

---

## Состав и форма выпуска

Таблетки, покрытые оболочкой белого цвета, круглые, двояковыпуклые.

1 таблетка содержит *активное вещество*: 4-(1,1-dioxothiazinan-2-yl)benzenesulfonamide - 50 мг.

*Вспомогательные вещества*: крахмал кукурузный, лактозы моногидрат 50мг, желатин, тальк, коллоидный безводный диоксид кремния, стеарат магния, гидромеллоза, макрогол 4000, титана диоксид.

## Фармакологическое действие

Механизм действия окончательно не выяснен. Считается что сультиам ингибирует карбоангидразу (изоэнзим II), которая отвечает за регулировку состава pH. Угнетает моторные центры коры большого мозга, повышает судорожный порог. При приеме внутрь быстро и почти полностью всасывается из ЖКТ. Теоретическая биодоступность составляет не менее 90%. Время достижения максимальной концентрации 2-8 ч. Терапевтическая концентрация составляет 60-100 мкг/мл. Выводится преимущественно с мочой. Связывается с белками плазмы крови, приблизительно на 60%. Легко проходит гистогематические барьеры; уровень спинномозговой жидкости равен таковому в плазме. Проникает через плацентарный барьер и в грудное молоко. Снижает частоту малых припадков эпилепсии, эпилептиформных атак, подавляет пароксизмальную электроэнцефалографическую активность, ассоциированную с характерными для абсансов нарушениями сознания. Эффективен также при миоклонических приступах.

## Фармакокинетика

Время достижения пика концентрации - 2-8ч. Период полураспада - 2-9ч. Биодоступность полностью не исследована. Предполагается 90%. Около 60% препарата выводится в неизменном виде.

Фармакокинетика у детей до 12 лет изучена не достаточно. Детям в возрасте до 3 лет препарат не показан. Детям старше 3 лет рекомендуются уменьшенные дозы. В целом, Сультиам может быть использован как антиконвульсант третьей очереди выбора при всех показанных формах детской эпилепсии. В большинстве случаев Сультиам применяется в качестве дополнительного лекарственного препарата при лечении парциальных эпилептических припадков с вторичной генерализацией или без.

## Показания к применению

Показаниями к применению препарата Осполот являются:

- терапия парциальных приступов эпилепсий;
- терапия роландической эпилепсии в детском возрасте;
- терапия генерализованных эпилепсий (менее эффективен);
- при сложных височных (парциальных) пароксизмах;
- при доброкачественных парциальных эпилепсиях;
- при синдроме Ландау-Клеффнера;
- при псевдосиндроме Леннокса-Гасто;
- при синдроме Веста;
- ESES - эпилептический электрический статус в период медленного сна.

Осполот более эффективен при парциальных, чем при генерализованных эпилепсиях. В ряде исследований установлено его позитивное влияние при сложных парциальных (височных) пароксизмах. В исследованиях последних лет подтверждены данные результаты и показана эффективность сультиама при доброкачественных парциальных эпилепсиях. В настоящее время сультиам применяется, главным образом, при лечении доброкачественной парциальной эпилепсии с центро-темпоральными спайками (роландической эпилепсии), при синдроме Ландау-Клеффнера, ESES (электрический эпилептический статус в фазу медленного сна), псевдосиндроме Леннокса-Гасто. Сультиам показан также при симптоматических парциальных эпилепсиях.

Удивителен эффект сультиама на ЭЭГ-паттерны при доброкачественных парциальных эпилепсиях: у 80% больных вскоре после назначения терапии отмечается исчезновение острых волн, в отдельных случаях - через 48 часов. Однако описаны случаи толерантности к сультиаму. Позитивный эффект сультиама на ЭЭГ используется у отдельных больных с синдромом Ландау-Клеффнера и ESES. Отмечено позитивное влияние сультиама на познавательные функции этих больных.

## **Способ применения**

Режим дозирования препарата Осполот устанавливают индивидуально в зависимости от клинической картины заболевания, эффективности и переносимости препарата.

Перед началом лечения, а также во время лечения, рекомендуется провести анализы крови и мочи, а также другие тесты направленные на установление патологии почек.

Клинически эффективная доза составляет 5 мг/кг. Поддерживающая доза может составлять 5-10 мг/кг. Суточная доза: взрослые 400-2000 мг; дети: 5-10 мг/кг. Суточная доза препарата вследствие короткого периода полураспада должна быть разделена на несколько приемов

Препарат принимают во время или после еды. Таблетки следует проглатывать целиком, запивая достаточным количеством жидкости (например, стаканом воды). Начальная суточная доза Осполот для взрослых и детей составляет 5 мг/кг массы тела. Каждые 4-7 дней суточную дозу увеличивают на 5 мг/кг. Поддерживающая доза может составлять 5-10 мг/кг. Поддерживающая суточная доза препарата составляет для взрослых может

варьироваться от 400 до 2000 мг. Для детей 5 – 10 мг/кг массы тела. Суточную дозу принимают в 2 или 3 приема, из – за короткого периода полураспада.

Длительность лечения устанавливается индивидуально. Лечение препаратом Осполот не должно прекращаться внезапно. Препарат отменяют постепенно, в течении 2-3 недель.

## **Побочные действия**

Осполот - относительно безопасное лекарственное средство с минимальными побочными проявлениями. Побочные явления дозозависимы и снижаются при уменьшении дозы препарата.

*Со стороны ЦНС:* очень часто - сонливость или бессонница, эмоциональная лабильность; часто - головокружение, головная боль, диплопия, нервозность; в отдельных случаях - нарушение поведения, тревожность, беспокойство, спутанность сознания, галлюцинации, раздражительность, психотические расстройства, мысли о самоубийстве, боли в суставах, большие судорожные припадки, слюнотечение, сонливость, кома, возникновение полиневритов, парестезии;

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* боль или дискомфорт в груди, тахикардия, экстрасистолия, лабильность АД;

*Со стороны дыхательной системы:* явления гипервентиляции;

*Со стороны пищеварительной системы:* наблюдаются примерно у 10% больных - абдоминальная боль, диарея, диспепсия, тошнота, рвота, анорексия, отрыжка, потеря веса, отсутствие аппетита,;

*Дерматологические реакции:* редко – аллергические реакции, Синдром Стивена-Джонсона;

*Со стороны системы кроветворения:* в отдельных случаях - лейкопения, нейтропения, панцитопения, тромбоцитопения;

*Со стороны мочеполовой системы:* появление камней в почках, изменение литогенного индекса мочи, почечная недостаточность;

*Прочие:* часто - кашель, случайные травмы.

Выраженной корреляции частоты возникновения побочных эффектов с возрастом пациента не наблюдается.

## **Противопоказания**

Осполот не должен использоваться у детей до 3-х лет, у пациентов с гиперчувствительностью к производным сульфонамидов и любым вспомогательным веществам входящим в состав Ospolot.

Не рекомендуется: у пациентов находящихся в состоянии острого отравления алкоголем, снотворными, обезболивающими, нейролептиками, антидепрессантами, солями лития, у пациентов с наркотической или алкогольной зависимостью (повышенный риск развития

зависимости), у пациентов с тяжелой дыхательной недостаточностью (риск обострения), у пациентов с синдромом апноэ сна (риск обострения), во время первого триместра беременности (использования во время второго и третьего триместра и в период лактации см.ниже), в период кормления грудью; нарушения функции печени; нарушения функции почек; заболевания крови; гипертиреоз в анамнезе, острая или хроническая порфирия, гипертоническая болезнь, психические заболевания.

## **Беременность**

Препарат Осполот не тестировался у беременных и кормящих женщин. Поэтому не рекомендуется применять препарат при беременности, за исключением тех случаев, когда потенциальные преимущества, по мнению врача, преобладают над возможным риском для плода. В случае наступления беременности следует сообщить об этом лечащему врачу. В случае назначения Осполот рекомендуется тщательное наблюдение.

Женщины детородного возраста должны применять надежные методы контрацепции во время лечения Осполот и спустя один месяц после отмены препарата.

Осполот выделяется с грудным молоком, поэтому при необходимости назначения Осполот в период лактации грудное вскармливание следует прекратить.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами**

При одновременном применении с карбамазепином концентрация Осполот в крови пациента снижается.

Одновременное применение с Ламотриджином, Фенитоином их содержание в крови увеличивается.

Одновременное применение с лекарственными веществами, угнетающими ЦНС, ведет к усилению угнетающего действия Осполот на ЦНС.

При одновременном приеме Осполот с галоперидолом происходит уменьшение концентрации последнего в плазме крови.

Осполот обычно не влияет на уровень других противосудорожных препаратов (например, примидона, фенобарбитала, дифенина) в плазме крови.

## **Передозировка**

Симптомы передозировки препаратом Осполот: усталость, снижение физической активности, утрата интереса к окружающему, снижение настроения, повышенная возбудимость, раздражительность.

Лечение: специфического препарата для лечения передозировки Осполот нет. После предполагаемой передозировки Осполот® может быть показано немедленное промывание желудка опорожнением или вызыванием рвоты с обычными мерами предосторожности для защиты дыхательных путей.

Показано общее поддерживающее лечение, включая регулярный контроль основных показателей состояния организма, и тщательное наблюдение. Осполот имеет длительный период полувыведения, поэтому его воздействие может иметь стойкий характер. Хотя формальных исследований для лечения передозировки не проводилось, гемодиализ снижал концентрацию зонисамида в плазме крови у пациентов с пониженной почечной функцией, и может рассматриваться в качестве лечения симптомов передозировки в случае клинических показаний.

## **Особые указания**

Препарат Осполот обычно хорошо переносится. Рекомендуется отмена Осполот у пациентов, у которых появились кожные высыпания, которые невозможно объяснить другими причинами. Все пациенты с появлением сыпи во время применения Осполот должны находиться под пристальным наблюдением, особенно пациенты с одновременным применением других противоэпилептических средств, которые способны сами вызывать кожные высыпания.

Отмена Осполот у пациентов с эпилепсией должна осуществляться постепенно во избежание связанных с отменой препарата приступов.

Отмена сопутствующих противоэпилептических препаратов также должна проводиться с осторожностью.

Пациент должен быть предупрежден, о невозможности употребления алкоголя при лечении препаратом Осполот.

Пациенты (или наблюдающий за ними персонал) должен немедленно поставить в известность лечащего врача если возникла боль в горле или лихорадка.

Следует соблюдать осторожность при применении препарата у пациентов с нарушением психики в анамнезе.

При длительном применении препарата возможно развитие генерализованных судорожных припадков.

Следует соблюдать режим дозирования препарата. В случае его несоблюдения возможен рецидив эпилептических припадков.

В случае если пациент пропустил очередной прием препарата или по ошибке принял двойную дозу, следует продолжать прием препарата по обычной схеме, т.е. не компенсировать пропущенный прием приемом дополнительной дозы или не пропускать следующий прием.

Возникновение дозозависимых побочных явлений нередко удается предупредить, начиная

лечение с малых доз и медленно их увеличивая, а также принимая препарат во время еды или после нее.

При появлении побочных явлений, не зависящих от принятой дозы препарата, следует прекратить прием Осполот.

*Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами*

Быстрота психической реакции после приема Осполот может снижаться. Поэтому в период лечения пациентам следует избегать вождения автотранспорта и другой деятельности, требующей высокой концентрации внимания и скорости психомоторных реакций. Одновременное употребление алкоголя приведет к еще большему снижению скорости психических реакций.

*Канцерогенность*

Исследование канцерогенности Осполот проводилось как на мелких грызунах, так и более крупных млекопитающих. Зарегистрировано, что sultiam, не приводит к усилению канцерогинеза.

## **Условия хранения**

Хранить в сухом месте при температуре не выше 25°C.

Хранить в недоступном для детей месте.

## **Условия продажи**

По рецепту.