Гапентек



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Капсулы желтого цвета, размер №1; содержимое капсул - белый порошок.

	1 капс.
габапентин	300 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал кукурузный, тальк, желатин, железа оксид желтый.

10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.

Капсулы оранжевого цвета, размер №0; содержимое капсул - белый порошок.

	1 капс.
габапентин	400 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат, крахмал кукурузный, тальк, желатин, железа оксид желтый, железа оксид красный.

10 шт. - блистеры (5) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противосудорожный препарат. Габапентин по строению сходен с нейротрансмиттером гамма-аминобутировой кислотой (GABA), однако его механизм действия отличается от такового некоторых других препаратов, взаимодействующих с GABA-рецепторами, включая вальпроат, барбитураты, бензодиазепины, ингибиторы GABA-трансаминазы, ингибиторы захвата GABA, агонисты GABA и пролекарственные формы GABA. Он не обладает GABA-ергическими свойствами и не влияет на захват и метаболизм GABA. 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 GABA, подавление высвобождения нейротрансмиттеров моноаминовой группы. Габапентин в клинически значимых концентрациях не связывается с рецепторами других распространенных препаратов или нейротрансмиттеров, включая рецепторы $GABA_A$, $GABA_B$, бензодиазепиновые, глутамата, глицина или N-метил-D-аспартата (NMDA). В отличие от фенитоина и карбамазепина габапентин не взаимодействует с натриевыми каналами in vitro. Габапентин частично ослаблял эффекты агониста глютаматных 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 нейтротрансмиттеров in vitro.

Фармакокинетика

Всасывание

После приема внутрь C_{max} габапентина в плазме достигается через 2-3 ч. Биодоступность габапентина не пропорциональна дозе, т.к. при увеличении дозы она снижается. Абсолютная биодоступность при приеме габапентина в форме капсул составляет около 60%. Одновременный прием пищи, в т.ч. с большим содержанием жиров, не оказывает влияния на фармакокинетику.

Распределение

Фармакокинетика не меняется при повторном применении; C_{ss} в плазме можно предсказать на основании результатов однократного приема препарата. Габапентин практически не связывается с белками плазмы (<3%), V_d составляет около 57.7 л.

Метаболизм

Метаболизму не подвергается. Не индуцирует окислительные ферменты печени со смешанной функцией, участвующие в метаболизме лекарственных средств.

Выведение

Выведение габапентина из плазмы имеет линейный характер. $T_{1/2}$ не зависит от дозы и составляет в среднем 5-7 ч. Выводится исключительно с мочой в неизмененном виде.

Фармакокинетика в особых клинических случаях

Установлено, что концентрации габапентина в плазме у детей в возрасте от 4 до 12 лет в целом сходны с таковыми у взрослых.

Клиренс габапентина из плазмы снижается у пожилых людей и у пациентов с нарушенной функцией почек. Константа скорости выведения, клиренс из плазмы и почечный клиренс прямо пропорциональны КК. Габапентин удаляется из плазмы при гемодиализе.

Показания к применению:

— лечение нейропатической боли у взрослых в возрасте 18 лет и старше;

— монотерапия парциальных судорог со вторичной генерализацией и без нее у взрослых и детей в возрасте старше 12 лет;

— как дополнительное средство при лечении парциальных судорог со вторичной генерализацией и без нее у взрослых и детей в возрасте 3 лет и старше.

Относится к болезням:

- Нейропатия
- Судороги

Противопоказания:

— детский возраст до 3 лет (данная лекарственная форма не предназначена для применения у детей в возрасте до 3 лет);

— повышенная чувствительность к габапентину и другим компонентам препарата.

С осторожностью следует применять препарат при почечной недостаточности.

Способ применения и дозы:

Гапентек назначают 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.

При *нейропатической боли* **взрослым** назначают в начальной дозе 900 мг/сут в 3 приема равными дозами; при необходимости, в зависимости от эффекта, дозу постепенно увеличивают до максимальной - 3.6 г/сут. Лечение можно начинать сразу с дозы 900 мг/сут (по 300 мг 3 раза/сут) или в течение первых 3 дней дозу можно увеличивать постепенно до 900 мг/сут по следующей схеме:

1 день - 300 мг препарата 1 раз/сут;

2 день - по 300 мг 2 раза/сут;

3 день - по 300 мг 3 раза/сут.

При *парциальных судорогах* для **взрослых и детей в возрасте старше 12 лет** эффективная доза - от 900 мг до 3.6 г/сут. Терапию можно начать с дозы 300 мг 3 раза/сут в первый день или увеличивать постепенно до 900 мг по схеме, описанной выше. В последующем доза может быть повышена максимально до 3.6 г/сут (разделенных на 3 равных приема). Отмечена хорошая переносимость препарата в дозах до 4.8 г/сут. Максимальный интервал между дозами при трехкратном приеме препарата не должен превышать 12 ч во избежание возобновления судорог.

Для **детей в возрасте 3-12 лет** начальная доза препарата варьирует от 10 до 15 мг/кг/сут, кратность приема - 3 раза/сут в равных дозах, повышение до эффективной дозы проводится приблизительно в течение 3 дней. Эффективная доза у **детей в возрасте 5 лет и старше** составляет 25-35 мг/кг/сут равными дозами в 3 приема. Эффективная доза Гапентека у **детей в возрасте от 3 до 5 лет** составляет 40 мг/кг/сут равными дозами в 3 приема. Отмечена хорошая переносимость препарата в дозах до 50 мг/кг/сут при длительном применении. Максимальный интервал между приемом доз препарата не должен превышать 12 ч во избежание возобновления судорог.

Нет необходимости контролировать концентрацию габапентина в плазме. Гапентек можно применять в комбинации с другими противосудорожными препаратами без учета изменения его концентрации в плазме или концентрации других противосудорожных препаратов в сыворотке.

Пациентам с **почечной недостаточностью** рекомендуется снижение дозы Гапентека согласно таблице:

Клиренс креатинина (мл/мин)	Суточная доза (мг/сут)*
>80	900-3600
50-79	600-1800
30-49	300-900
15-29	150**-600
<15	150**-300

*Суточную дозу следует назначать в три приема.

**Назначают по 300 мг через день.

Пациентам, находящимся на гемодиализе, которые ранее не принимали Гапентек, рекомендуется назначать его в насыщающей дозе 300-400 мг, а затем применять по 200-300 мг каждые 4 ч гемодиализа.

Побочное действие:

При лечении нейропатической боли

Со стороны пищеварительной системы: запор, диарея, сухость во рту, диспепсия, метеоризм, тошнота, рвота, боль в животе.

Со стороны ЦНС: нарушение походки, амнезия, атаксия, спутанность сознания, головокружение, гипестезия, сонливость, нарушение мышления, тремор, амблиопия.

Со стороны дыхательной системы: одышка, фарингит.

Дерматологические реакции: кожная сыпь.

Прочие: случайные травмы, астения, боль в спине, гриппоподобный синдром, головная боль, инфекция, боль различной локализации, периферические отеки, повышение массы тела.

При лечении парциальных судорог

Гапентек чаще всего применяют в комбинации с другими противосудорожными средствами, поэтому установить, какой препарат вызывал побочные эффекты (если такая связь вообще имелась), было невозможно.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: симптомы вазодилатации или повышение АД.

Со стороны пищеварительной системы: метеоризм, анорексия, гингивит, боль в животе, запор, заболевания зубов, диарея, диспепсия, увеличение аппетита, сухость во рту или глотке, тошнота и/или рвота.

Со стороны системы кроветворения: пурпура (чаще всего ее описывали как кровоподтеки, возникавшие при

физической травме), лейкопения.

Со стороны костно-мышечной системы: артралгия, боль в спине, переломы, миалгия.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головокружение, гиперкинезы, усиление, ослабление или отсутствие рефлексов, парестезии, беспокойство, враждебность, амнезия, атаксия, спутанность сознания, нарушение координации, депрессия, дизартрия, эмоциональная лабильность, бессонница, нервозность, нистагм, сонливость, нарушение мышления, тремор, подергивание мышц, нарушение зрения, амблиопия, диплопия.

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

Дерматологические реакции: ссадины, акне, зуд кожи, кожная сыпь.

Со стороны мочевыделительной системы: инфекция мочевых путей.

Со стороны половой системы: импотенция.

Прочие: астения, общее недомогание, отек лица, утомление, лихорадка, головная боль, вирусная инфекция, периферические отеки, увеличение массы тела.

Указанные побочные эффекты были легко или умеренно выраженными. Отмечена дозозависимость таких явлений как головокружение, атаксия, сонливость, парестезия и нистагм.

При применении у **детей** отмечались:

Со стороны пищеварительной системы: тошнота и/или рвота, анорексия, диарея.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: сонливость, враждебность, эмоциональная лабильность, головокружение, гиперкинезия, судороги, головная боль.

Со стороны дыхательной системы: бронхит, респираторная инфекция, фарингит, ринит, кашель.

Прочие: вирусная инфекция, лихорадка, повышение массы тела, утомляемость, отит.

Побочные эффекты, при которых чаще всего требовалась *отмена препарата*, применяемого в качестве вспомогательной терапии: сонливость, атаксия, головокружение, утомляемость, тошнота и/или рвота; в качестве монотерапии - головокружение, нервозность, повышение массы тела, тошнота и/или рвота, сонливость.

Нежелательные явления, которые чаще всего приводили к *отмене препарата у детей*: сонливость, гиперкинезия и враждебность.

После резкой отмены терапии Гапентеком наиболее часто отмечались беспокойство, бессонница, тошнота, боли различной локализации и потливость.

Также имеются сообщения о развитии острой почечной недостаточности, аллергических реакций, колебаний уровня глюкозы у больных сахарным диабетом, боли в груди, повышении показателей функции печени, многоформной экссудативной эритемы (в т.ч. синдрома Стивенса-Джонсона), галлюцинаций, хореоатетоза, мышечной дискинезии и дистонии, сердцебиения, панкреатита, тромбоцитопении, шума в ушах, недержания мочи, гепатита и желтухи.

Передозировка:

Симптомы: при однократном приеме 49 г габапентина наблюдались головокружение, двоение в глазах, нарушение речи, сонливость, летаргия, легкая диарея.

Лечение: проведение симптоматической терапии. Пациентам с почечной недостаточностью тяжелой степени может быть показано проведение гемодиализа.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Гапентек следует применять при беременности только в том случае, если предполагаемая польза для матери оправдывает возможный риск для плода, т.к. данные о применении препарата у беременных женщин отсутствуют.

Габапентин выделяется с грудным молоком, влияние его на грудного ребенка неизвестно, поэтому в период лактации Гапентек следует назначать только в том случае, если польза для матери явно оправдывает риск для младенца.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении Гапентека и морфина (когда морфин принимали за 2 ч до приема габапентина) наблюдалось увеличение среднего значения AUC габапентина на 44% по сравнению с монотерапией Гапентеком, что сопровождалось 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 Гапентеком не отличались от таковых при приеме морфина совместно с плацебо.

Взаимодействия между Гапентеком 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 Гапентека с пероральными контрацептивами, содержащими норэтиндрон и/или этинилэстрадиол, не сопровождалось изменениями фармакокинетики обоих компонентов.

Одновременное применение Гапентека с антацидами, содержащими алюминий и магний, сопровождается снижением биодоступности габапентина примерно на 20%. Гапентек 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 при применении Гапентека не отмечено синдрома отмены с развитием судорог, тем не менее резкое прекращение терапии противосудорожными средствами у больных с парциальными судорогами может провоцировать развитие судорог.

Гапентек в целом не считается эффективным средством лечения абсанс-эпилепсии.

При совместной терапии с морфином может потребоваться увеличение дозы Гапентека. При этом необходимо обеспечить тщательное наблюдение за пациентами на предмет развития такого признака угнетения ЦНС, как сонливость. В этом случае дозу Гапентека или морфина следует адекватно уменьшить.

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

Использование в педиатрии

Эффективность и безопасность препарата при лечении нейропатической боли у **детей и подростков в возрасте до 18 лет** не установлены.

Эффективность и безопасность препарата при монотерапии парциальных судорог со вторичной генерализацией и без нее у **детей в возрасте до 12 лет** не установлены.

Безопасность и эффективность препарата при применении его в качестве дополнительного средства при лечении парциальных судорог со вторичной генерализацией у **детей в возрасте до 3 лет** не установлены.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Пациентам следует рекомендовать не приступать к выполнению работы, требующей повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций до тех пор, пока не будет определена индивидуальная реакция пациента на прием препарата.

При нарушениях функции почек

С осторожностью следует применять препарат при почечной недостаточности.

Пациентам с **почечной недостаточностью** рекомендуется снижение дозы Гапентека согласно таблице:

Клиренс креатинина (мл/мин)	Суточная доза (мг/сут)*
>80	900-3600
50-79	600-1800
30-49	300-900

15-29	150**-600
<15	150**-300

*Суточную дозу следует назначать в три приема.

**Назначают по 300 мг через день.

Пациентам, находящимся на гемодиализе, которые ранее не принимали Гапентек, рекомендуется назначать его в насыщающей дозе 300-400 мг, а затем применять по 200-300 мг каждые 4 ч гемодиализа.

Применение в детском возрасте

Эффективность и безопасность препарата при лечении нейропатической боли у **детей и подростков в возрасте до 18 лет** не установлены.

Эффективность и безопасность препарата при монотерапии парциальных судорог со вторичной генерализацией и без нее у **детей в возрасте до 12 лет** не установлены.

Безопасность и эффективность препарата при применении его в качестве дополнительного средства при лечении парциальных судорог со вторичной генерализацией у **детей в возрасте до 3 лет** не установлены.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°С.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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