не было зарегистрировано тератогенных эффектов, однако отмечена эмбриотоксичность при применении в высоких (токсических) дозах. Данные о выделении лакосамида с грудным молоком человека отсутствуют. В экспериментальных исследованиях отмечена экскреция лакосамида с грудным молоком. Во время лечения лакосамидом следует прекратить грудное вскармливание.

Побочные действия

При лечении лакосамидом самыми частыми побочными реакциями были головокружение, головная боль, тошнота и диплопия. Как правило, они были легкими или умеренно выраженными. Выраженность некоторых побочных реакций зависела от дозы и уменьшалась после ее снижения. Частота и тяжесть побочных реакций со стороны ЦНС и пищеварительной системы обычно уменьшалась со временем. Применение лакосамида сопровождается дозозависимым удлинением интервала PR, вследствие чего возможно развитие таких клинических состояний, как AV-блокада, обмороки и брадикардия. Побочные реакции, отмеченные более чем у 1% пациентов в клинических исследованиях, перечислены ниже. Определение частоты побочных реакций: очень часто (⩾1/10), часто (от ⩾1/100 до Со стороны ЦНС: очень часто - головокружение, головная боль, часто - депрессия, раздражительность, нарушение равновесия, нарушение координации движений, нарушение памяти, нарушение внимания, когнитивные нарушения, гипестезия, сонливость, спутанность сознания, тремор, нистагм, дизартрия. Со стороны органов чувств: очень часто - диплопия, часто - нечеткость зрения, вертиго, шум в ушах. Со стороны пищеварительной системы: очень часто - тошнота, часто - рвота, запор, метеоризм, диспепсия, сухость во рту. Дерматологические реакции: часто - зуд. Со стороны костно-мышечной системы: часто - мышечные спазмы. Прочие: часто - нарушение походки, астения, утомляемость, падения, повышенный риск получения травм (из-за нарушения координации движений и головокружения).

Передозировка

Клинические данные о передозировке лакосамида ограничены. Симптомы: после приема препарата в дозе 1200 мг/сут - в основном головокружение и тошнота, которые исчезали после снижения дозы. Во время проведения клинических исследований был зарегистрирован единовременный прием лакосамида в дозе 12 г, который был принят вместе с токсическими дозами других противоэпилептических препаратов. Больной впал в коматозное состояние, но затем полностью восстановился без последствий. Лечение: антидота лакосамида не существует, проводят симптоматическую терапию, при необходимости возможно использование гемодиализа.

Взаимодействие с другими препаратами

Результаты исследований свидетельствуют о низкой вероятности взаимодействия лакосамида с другими препаратами. В доклинических исследованиях наблюдался синергизм или аддитивное противосудорожное действие в комбинации с леветирацетамом, карбамазепином, фенитоином, вальпроевой кислотой, ламотриджином, топираматом, габапентином. Лакосамид следует применять осторожно в сочетании с препаратами, вызывающими удлинение интервала PR (например, карбамазепином, ламотриджином, прегабалином) и антиаритмическими препаратами I класса. Однако в клинических исследованиях не было отмечено дополнительного удлинения интервала PR у больных, которые одновременно принимали лакосамид в комбинации с карбамазепином или ламотриджином. Лакосамид является субстратом цитохрома P450 (CYP2C19). Мощные индукторы ферментов, такие как рифампицин или зверобой продырявленный (Hypericum perforatum), могут вызвать умеренное снижение системной концентрации лакосамида. В связи с этим при назначении подобных препаратов или их отмене следует соблюдать осторожность. Лакосамид в любой терапевтической дозе не оказывает влияния на Css в плазме противосудорожных средств, в т.ч. леветирацетама, карбамазепина, карбамазепина эпоксида, ламотриджина, топирамата, окскарбазепина, фенитоина, вальпроевой кислоты, фенобарбитала, габапентина, клоназепама и зонизамида. Карбамазепин и вальпроевая кислота не оказывали влияния на концентрацию лакосамида в плазме. Сопутствующая терапия противосудорожными средствами, индуцирующими ферменты (карбамазепином, фенитоином, фенобарбиталом в различных дозах), снижала общую системную экспозицию лакосамида на 25%. Не выявлено признаков значимого взаимодействия между лакосамидом и пероральными контрацептивами этинилэстрадиолом и левоноргестрелом. Лакосамид не оказывает влияние на концентрацию прогестерона. Лакосамид не влияет на фармакокинетику дигоксина. Клинически значимого взаимодействия лакосамида и метформина не выявлено. Данных о взаимодействии лакосамида с этанолом нет. Омепразол в дозе 40 мг 1 раз/сут увеличивал AUC лакосамида на 19%. Этот эффект, возможно, не имеет клинического значения. При приеме однократной дозы лакосамид не влиял на фармакокинетику омепразола. Влияние других изоферментов цитохрома P450 и других ферментов на метаболизм лакосамида точно не установлено. Лакосамид не является субстратом или ингибитором P-гликопротеина. Связывание лакосамида с белками плазмы крови составляет менее 15%. В связи с этим клинически значимое взаимодействие с другими препаратами, связывающимися с белками, маловероятно.

Особые указания

Лечение лакосамидом может сопровождаться головокружением, потенциально приводящим к травмам и падениям. В связи с этим, пациентам следует соблюдать осторожность. Анализ данных клинических исследований противосудорожных препаратов свидетельствует о небольшом увеличении риска возникновения суицидальных мыслей и суицидального поведения. Механизм повышения риска не ясен, существующие данные не позволяют отрицать существование такого риска при приеме лакосамида. Лица, ухаживающие за пациентами, должны быть предупреждены о существующем риске и необходимости консультации специалиста в случае появления суицидального поведения. Пациенты, получающие лечение лакосамидом, должны находиться под тщательным наблюдением и быть предупреждены о необходимости консультации у специалиста в случае появления суицидальных мыслей. Учитывая возможность удлинения интервала PR на фоне терапии препаратом Вимпат®, пациентам рекомендуется периодический контроль ЭКГ. Сироп содержит вспомогательные вещества натрия пропилпарагидроксибензоат (E217) и натрия метилпарагидроксибензоат (E219), которые могут вызвать аллергические реакции (в т.ч. замедленного типа). Сироп содержит 3.7 г сорбитола (E420) на 200 мг лакосамида, что соответствует 9.7 ккал. В состав сиропа входит 1.06 ммоль (или 25.2 мг) натрия на 200 мг лакосамида. Это следует учитывать, если пациент соблюдает диету с ограничением потребления натрия. Использование в педиатрии Лакосамид не рекомендуется назначать детям и подросткам в возрасте до 16 лет, т.к. безопасность и эффективность препарата в этих возрастных группах не изучались. Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами Препарат может оказывать влияние на способность управлять автомобилем или пользоваться сложной техникой. Лечение этим препаратом может сопровождаться развитием головокружения или нечеткостью зрения. Соответственно, пациентам не рекомендуется водить автомобиль или управлять сложной техникой.