

Латинское название: Convulex

Код АТХ: N03A G01

Действующее вещество: вальпроевая кислота

Производитель: G.L.Pharma (Австрия), R.P.Scherer (ФРГ), Валеант (РФ)

Отпуск из аптеки: по рецепту

Условия хранения: при т-ре 15-25°C

Срок годности: 5 л.

Конвулекс – линейка противоэпилептических средств на основе вальпроевой кислоты. Препараты выпускаются в нескольких лекарственных формах с различной дозировкой, с обычной и продленной скоростью выхода активного компонента (Конвулекс Ретард).

Показанием к назначению являются:

- Эпилепсия различного происхождения
- Генерализованные, парциальные формы эпилептических припадков
- Синдромы Веста, Леннокса-Гасто
- Поведенческие нарушения на фоне эпилепсии
- Детские тики, судороги
- Терапия и профилактика БАР.

Состав препарата

Сироп для детей

Содержание компонентов в 1 мл:

- Активное: 50 мг вальпроата натрия (для детей) или 300 мг
- Дополнительные: Е 965 (подсластитель мальтит жидкий), метил- и пропилпарагидроксибензоат, сахаринат натрия, Е 952, хлористый натрий, отдушка малиновая и персиковая, вода.

Конвулекс сироп – неокрашенный или чуть желтоватый раствор с фруктовым ароматом. Предназначен для перорального приема. Расфасовывается в светозащитные флаконы по 100 мл. В упаковке из картона – 1 емкость, аннотация, мерный шприц.

Капли

Содержание веществ в 1 мл:

- Активное: 300 мг вальпроата натрия
- Дополнительные: сахаринат натрия, апельсиновая отдушка, соляная кислота, гидроокись натрия, вода.

Конвулекс капли – просвечивающийся, неокрашенный или чуть кремоватый раствор с апельсиновым ароматом. Медпрепарат фасуется по 100 мл в светозащитные стеклянные флаконы из стекла, оборудованные дозирующим устройством. В упаковке из картона – 1 емкость, инструкция.

Раствор для инъекций

Содержание компонентов в 1 мл:

- Активное: 100 мг вальпроата натрия
- Дополнительные: гидроокись натрия, гидрофосфат додекагидрат динатрия, вода.

Инъекционный раствор для в/в применения. Лекарство фасуется в прозрачные неокрашенные ампулы из стекла по 5 мл, вложенные в пластиковые поддоны по 5 штук. В упаковке из картона – 1 поддон с 5 ампулами Конвулекса, описание-инструкция.

Конвулекс таблетки

Содержание компонентов в 1 табл.:

- Активное: 300 мг или 500 мг вальпроата натрия
- Вспомогательные: лимонная кислота, этилцеллюлоза, сополимер Эудрагит RS30D, тальк, аэросил, Е 572.
- Составляющие оболочки: Эудрагит RL30D (тип А), Эудрагит RS30D, Е 1505, кармеллоза натрия, диоксид титана, тальк, ванилин.

Конвулекс Ретард – ЛС в виде таблеток пролонгированного действия. Пилули овальной формы, выпуклые с двух сторон, с ванильным ароматом. На одной поверхности имеется линия разделения и оттиск «СС3» (на ЛС 300 мг) или «СС5» (на ЛС 500 мг). Ядро – белое либо практически белое. Пленочная оболочка белого цвета. Препарат расфасовывается по 50 либо 100 штук во флаконы из темного стекла или светозащитного пропиленового материала. В упаковке из картона – 1 флакон, руководство по использованию.

Капсулы

Содержание компонентов в 1 шт.:

- Активное: 150 мг, 300 мг или 500 мг вальпроевой кислоты
- Вспомогательные (ингредиенты наполнения и корпуса): сорбит Карион-83 (крахмал гидролизованной гидрогенизированный, Е 421, Е 420), глицерин, желатин, Е 171, Е 172 красный, соляная кислота
- Энтеросолюбильное покрытие капсулы: Eudragit L30D, триэтил цитрат, макрогол-6000, моностеарат глицерина.

ЛС в виде мягких капсул из желатина с защитным покрытием. Пиллюли удлиненной формы, коричнево-розового или темно-вишневого оттенка. Покрыты кишечнорастворимой пленкой. Капсулы маркированы черными надписями, указывающими дозировку: 150, 300 и 500. Лекарство помещено в блистеры по 10 или 20 штук. В упаковке из картона – 5 или 10 пластинок, аннотация.

Лечебные свойства

Терапевтическое действие противоэпилептического медпрепарата обеспечивается свойствами его главного компонента – вальпроевой кислоты, представленной в виде вальпроата натрия. Вещество обладает свойствами миорелаксанта и седативного средства.

Механизм влияния достигается через повышение уровня концентрации ГАВА в центральной НС путем подавления специфического фермента ГАВА-трансферазы. Помимо этого, вальпроевая кислота воздействует на нервные окончания, чувствительные к ГАВА, и кальциевые каналы.

Предполагается, что воздействие на мембранную активность оказывается через изменения проводимости калиевых ионов.

Также вещество нормализует психоэмоциональное состояние больного, оказывает противоаритмическое действие.

После проникновения внутрь организма активное вещество почти в полном объеме усваивается из ЖКТ, его биодоступность практически равна 100 %. Прием еды не влияет на скорость усвоения. Максимальные значения концентрации формируются после 2-4 дней приема.

Из организма выводится почками, небольшая часть – с калом. Вещество преодолевает ГЭБ, проходит в грудное молоко.

Способ применения

Конвулекс сироп для детей

Конвулекс, согласно инструкции по применению, можно давать детям в любое удобное время, вне зависимости от приема пищи. Сироп лучше запивать водой либо разбавлять ею непосредственно перед приемом.

Дозировка и длительность приема подбирается индивидуально, в зависимости от возраста и веса ребенка.

- В начале курса рекомендуемая суточная норма сиропа для детей, весящих меньше 20 кг, должна составлять 10-15 мг/кг. Если организм нормально воспринимает лекарство, то его дозировку разрешается увеличивать раз в неделю на 5-10 мг/кг до достижения наиболее нужного терапевтического эффекта.
- Дети с массой тела больше 20 кг: в начале терапии – СН 300 мг. Повышение дозировки проводится один раз в неделю на количество, полученное из соотношения 5-10 мг/кг. При необходимости СН 30 мг/кг может быть увеличена до 40-60 мг/кг под наблюдением медиков.

Монотерапия: СН для детей – 30 мг на 1 кг в несколько приемов, для подростков – от 20 до 30 мг/кг.

Пациенты с почечными дисфункциями: может потребоваться снижение дозировки.

Конвулекс Ретард

Таблетки пролонгированного действия нужно принимать целиком во время приема пищи или сразу после ее окончания.

Рекомендуемая производителем дозировка для взрослых – 600 мг в начале курса, при нормальной восприимчивости организма дозу можно повышать раз в 3 суток на 150-250 мг до достижения количества, эффективно устраняющего припадки.

Монотерапия: в начале курса СН – от 5 до 15 мг/кг, повышать можно раз в неделю на 5-10 мг/кг. Рекомендованная СН – 1-2 г, максимум – 2,5 г.

При комбинированной схеме терапии: принимать Конвулекс Ретард из расчета 10-30 мг на 1 кг в сутки. Повышение суточной дозировки – раз в неделю на 5-10 мг/кг.

Дети

При массе тела больше 25 кг: в начале лечения суточная норма – 300 мг Конвулекса (1 таблетка 300 мг, т. е. 5-15 мг/кг). Дозировку можно увеличивать раз в неделю на 5-10 мг/кг.

Монотерапия для пациентов с массой тела 20-25 кг: СН – 15-45 мг на 1 кг, суточный максимум – 50 мг на 1 кг. При комбинированном лечении – от 30 до 100 мг/кг в сутки.

При массе тела меньше 20 кг: применять иные формы Конвулекса.

Пожилой возраст, почечные дисфункции

Пациентам этих групп рекомендуется назначать сниженные дозировки препарата.

Капли

ЛС принимают в течение дня 2-3 раза – в зависимости от назначения.

Дозировка для взрослых – в среднем 600 мг, повышение проводят раз в 3 суток на 150-250 мг.

Количество ЛС при монотерапии и комбинированном лечении – идентично назначениям препарата в таблетках. Суточные дозировки для детей, пожилых пациентов и больных с патологиями почек – аналогично.

Детям капли назначают из расчета массы тела и возраста.

Инъекции

Уколы в ампулах, согласно инструкции, можно вводить только в/в. Дозировка для взрослых – 5-10 мг на 1 кг (при медленном в/в введении) или $\frac{1}{2}$ -1 мг/кг/ч (при в/в инфузии).

При переводе пациента с пероральных форм на инъекции интервал между приемами должен составлять 12 часов. Перерасчет дозировки не требуется. Как только состояние пациента стабилизируется, его вновь переводят на таблетки или капли Конвалекса, которые применяют с обязательным соблюдением 12-часового интервала после последнего укола.

Суточный максимум лекарства:

- Для детей – 30 мг/кг
- Для подростков – 25 мг/кг
- Для взрослых и пожилых пациентов – 20 мг/кг.

Перед введением лекарства его нужно предварительно развести с другими жидкостями. Растворители Конвулекса (для приготовления инъекционной формы) – изотонический р-р хлористого натрия, 5 % декстрозный раствор или раствор Рингера. Приготовленное лекарство сохраняет лечебные свойства на протяжении суток, после чего теряет годность и должно утилизироваться.

Если Конвулекс применяется с другими инъекционными препаратами, то вводить его нужно отдельным инструментом, по специальной системе вливания, с соблюдением временного интервала, определенного доктором.

При беременности и грудном вскармливании

Препарат Конвулекс в любой лекарственной форме запрещено применять во время беременности или подготовке к ней. Исключение – серьезные показания, при которых невозможна замена медикамента на иное средство. Женщинам репродуктивного возраста рекомендуется на период лечения особо внимательно относиться к выбору надежных противозачаточных средств, чтобы не допустить зачатия.

Если беременной назначаются ЛС с вальпроевой кислотой (вкл. Конвулекс), то нужно учитывать повышение рисков осложнения для плода.

Как показали клинические наблюдения, последствиями приема будущей матерью вальпроата является возникновение у детей заячьей губы и сердечных патологий. Также эпидемиологические исследования зафиксировали связь между приемом лекарства и задержкой развития. Дети рождались с такими врожденными аномалиями как дисморфия лица, неправильное развитие конечностей, анаспадия и пр. Помимо этого, имеются упоминания о гибели плода у женщин, лечившихся вальпроевой кислотой.

Исходя из этого, при назначении Конвулекса надо исходить из возможных рисков для развития ребенка и пользы терапии для женщины. Если врач сочтет необходимым использование лекарства, и лечение окажется эффективным, то прерывать его не следует, чтобы не спровоцировать усугубление заболевания и рецидивов припадков. Во время курса требуется регулярно проверять состояние плода, уровень содержания активного вещества в крови.

Недостаток фолиевой кислоты, который часто сопровождает лечение противосудорожными ЛС нужно компенсировать дополнительным приемом вещества.

Кормящим женщинам следует избегать приема Конвулекса, так как активное вещество проникает в грудное молоко и может навредить младенцу. Во время терапии этим препаратом от лактации нужно отказаться.

Противопоказания и меры предосторожности

Конвулекс запрещено принимать при:

- Индивидуальной сверхчувствительности к вальпроевой кислоте, ее производным или вспомогательным составляющим лекарства
- Дисфункциях печени
- Гепатите (остром или хроническом)
- Дисфункциях ПЖ
- Порфириновой болезни
- Диатезе геморрагическом
- Тяжелой форме тромбоцитопении
- Расстройствах обмена мочевины (вкл. наличие в личном или семейном анамнезе)
- I триместре беременности, лактации
- Терапии ЛС на основе зверобоя, мефлохина или ламотриджина
- Возрасте до 3 лет
- Детям: с весом меньше 7,5 кг (капл.), 20 кг (табл.).

Относительные противопоказания (назначение и терапия возможны при соблюдении повышенной осторожности):

- Наличие в анамнезе данных о болезнях печени и ПЖ
- Угнетение костномозгового кроветворения
- Недостаточное функционирование почек, печени
- Врожденные формы различных ферментопатий
- Задержки умственного развития у детей
- Органические поражения ГМ
- Гипопротеинемия (аномально низкий уровень белка в крови).
- Беременность (II, III тр.)
- Терапия несколькими противоэпилептическими ЛС
- Дети, подростки: множественные сопутствующие болезни, тяжелые припадки.

Перекрестные лекарственные взаимодействия

Вальпроевая кислота при совмещении с другими препаратами может усиливать не только терапевтическое действие, но и побочные эффекты иных противоэпилептиков, антидепрессантов, нейролептиков, барбитуратов, иМАО, тимолептиков, этилового спирта.

При совмещении Конвулекса с клназепамом у некоторых больных может усиливаться интенсивность эпилептического статуса абсансов.

При сочетании с барбитуратами, примидоном, АСК или непрямые коагулянтами происходит повышение плазменной концентрации последних и усиление действия.

Действие вальпроевой кислоты может снижаться под влиянием ИМАО, антидепрессантов, антипсихотиков и других ЛС для снижения судорожной активности.

При совмещении Конвулекса с ЛС, угнетающими ЦНС, происходит усиление действия последних.

Ускорение метаболизма и, соответственно, снижение эффекта вальпроевой кислоты происходит при совмещении с Фенобарбиталом, Фенитоином, Мефлохином или Карбамазепином.

При совмещении с алкоголем, спиртосодержащими ЛС происходит усиление поражающего действия на печень.

В результате совмещения с Мереопенем происходит снижение противосудорожного действия из-за уменьшения плазменного содержания вальпроевой кислоты.

Побочные эффекты

Терапия Конвулексом может сопровождаться нежелательными реакциями со стороны различных внутренних систем и органов:

- Кровеносная система: тромбозы (носит дозозависимый характер, при бессимптомном развитии необходим регулярный контроль состояния крови и заболевания, при снижении суточной дозы исчезает самостоятельно). Также возможно понижение уровня фибриногена, увеличение периода свертываемости крови. У некоторых пациентов: анемия, макроцитоз, лейкопения, крайне редко – панцитопения.
- ЦНС: тремор, повышенная сонливость, атаксия, утрата чувствительности, у некоторых больных – необратимые экстрапирамидные нарушения, когнитивные расстройства (усугубление возможно до полной деменции, после отмены ЛС проходят в течение нескольких недель или месяцев), помрачение сознания, судороги, энцефалопатия, боли головы, головокружение, ослабление памяти, нистагм, повышенная раздражительность, гиперактивность, расстройства поведения.
- Психика: расстройства умственной деятельности, помрачение сознания, галлюцинации, агрессивность, рассеянность, патологическое поведение, гиперактивность, у детей – проблемы с обучением.
- Органы слуха: глухота (временная или необратимая)
- ЖКТ: в начале терапии – тошнота, приступы рвоты, поражение десен (гиперплазия), стоматит, боли в животе, понос. Нежелательные реакции обычно проходят самостоятельно после отмены лекарства. У некоторых пациентов – панкреатит.

- Мочеполовая система: дисфункции почек, недержание мочи, затрудненное мочеиспускание.
- Кожные покровы и п/к клетчатка: поражение ногтевой пластины, ложа, гиперчувствительность, высыпание, отек Квинке, выпадение волос (зависит от дозы), экземоподобные высыпания, синдром Лайелл и/или Стивенса-Джонсона, полиморфная эритема, реакции гиперчувствительности, медикаментозное высыпание.
- Метаболические процессы: гипонатриемия (очень редко), гипераммониемия с сопутствующими неврологическими расстройствами (прогрессирование патологии возможно до комы).
- Общие нарушения: увеличение массы тела, периферические отеки.
- Реакции после в/в инъекций: проходящая тошнота, головокружение, гипотермия, после многократных уколов в одну область – некроз тканей.
- Сосудистые расстройства: склонность к кровотечениям, васкулит.
- Гепатобилиарная система: поражение печени, недостаточность (при тяжелой форме возможен летальный исход), активизация печеночных ферментов (чаще – в начале терапии).
- Репродуктивная система: аменорея, нарушение МЦ, у мужчин – расстройства сперматогенеза, бесплодие, гинекомастия, у женщин – поликистоз яичников.
- Локомоторная система, соединительная ткань: при длительном курсе – деминерализация костей, остеопения, остеопороз, подверженность переломам, СКВ, рабдомиолиз.
- Респираторная система: выпот плевральный.
- Эндокринная система: синдром неадекватной секреции АДГ, гипотиреоз, гиперандрогения (оволосение по мужскому типу, акне, вирилизм, андрогенная алопеция, повышение уровня андрогенов в организме), новообразования (добро- или злокачественные), миелодиспластический синдром.

Передозировка

Перегрузка организма высокими дозировками Конвулекса проявляется тошнотой, приступами рвоты, дыхательной недостаточностью, слабостью мышц, гипорефлексией, метаболическим ацидозом, коллапсом, комой. Также имеются данные, что передозировка может способствовать повышению внутричерепного давления, отеку головного мозга.

Для устранения передозировки проводится промывание желудка (если после приема прошло не больше 10-12 часов), назначается активированный уголь, форсированный диурез. Во время терапии требуется поддерживающая терапия, контроль жизненно важных функций. В очень тяжелых случаях назначается гемодиализ.

В основном передозировка хорошо поддается терапии, но несмотря на это, в клинической практике зафиксировано несколько случаев гибели пациентов после приема большого количества лекарства.

