Габагамма

Код АТХ:

- N03AX12

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Габапентин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы, 300 и 400 мг.

Блистеры по 10 капсул в картонной пачке.

Состав:

Одна капсула содержит

Активное вещество: габапентин 300 мг/400 мг

Вспомогательные вещества: лактоза, крахмал кукурузный, тальк, желатин, титана диоксид, железа оксид желтый, железа оксид красный.

Описание:

Капсулы по 300 мг: твердые желатиновые капсулы №1 желтого цвета.

Капсулы по 400 мг: твердые желатиновые капсулы №0 оранжевого цвета.

Содержимое капсулы: порошок белого цвета.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Габапентин по строению сходен с нейротрансмиттером ГАМК, однако механизм его действия отличается от других препаратов, взаимодействующих с ГАМК-рецепторами (вальпроат, барбитураты, бензодиазепины, ингибиторы ГАМК-трансаминазы, ингибиторы захвата ГАМК, агонисты ГАМК и пролекарственные формы ГАМК). Он не обладает ГАМКергическими свойствами и не влияет на захват и метаболизм ГАМК. Предварительные исследования показали, что габапентин связывается с α_2-δ-субъединицей вольтажзависимых кальциевых каналов и снижает поток ионов кальция, играющий важную роль в возникновении нейропатической боли. Другими механизмами действия габапентина при нейропатической боли являются уменьшение глутаматзависимой гибели нейронов, увеличение синтеза ГАМК, подавление высвобождения нейротрансмиттеров моноаминовой группы. Габапентин в клинически значимых концентрациях не связывается с рецепторами других препаратов или нейротрансмиттеров, включая рецепторы $ГАМК_А$, $ГАМК_Б$, бензодиазепиновые, глутамата, глицина или N-метил-d-аспартата. В отличие от фенитоина и карбамазепина габапентин не взаимодействует с натриевыми каналами *in vitro*. Габапентин частично ослаблял эффекты агониста глутаматных рецепторов N-метил-d-аспартата в некоторых тестах *in vitro*, но только в концентрации более 100 мкмоль, которая не достигается *in vivo*. Габапентин несколько уменьшает выброс моноаминовых нейротрансмиттеров *in vitro*.

Фармакокинетика

Биодоступность габапентина не пропорциональна дозе. Так, при увеличении дозы она снижается. После приема внутрь C_{max} габапентина в плазме достигается через 2–3 ч. Абсолютная биодоступность габапентина в капсулах составляет около 60%. Пища, в т.ч. с большим содержанием жиров, не оказывает влияния на фармакокинетику. Выведение габапентина из плазмы лучше всего описывается с помощью линейной модели. $T_{1/2}$ из плазмы не зависит от дозы и составляет в среднем 5–7 ч. Фармакокинетика не меняется при повторном применении; равновесные концентрации в плазме можно предсказать на основании результатов однократного приема препарата. Габапентин практически не связывается с белками плазмы (<3%) и имеет объем распределения 57,7 л. Выводится исключительно почками в неизмененном виде, метаболизму не подвергается. Препарат не индуцирует окислительные ферменты печени со смешанной функцией, участвующие в метаболизме ЛС. Клиренс габапентина из плазмы снижается у пожилых людей и больных с нарушенной функцией почек. Константа скорости выведения, клиренс из плазмы и почечный клиренс прямо пропорциональны клиренсу креатинина. Габапентин удаляется из плазмы при гемодиализе. У больных с нарушенной функцией почек и пациентов, получающих лечение гемодиализом, рекомендуется коррекция дозы.

Показания к применению:

Комплексная терапия парциальных судорог со вторичной генерализацией или без нее у взрослых и детей с 12 лет.

Болевой синдром при диабетической нейропатии;

Постгерпетическая невралгия у взрослых.

Относится к болезням:

- Невралгия
- Нейропатия

Противопоказания:

Повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата, острый панкреатит, наследственная галактозная недостаточность, лактазный дефицит, глюкозо-галактозная мальабсорбция.

Способ применения и дозы:

Внутрь, независимо от приема пищи или вместе с пищей.

Если необходимо снизить дозу, отменить препарат или заменить его на альтернативное средство, это следует делать постепенно в течение минимум одной недели.

Нейропатическая боль у взрослых

Начальная доза составляет 900 мг/сут в 3 приема равными дозами; при необходимости дозу постепенно увеличивают до максимальной — 3600 мг/сут. Лечение можно начинать сразу с дозы 900 мг/сут (по 300 мг 3 раза в сутки) или в течение первых трех дней дозу можно увеличивать постепенно до 900 мг/сут по следующей схеме: в 1-й день — 300 мг препарата 1 раз в сутки; во 2-й день — по 300 мг 2 раза в сутки; в 3-й день — по 300 мг 3 раза в сутки. Также можно использовать дозировку 400 мг для пациентов, которые имеют либо избыточную массу тела, либо рост выше среднего, по аналогии с титрованием дозировки 300 мг.

Парциальные судороги у взрослых и детей с 12 лет

Эффективная доза — от 900 до 3600 мг/сут. Терапию можно начать с дозы 300 мг 3 раза в сутки в первый день или увеличивать постепенно до 900 мг по схеме, описанной выше (см. «Нейропатическая боль у взрослых»). В последующем доза может быть увеличена до 3600 мг/сут (разделенных на 3 равных приема). Максимальный интервал между дозами при 3-кратном приеме препарата не должен превышать 12 ч во избежание возобновления судорог.

Нет необходимости контролировать концентрацию габапентина в плазме. Он может использоваться в комбинации с другими противосудорожными препаратами без учета изменения его концентрации в плазме или концентрации других противоэпилептических препаратов в сыворотке.

Подбор дозы при почечной недостаточности

Больным с почечной недостаточностью рекомендуется снижение дозы габапентина согласно таблице:

Cl креатинина, мл/мин	Суточная доза (за 3 приема), мг/сут
>80	900–3600
50–79	600–1800
30–49	300–900
15–29	150*–600
<15	150*–300

* Назначают по 300 мг через день.

Рекомендации для больных, находящихся на гемодиализе

Больным, находящимся на гемодиализе и ранее не принимавшим габапентин, препарат рекомендуется назначать в насыщающей дозе 300–400 мг, а затем применять его по 200–300 мг каждые 4 ч гемодиализа.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: симптомы вазодилатации или повышение артериального давления, сердцебиение.

Со стороны пищеварительного тракта: метеоризм, анорексия, гингивит, боль в животе, запор, заболевания зубов, диарея, диспепсия, увеличение аппетита, сухость во рту или глотке, тошнота, рвота, заболевания зубов, повышение активности печеночных трансаминаз, гепатит, желтуха, панкреатит.

Со стороны системы крови, лимфатической системы: пурпура (чаще всего ее описывают как кровоподтеки, возникавшие при физической травме), лейкопения, тромбоцитопения.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, боль в спине, повышенная ломкость костей, миалгия.

Со стороны нервной системы: головокружение; головная боль, гиперкинезы, мышечная дискинезия и дистония, хореоатетоз, усиление, ослабление или отсутствие рефлексов; дизартрия, атаксия, нистагм, парестезии, судороги, спутанность сознания, повышенная утомляемость, астения, амнезия, депрессия, нарушение мышления, враждебность, эмоциональная лабильность, бессонница, тревога, сонливость, галлюцинации.

Со стороны дыхательной системы: пневмония, бронхит, одышка, респираторные инфекции, кашель, фарингит, ринит.

Со стороны кожи и подкожной ткани: акне, зуд кожи, кожная сыпь, периферические отеки, мультиформная экссудативная эритема (в т.ч. синдром Стивена-Джонсона).

Со стороны мочеполовой системы: инфекция мочевых путей, импотенция, недержание мочи, острая почечная недостаточность.

Со стороны органов чувств: нарушение зрения, амблиопия, диплопия, шум в ушах, отит.

Прочие: лихорадка, вирусная инфекция, увеличение массы тела, лабильность уровня глюкозы в плазме крови у

больных сахарным диабетом, боль различной локализации.

Передозировка:

Симптомы: головокружение, диплопия, нарушение речи, сонливость, летаргия, диарея и усиление выраженности других побочных эффектов.

Лечение: промывание желудка, назначение активированного угля, симптоматическая терапия. Больным с тяжелой почечной недостаточностью может быть показан гемодиализ.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Отсутствуют данные о применении препарата у беременных женщин, поэтому габапентин следует использовать во время беременности только в том случае, если предполагаемая польза для матери превышает возможный риск для плода и новорожденного (пороки развития, замедление умственного и физического развития).

Габапентин выводится с грудным молоком, поэтому во время лечения следует отказаться от грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Присовместном приеме габапентина и морфина, когда морфин принимался за 2 ч до приема габапентина, наблюдалось увеличение среднего значения AUC габапентина на 44% по сравнению с монотерапией габапентином, что ассоциировалось с увеличением болевого порога (холодовый прессорный тест). Клиническое значение этого изменения не установлено, фармакокинетические характеристики морфина при этом не изменялись. Побочные эффекты морфина при совместном приеме с габапентином не отличались от таковых при приеме морфина совместно с плацебо.

Взаимодействия между габапентином и фенобарбиталом, фенитоином, вальпроевой кислотой и карбамазепином не отмечено. Фармакокинетика габапентина в равновесном состоянии одинакова у здоровых людей и пациентов, получающих другие противосудорожные средства.

Одновременное применение габапентина с пероральными контрацептивами, содержащими норэтиндрон и/или этинилэстрадиол, не сопровождалось изменениями фармакокинетики обоих компонентов.

Одновременное применение габапентина с антацидами, содержащими алюминий и магний, сопровождается снижением биодоступности габапентина примерно на 20%. Габапентин рекомендуется принимать примерно через 2 ч после приема антацида.

Пробенецид не влияет на почечную экскрецию габапентина.

Небольшое снижение почечной экскреции габапентина при одновременном приеме циметидина, вероятно, не имеет клинического значения.

Особые указания и меры предосторожности:

Хотя синдром отмены с развитием судорог при лечении габапентином не отмечен, тем не менее, резкое прекращение терапии противоэпилептическими средствами у больных с парциальными судорогами может провоцировать развитие судорог (см. «Способ применения и дозы»).

Габапентин не считается эффективным средством лечения абсанс-эпилепсии.

У пациентов, которым требуется совместная терапия морфином, может потребоваться увеличение дозы габапентина. При этом необходимо обеспечить тщательное наблюдение за пациентами на предмет развития такого признака угнетения ЦНС, как сонливость. В этом случае доза габапентина или морфина должна быть адекватно снижена (см. «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»).

При добавлении габапентина к другим противосудорожным средствам были зарегистрированы ложноположительные результаты при определении белка в моче с помощью тест-полосок Ames N-Multistix SG®. Для определения белка в моче рекомендуется пользоваться более специфичным методом преципитации сульфосалициловой кислотой.

Пациентам следует избегать управления автомобилем, а также выполнения работ, требующих быстроты психомоторных реакций.

Условия хранения:

При температуре не выше 25 °C.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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