Габапентин



Код АТХ:

- N03AX12

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Габапентин

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы твердые желатиновые, размер №0, белого цвета; содержимое капсул - белый или белый с желтоватым оттенком порошок.

	1 капс.
Габапентин	300 мг

Вспомогательные вещества: кальция стеарат - 4.2 мг, карбоксиметилкрахмал натрия (тип А) - 4.2 мг, целлюлоза микрокристаллическая - 111.6 мг.

Состав капсулы: желатин, титана диоксид.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.
15 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
50 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.
100 шт. - банки полимерные (1) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Габапентин по строению сходен с нейротрансмиттером гамма-аминомасляной кислотой (ГАМК), однако его механизм действия отличается от других препаратов, взаимодействующих с ГАМК-рецепторами (вальпроевая кислота, барбитураты, бензодиазепины, ингибиторы ГАМК-трансаминазы, ингибиторы захвата ГАМК, агонисты ГАМК и пролекарственные формы ГАМК). Он не обладает ГАМК-ергическими свойствами и не влияет за захват и метаболизм ГАМК. Предварительные исследования показали, что габапентин связывается с α_2-δ-субъединицей вольтаж-зависимых кальциевых каналов и снижает поток ионов кальция, играющий важную роль в возникновении нейропатической боли. Другими механизмами действия Габапентина при нейропатической боли являются

уменьшение глутамат-зависимой гибели нейронов, увеличение синтеза ГАМК, подавление, высвобождения нейротрансмиттеров моноаминовой группы. Габапентин в клинически значимых, концентрациях не связывается с рецепторами других распространённых препаратов или нейротрансмиттеров, включая рецепторы $ГАМК_A$, $ГАМК_B$, 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 приёма 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 V_d 57.7 л. Выводится исключительно почками в неизмененном виде, метаболизму не подвергается. Препарат не индуцирует окислительные ферменты печени со смешанной функцией, участвующие в метаболизме лекарственных средств. 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:

— монотерапия или в качестве дополнительного средства для лечения парциальных судорог со вторичной генерализацией или без нее у взрослых и детей с 12 лет;

— нейропатическая боль у взрослых (18 лет и старше).

Относится к болезням:

- Нейропатия
- Судороги

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата,

— возраст до 12 лет при парциальных судорогах.

С осторожностью: почечная недостаточность.

Способ применения и дозы:

Внутрь, проглатывая целиком, независимо от приёма пищи и обильно запивая жидкостью. 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 суточная доза составляет 900 мг, разделённая на три приёма; при необходимости дозу постепенно увеличивают до максимальной - 3600 мг/сут. Лечение можно начинать сразу с дозы 900 мг/сут (300 мг 3 раза в сут.) или в течение первых 3-х дней дозу можно увеличивать постепенно до 900 мг в сут. по следующей схеме:

1-й день: 300 мг 1 раз в сут.;

2-й день: 300 мг 2 раза в сут.;

3-й день: 300 мг 3 раза в сут.

Парциальные судороги

Взрослые и дети от 12 лет: эффективная доза - от 900 до 2400 мг/сут. Терапию можно начать с дозы 300 мг 3 раза

в сут. в первый день или увеличивать постепенно до 900 мг по схеме, описанной выше. В последующем доза может быть повышена максимально до 3600 мг/сут (разделённых на 3 равных приёма). Максимальный интервал между дозами при трёхкратном приёме препарата не должен превышать 12 ч во избежание возобновления судорог.

Подбор дозы при почечной недостаточности

Больным с почечной недостаточностью рекомендуется снижение дозы Габапентина согласно таблице:

Клиренс креатинина	Суточная доза (мг/суг)
>80	900-2400
50-79	600-1200
30-49	300-600
15-29	150*-300
<15	150*

* назначают по 300 мг через день

Рекомендации для больных, находящихся на гемодиализе

Больным, находящимся на гемодиализе, которые ранее не принимали Габапентин, рекомендуется назначатьи препарат в насыщающей дозе 300-400 мг, а затем применять его по 200-300 мг каждые 4 ч гемодиализа.

Побочное действие:

При лечении нейропатической боли

Организм в целом: случайные травмы, астения, боль в спине, гриппоподобный синдром, головная боль, инфекция, боль различной локализации, периферические отеки, увеличение массы тела;

Пищеварительный тракт: запор, диарея, сухость во рту, диспепсия, метеоризм, тошнота, рвота, боль в животе;

Нервная система: нарушение походки, амнезия, атаксия, спутанность сознания, головокружение, гипестезия, сонливость, нарушение мышления, тремор;

Дыхательная система: одышка, фарингит;

Кожа и подкожные ткани: кожная сыпь;

Органы чувств: амблиопия.

При лечении парциальных судорог

Организм в целом: боль в спине, утомление, лихорадка, головная боль, вирусная инфекция, периферические отеки, увеличение массы тела, астения,- общее недомогание, отек лица;

Сердечно-сосудистая система: симптомы вазодилатации или гипертензия;

Пищеварительный тракт: запор, заболевания зубов, диарея, диспепсия, увеличение аппетита, сухость во рту или глотке, тошнота и/или рвота, боль в животе, метеоризм, анорексия, гингивит;

Система крови, лимфатическая система: лейкопения, пурпура (чаще всего ее описывали как кровоподтеки, возникавшие при физической травме);

Костно-мышечная система: переломы, миалгии, артралгии;

Нервная система: амнезия, атаксия, спутанность сознания, нарушение координации, депрессия, дизартрия, эмоциональная лабильность, бессонница, нервозность, нистагм, сонливость, нарушение мышления, тремор, подергивание мышц, головокружение, гиперкинезы; усиление, ослабление или отсутствие рефлексов, парестезии, беспокойство, враждебность;

Дыхательная система: кашель, фарингит, ринит, пневмония;

Кожа и подкожные ткани: ссадины, окне, зуд кожи, кожная сыпь;

Органы чувств: амблиопия, диплопия, нарушение зрения;

Мочеполовая система: инфекция мочевых путей, импотенция.

Передозировка:

Симптомы: головокружение, двоение в глазах, нарушение речи, сонливость, летаргия, диарея.

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

Применение при беременности и кормлении грудью:

Отсутствуютданные о применении препарата у беременных женщин, поэтому Габапентин следует использовать во время беременности только в том случае, если предполагаемая польза для матери оправдывает возможный риск для плода.

Габапентин выводится с грудным молоком, влияние его на вскармливаемого ребенка неизвестно, поэтому во время лечения следует отказаться от грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Морфин: при совместном приеме Габапентина и морфина, когда морфин принимался за 2 ч до приема Габапентина наблюдалось увеличение среднего значения площади под фармакокинетической 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 приёме 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 норэтистерон 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 приёма антацида.

Пробенецид не влияет на почечную экскрецию Габапентина.

Небольшое снижение почечной экскреции Габапентина при одновременном приёме 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.

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 центральной нервной системы (ЦНС), как сонливость. В этом случае доза Габапентина или морфина должна быть адекватно снижена.

Лабораторные исследования

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.

При нарушениях функции почек

Применять с осторожностью при почечной недостаточности.

У больных с нарушенной функцией почек и пациентов, получающих лечение гемодиализом, рекомендуется коррекция дозы.

Применение в детском возрасте

Противопоказан в возрасте до 12 лет при парциальных судорогах. Для лечения нейропатической боли не назначать детям и подросткам младше18 лет.

Условия хранения:

Препарат хранить в сухом защищенном от света месте при температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности **-** 2 года. Не применять по окончании срока годности.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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