Эплиронтин



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противоэпилептическое средство. По химической структуре имеет сходство с GABA, выполняющей функцию тормозного медиатора в ЦНС. Полагают, что механизм действия габапентина отличается от других противосудорожных средств, действующих через синапсы GABA (включая вальпроат, барбитураты, бензодиазепины, ингибиторы GABA-трансаминазы, ингибиторы захвата GABA, агонисты GABA и пролекарства GABA). В исследованиях in vitro показано, что габапентин характеризуется наличием нового пептидного места связывания в тканях мозга крыс, включая гиппокамп и кору головного мозга, которое может иметь отношение к противосудорожной активности габапентина и его производных. Габапентин в клинически значимых концентрациях не связывается с другими обычными препаратами и нейромедиаторными рецепторами в мозге, в т.ч. с $GABA_A$-, $GABA_B$-, бензодиазепиновыми рецепторами, с NMDA-рецепторами.

Окончательно механизм действия габапентина не установлен.

Фармакокинетика

Габапентин абсорбируется из ЖКТ. После приема внутрь C_{max} габапентина в плазме достигается через 2-3 ч. Абсолютная биодоступность составляет около 60%. Прием одновременно с пищей (в т.ч. с высоким содержанием жиров) не оказывает влияния на фармакокинетику габапентина.

Габапентин не связывается с белками плазмы и имеет V_d 57.7 л. У пациентов с эпилепсией концентрация габапентина в спинномозговой жидкости составляет 20% от соответствующих C_{ss} в плазме в конце интервала дозирования.

Габапентин выводится только почками. Признаков биотрансформации габапентина в организме человека не обнаружено. Габапентин не индуцирует оксидазы, участвующие в метаболизме лекарственных средств. Выведение препарата лучше всего описывается с помощью линейной модели. $T_{1/2}$ не зависит от дозы и составляет в среднем 5-7 ч.

Клиренс габапентина снижается у лиц пожилого возраста и у пациентов с нарушениями функции почек. Константа скорости выведения, плазменный и почечный клиренс габапентина прямо пропорциональны клиренсу креатинина.

Габапентин удаляется из плазмы при гемодиализе.

Значения концентраций габапентина в плазме у детей были сходны с взрослыми.

Показания к применению:

Лечение нейропатической боли у взрослых в возрасте старше 18 лет; монотерапия парциальных судорог со

вторичной генерализацией и без нее у взрослых и детей старше 12 лет; в качестве дополнительного средства при лечении парциальных судорог со вторичной генерализацией и без нее у взрослых и детей в возрасте 3 года и старше.

Относится к болезням:

- Нейропатия
- Судороги

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к габапентину.

Способ применения и дозы:

Индивидуальный, в зависимости от показаний и схемы лечения.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: амнезия, атаксия, спутанность сознания, нарушение координации движений, депрессия, головокружение, дизартрия, повышенная нервная возбудимость, нистагм, сонливость, нарушение мышления, тремор, судороги, амблиопия, диплопия, гиперкинезия, усиление, ослабление или отсутствие рефлексов, парестезии, тревога, враждебность, нарушение походки.

Со стороны пищеварительной системы: изменение окрашивания зубов, диарея, повышение аппетита, сухость во рту, тошнота, рвота, метеоризм, анорексия, гингивит, боли в животе, панкреатит, изменения функциональных проб печени.

Со стороны системы кроветворения: лейкопения, снижение числа лейкоцитов, тромбоцитопеническая пурпура.

Со стороны дыхательной системы: ринит, фарингит, кашель, пневмония.

Со стороны костно-мышечной системы: миалгия, артралгия, переломы костей.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: артериальная гипертензия, проявления вазодилатации.

Со стороны мочевыделительной системы: инфекции мочевых путей, недержание мочи.

Аллергические реакции: многоформная эритема, синдром Стивенса-Джонсона.

Дерматологические реакции: мацерация кожи, акне, зуд, сыпь.

Прочие: боли в спине, усталость, периферические отеки, импотенция, астения, недомогание, отечность лица, увеличение массы тела, случайная травма, астения, гриппоподобный синдром, колебания содержания глюкозы в крови, у детей - вирусная инфекция, средний отит.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Адекватных и строго контролируемых исследований по безопасности применения габапентина при беременности и в период лактации у человека не проводилось. При необходимости применения при беременности и в период лактации следует тщательно взвесить ожидаемую пользу терапии для матери и потенциальный риск для плода или грудного ребенка.

Габапентин выделяется с грудным молоком. При применении в период лактации характер действия габапентина на грудного ребенка не установлен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с антацидами уменьшается всасывание габапентина из ЖКТ.

При одновременном применении с фелбаматом возможно увеличение $T_{1/2}$ фелбамата.

При одновременном применении описан случай повышения концентрации фенитоина в плазме крови.

Особые указания и меры предосторожности:

Резкое прекращение терапии противосудорожными средствами у больных с парциальными судорогами может провоцировать судорожный статус. В случае необходимости снижать дозу, отменять габапентин или заменять его на альтернативное средство следует постепенно в течение минимум 1 недели.

Габапентин не является эффективным средством для лечения абсансных судорожных припадков.

При совместном применении с другими противосудорожными средствами были зарегистрированы ложно-положительные результаты теста определения белка в моче. Для определения белка в моче рекомендуется пользоваться более специфичным методом преципитации сульфосалициловой кислоты.

Пациентам с нарушениями функции почек, а также больным, находящимся на гемодиализе требуется коррекция режима дозирования.

Пациентам пожилого возраста может потребоваться коррекция режима дозирования габапентина в связи с тем, что у этой категории больных возможно уменьшение почечного клиренса.

Эффективность и безопасность терапии нейропатической боли у пациентов в возрасте до 18 лет не установлены.

Эффективность и безопасность монотерапии габапентином при лечении парциальных судорог у детей в возрасте до 12 лет и дополнительной терапии габапентином при лечении парциальных судорог у детей в возрасте до 3 лет не установлены.

В период лечения не допускать употребления алкоголя.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

До определения индивидуальной реакции на лечение пациент должен воздерживаться от потенциально опасных видов деятельности, связанных с необходимостью концентрации внимания и повышенной скорости психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

Пациентам с нарушениями функции почек, а также больным, находящимся на гемодиализе требуется коррекция режима дозирования.

Применение в пожилом возрасте

Пациентам пожилого возраста может потребоваться коррекция режима дозирования габапентина в связи с тем, что у этой категории больных возможно уменьшение почечного клиренса.

Применение в детском возрасте

Эффективность и безопасность терапии нейропатической боли у пациентов в возрасте до 18 лет не установлены.

Эффективность и безопасность монотерапии габапентином при лечении парциальных судорог у детей в возрасте до 12 лет и дополнительной терапии габапентином при лечении парциальных судорог у детей в возрасте до 3 лет не установлены

Источник: http://drugs.thead.ru/Eplirontin