Состав и форма выпуска

Прозрачный сироп со вкусом малины от желтоватого до розоватого цвета.

Каждая 5 мл доза содержит 250 мг этосуксимида.

Другими ингредиентами являются: цитрат натрия, бензоат натрия (E211), моногидрат лимонной кислоты, глицерин, сахароза, малиновый ароматизатор NN 05557 (включая глюкозу), сахарин, натрий и вода (см. Раздел 2 Zarontin содержит сахарозу и глюкозу). Zarontin содержит сахарозу 3 г и глюкозу 4,6 мг в каждых 5 мл.

Фармакологическое действие

Этосуксимид дает выборочный контроль над отсутствием судорог (петитл), даже если он осложнен грандиозным синдромом. По сравнению с другими противосудорожными препаратами этосуксимид более специфичен для чистого петита.

Механизм действия

Считается, что снижение частоты приступов достигается за счет снижения моторной коры и повышения порога конвульсивных раздражителей, что видно по подавлению характерного скачка и волновой картины ЭЭГ.

Детская популяция

В двойном слепом рандомизированном исследовании продолжительностью 20 недель у 453 детей в возрасте от 2,5 до 13 лет с недавно диагностированной детской эпилепсией отсутствия были исследованы эффективность, переносимость и нейропсихологические эффекты этосуксимида, вальпроевой кислоты и ламотриджина в качестве монотерапии при детской эпилепсии отсутствия. Те, кто принимал либо этосуксимид, либо вальпроевую кислоту, имели более высокие показатели свободы от сбоев (53% и 58% соответственно), чем те, кто принимал ламотриджин (29%; отношение шансов по сравнению с этосуксимидом и ламотриджином 2,66; доверительный интервал 95% [ДИ] От 1,65 до 4,28; отношение шансов вальпроевой кислоты к ламотриджину 3,34; 95% ДИ от 2,06 до 5,42; P <0,001 для обоих сравнений). Как в заданном, так и в последующем анализах этосуксимид приводил к меньшему вниманию по сравнению с вальпроевой кислотой (на 16 и 20 неделе процент пациентов с показателем достоверности 0,60 или выше в тесте непрерывной работы Коннера был выше в группа вальпроевой кислоты, чем группа этосуксимида (49% против 33%; отношение шансов 1,95; 95% ДИ от 1,12 до 3,41; p = 0,03) и группа ламотриджина (49% против 24%; отношение шансов 3,04; 95 % CI 1,69-5,49; P <0,001).

Фармакокинетика

Абсорбция

Этосуксимид легко всасывается из желудочно-кишечного тракта и интенсивно метаболизируется в печени.

Распределение

Он широко распространен по всему организму, но не связан с белками плазмы, поэтому концентрации слюны могут быть полезны для мониторинга.

Биотрансформация

Пиковые уровни сыворотки возникают через 1-7 часов после однократного приема внутрь. Терапевтические уровни составляют от 40 до 100 мкг / мл. Имеет длительный период полувыведения: у взрослых 40 - 60 часов; дети 30 часов.

Устранение

Он выводится с мочой в основном в виде его метаболитов.

Этосуксимид дает выборочный контроль над отсутствием судорог (петитл), даже если он осложнен грандиозным синдромом.

Также препарат применяется для купирования миоклонических судорог.

Дозология и способ применения

Взрослые и дети старше 6 лет

Начинать прием необходимо с небольшой дозы - 500 мг в день с шагом 250 мг каждые пять-семь дней, пока не будет достигнут контроль с 1000 - 1500 мг в день. Иногда 2000 мг в разделенных дозах может быть необходимо.

Детское население в возрасте 0-6 лет

Начальная суточная доза составляет 250 мг (5 мл), которую следует постепенно увеличивать небольшими порциями каждые несколько дней, пока не будет достигнут контроль. Оптимальная доза у большинства детей составляет 20 мг / кг / сутки. Максимальная доза должна составлять 1000 мг.

Эффективные уровни этосуксимида в плазме обычно лежат между 40 и 100 мкг на мл, но клинический ответ должен быть критерием для регулирования дозировки. Период полураспада этосуксимида в плазме составляет более 24 часов, но суточная доза, если она больше, более удобно делится между утром и вечером.

Дети старшего возраста и взрослые обычно принимают этосуксимид в форме капсул.

Противопоказания

- Повышенная чувствительность к действующему веществу, сукцинимидам или к любому из наполнителей.
- Порфирии.

Особые предупреждения и меры предосторожности при использовании

Суицидальное поведение

Суицидальные мысли и поведение были зарегистрированы у пациентов, получавших антиэпилептические средства по нескольким показаниям. Мета-анализ рандомизированных плацебо-контролируемых испытаний противоэпилептических препаратов также показал небольшой повышенный риск суицидальных мыслей и поведения. Механизм этого риска неизвестен, и имеющиеся данные не исключают возможности повышенного риска для этосуксимида.

Таким образом, пациенты должны быть проверены на наличие признаков суицидальных мыслей и поведения, и следует рассмотреть соответствующее лечение. Пациентам (и лицам, осуществляющим уход за пациентами) следует рекомендовать обратиться к врачу в случае появления признаков суицидального мышления или поведения.

Нарушение функции печени и почек

Используйте с осторожностью при печеночной или почечной недостаточности. Мониторинг функции печени / почек и концентрации этосуксимида.

Вывод

Если в качестве другого противоэпилептического препарата заменяют этосуксимид, последний не должен быть отменен внезапно, но замена должна производиться постепенно с перекрытием препаратов, в противном случае может произойти прорыв мелкого белка.

Этосуксимид всегда следует выводить медленно.

Наполнители

Это лекарство содержит 3,05 г сахарозы на 5 мл, что эквивалентно 610 мг на мл и от 0,16 до 0,22 г других сахаров на 5 мл. Это следует учитывать у пациентов с сахарным диабетом. Пациенты с редкими наследственными проблемами непереносимости фруктозы, нарушения всасывания глюкозы-галактозы или недостаточности сахарозы-изомальтазы не должны принимать это лекарство. Может быть вредным для зубов.

Это лекарство содержит менее 1 ммоль натрия (23 мг) на 5 мл сиропа, то есть, по существу, «без натрия».

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие формы взаимодействия

Концентрации этосуксимида в плазме могут быть снижены с помощью карбамазепина, примидона, фенобарбитона и ламотриджина и увеличены изониазидом. При использовании в комбинации с фенитоином или вальпроатом натрия не наблюдается последовательных изменений уровней этосуксимида. Однако уровни фенитоина увеличиваются при одновременном приеме этоксусимида.

Беременность и кормление грудью

Наблюдается небольшое увеличение числа врожденных пороков развития у детей, рожденных матерями, получающими противосудорожные препараты. Для женщин, планирующих беременность, или тех, кто уже забеременел, риск следует тщательно взвесить в отношении пользы лечения.

Грудное вскармливание

Этосуксимид может выводиться с грудным молоком. Матери, получающие препарат, не должны кормить грудью.

Влияние на способность управлять автомобилем и использовать машины

Этосуксимидный сироп оказывает большое влияние на способность управлять автомобилем и использовать его. Пациентам следует предупредить, что Этосуксимид может вызвать сонливость, и если это происходит, следует избегать вождения или эксплуатации машин.

Нежелательные эффекты

Расстройства крови и лимфатической системы

Сообщалось о дискразиях крови (лейкопения, агранулоцитоз, апластическая анемия и панцитопения), некоторые с летальным исходом. В большинстве случаев лейкопении картина крови нормализуется при уменьшении дозы или прекращении приема. В некоторых случаях пациенты, которые становятся лейкопениками при другой противосудорожной терапии, были удовлетворительно пролечены только одним этосуксимидом. Также было отмечено повышенное количество нейтрофилов, моноцитов и эозинофилов. Пациентам следует рекомендовать немедленно обратиться к врачу для полного анализа крови, если развиваются такие симптомы, как лихорадка, боль в горле, язвы во рту, кровоподтеки или кровотечение.

Расстройства нервной системы

Этосуксимид при применении по отдельности при смешанных типах эпилепсии может

увеличить частоту генерализованных тонико-клонических (грандиозных) приступов у некоторых пациентов.

Другие побочные реакции

Потеря веса, диарея, боль в животе, гипертрофия десен, отек языка, икота, раздражительность, гиперактивность, нарушения сна, ночные страхи, неспособность сосредоточиться, агрессивность, параноидальный психоз, повышенное либидо, миопия и вагинальное кровотечение.

Легкие побочные эффекты, распространенные вначале, но обычно преходящие, включают апатию, эйфорию, усталость, сонливость, головокружение, головную боль, атаксию, дискинезию, фотофобию, депрессию, тошноту, рвоту, анорексию и расстройство желудка.

Сообщалось о психотических состояниях, которые, как считается, были вызваны или обострены противосудорожной терапией.

Заболевания кожи и подкожной клетчатки

Редко сообщалось о случаях кожной сыпи и единичных случаях узловатой эритемы. Иногда у детей, получавших этосуксимид, сообщалось о волчаноподобных реакциях, в отличие от тяжелых системных иммунологических нарушений, например нефротический синдром, как правило, с полным выздоровлением после отмены препарата, с обнаружением антиядерных антител без клинических особенностей. Также сообщалось о синдроме Стивенса-Джонсона.

Передозировка

Там, где считается, что более 2 г проглочено, может использоваться промывание желудка, если промежуток времени составляет менее четырех часов. Регулярное наблюдение за дыханием и кровообращением укажет на необходимость поддерживающих мер.

Условия хранения

При температуре не выше 25 С, в недоступном месте для детей.

Условия продажи

По рецепту.