Конвалис



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 размер №0, желтого цвета; содержимое капсул - кристаллический порошок белого или белого со слегка желтоватым оттенком цвета.

	1 капс.
габапентин	300 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 0.066 г, крахмал кукурузный прежелатинизированный - 0.03 г, тальк - 0.003 г, магния стеарат - 0.001 г.

Состав желатиновых капсул: титана диоксид - 2%, краситель железа оксид желтый - 0.6286%, желатин - до 100%.

10 шт. - упаковки ячейковые контурные (3) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (5) - пачки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Противосудорожный препарат. Габапентин по строению сходен с нейротрансмиттером GABA однако механизм его действия отличается от такового некоторых других препаратов, взаимодействующих с GABA-рецепторами, включая вальпроевую кислоту, 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 свидетельствуют о том, что габапентин связывается с α_2-δ-субъединицей потенциал-зависимых кальциевых каналов и подавляет поток ионов кальция, играющий важную роль в возникновении нейропатической боли. Другими механизмами, участвующими в действии 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 другими рецепторами, включая рецепторы $GABA_A$, $GABA_B$, 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 глютаматных рецепторов N-метил-d-аспартата в некоторых тестах in vitro, но только в концентрации более 100 мкмоль/л, которая не достигается in vivo. Габапентин несколько уменьшает выброс моноаминовых нейротрансмиттеров in vitro.

Фармакокинетика

Всасывание и распределение

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

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%) и имеет V_d 57.7 л.

Метаболизм и выведение

$T_{1/2}$ из плазмы не зависит от дозы и составляет в среднем 5-7 ч. 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 пациентов пожилого возраста и пациентов с нарушением функции почек. Константа скорости выведения, клиренс из плазмы и почечный клиренс прямо пропорциональны КК. Габапентин удаляется из плазмы при гемодиализе. У пациентов с нарушением функции почек и пациентов, находящихся на гемодиализе, рекомендуется коррекция дозы.

Показания к применению:

— эпилепсия: у взрослых и детей старше 12 лет - в качестве монотерапии или в составе комбинированной терапии для лечения парциальных эпилептических приступов, в т.ч. протекающих с вторичной генерализацией;

— для лечения нейропатической боли у взрослых.

Относится к болезням:

- Нейропатия
- Эпилепсия

Противопоказания:

— острый панкреатит;

— детский возраст до 12 лет;

— дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;

— повышенная чувствительность к лекарственному препарату и/или его компонентам.

С осторожностью следует назначать при почечной недостаточности.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь, независимо от приема пищи, не разжевывая и запивая необходимым количеством жидкости.

Монотерапия и использование Конвалиса в качестве вспомогательного средства для лечения парциальных эпилептических приступов у детей старше 12 лет и взрослых

Лечение начинают с дозы 300 мг 1 раз/сут и постепенно увеличивают до 900 мг/сут (первый день - 300 мг 1 раз/сут, второй - по 300 мг 2 раза/сут, третий - по 300 мг 3 раза/сут). В последующем доза может быть увеличена. Обычно доза Конвалиса составляет 900-1200 мг/сут. Максимальная доза - 3600 мг/сут, разделенная на три равных приема

через 8 ч. Максимальный интервал между приемом доз препарата не должен превышать 12 ч во избежание возобновления судорог.

Нейропатическая боль у взрослых

Лечение начинают с дозы 300 мг в первый день, затем: 600 мг (по 300 мг 2 раза) на второй день, 900 мг (по 300 мг 3 раза) - на третий день. При интенсивной боли Конвалис можно применять с первого дня по 300 мг 3 раза/сут. В зависимости от эффекта дозу можно постепенно увеличивать, но не более 3600 мг/сут.

У **пациентов с нарушением функции почек** (**при КК 50-79 мл/мин)** суточная доза препарата составляет 600-1800 мг/сут, **при КК 30-49 мл/мин** - 300-900 мг/сут, **при КК 15-29 мл/мин** - 300-600 мг/сут, **при КК менее 15 мл/мин** - 300 мг через день или ежедневно.

У **пациентов, находящихся на гемодиализе**, начальная доза Конвалиса составляет 300 мг. Дополнительная постгемодиализная доза составляет 300 мг после каждого 4-часового сеанса гемодиализа. В дни, когда диализ не проводится, Конвалис не применяют.

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.

Со стороны дыхательной системы: одышка, фарингит.

Со стороны кожных покровов: кожная сыпь.

Со стороны органов чувств: амблиопия.

Прочие: астенический синдром, гриппоподобный синдром, головная боль, инфекционные заболевания, боль различной локализации, периферические отеки, увеличение массы тела.

При лечении парциальных судорог

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

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

Со стороны системы крови: пурпура (чаще всего ее описывали как кровоподтеки, возникающие при физической травме), лейкопения.

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

Со стороны ЦНС: головокружение, гиперкинезы; усиление, ослабление или отсутствие сухожильных рефлексов, парестезия, беспокойство, враждебность, амнезия, атаксия, спутанность сознания, нарушение координации движений, депрессия, дизартрия, эмоциональная лабильность, бессонница, нистагм, сонливость, нарушение мышления, тремор, фибрилляции мышц.

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

Со стороны кожных покровов: ссадины, акне, зуд кожи, кожная сыпь.

Со стороны мочевыделительной системы: инфекция мочевых путей.

Со стороны половой системы: импотенция.

Со стороны органов чувств: нарушение зрения, амблиопия, диплопия.

Прочие: астенический синдром, отек лица, утомление, лихорадка, головная боль, вирусная инфекция, периферические отеки, увеличение массы тела.

При сравнении переносимости препарата в дозах 300 и 3600 мг/сут отмечена дозозависимость таких явлений, как головокружение, атаксия, сонливость, парестезия и нистагм.

Пострегистрационный опыт применения

Возможные случаи внезапной необъяснимой смерти не связаны с лечением габапентином. В процессе лечения габапентином могут наблюдаться следующие нежелательные явления: различные аллергические реакции, острая почечная недостаточность, нарушение функции печени, поджелудочной железы, увеличение объема молочных желез, гинекомастия, галлюцинации, двигательные расстройства (миоклонус, дискенизия, дистония), сердцебиение, тромбоцитопения, шум в ушах, расстройства мочеиспускания.

После резкой отмены терапии габапентином наиболее часто отмечались следующие побочные эффекты: беспокойство, бессонница, тошнота, боли различной локализации и потливость.

Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются или отмечаются другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, необходимо сообщить об этом врачу.

Передозировка:

Симптомы: при однократном приеме 49 г габапентина наблюдались головокружение, диплопия, нарушение речи, сонливость, дизартрия, диарея. Летальная доза габапентина при приеме внутрь установлена у мышей и крыс, получавших препарат в дозах 8000 мг/кг. Признаки острой токсичности у животных включали в себя атаксию, затрудненное дыхание, птоз, гипоактивностъ или возбуждение.

Лечение: проведение симптоматической терапии. Больным с тяжелой почечной недостаточностью может быть показан гемодиализ.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Данные о применении препарата у беременных женщин отсутствуют, поэтому Конвалис следует использовать при беременности только в том случае, если предполагаемая польза для матери превышает возможный риск для плода.

Препарат выводится с грудным молоком, и его влияние на ребенка, находящегося на грудном вскармливании, неизвестно. Поэтому при необходимости применения препарата следует отказаться от кормления грудью.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном приеме габапентина и морфина, когда морфин принимался за 2 ч до приема габапептина, 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 препараты.

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

Антацидные препараты, содержащие алюминий или магний, снижают биодоступность габапентина примерно на 20%. В связи с этим препарат следует принимать не ранее чем через 2 ч после приема антацидов.

Пиметидин незначительно снижает почечную экскрецию габапентина.

Этанол и средства, действующие на ЦНС, могут усиливать побочные эффекты габапентина со стороны ЦНС.

При одновременном назначении напроксена с габапентином увеличивается абсорбция последнего, при этом габапентин не влияет па фармакокинетические параметры напроксена.

Одновременное применение габапентина с гидрокодоном приводит к уменьшению фармакокинетических параметров (C_{max} и AUC) гидрокодона и увеличению AUC габапентина.

Особые указания и меры предосторожности:

При анализе мочи на общий белок с применением тест-системы Ames N-Multistix SG возможен ложноположительный результат. Необходимо подтвердить полученный результат с помощью другого метода анализа.

У больных сахарным диабетом иногда возникает необходимость в изменении дозы гипогликемических препаратов.

При появлении признаков острого панкреатита лечение препаратом необходимо прекратить.

Отменять препарат или заменять его альтернативным средством следует постепенно, как минимум в течение недели. Резкое прекращение терапии противосудорожными средствами у больных с парциальными судорогами может провоцировать развитие судорог.

Возможен повышенный риск возникновения суицидов и суицидальных мыслей. С целью раннего выявления нарушений поведения, которые могут быть предвестниками суицидальных мыслей и поступков, рекомендуется контролировать психическое состояние больных.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо воздерживаться от вождения транспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

С осторожностью следует назначать препарат при почечной недостаточности.

У **пациентов с нарушением функции почек** (**при КК 50-79 мл/мин)** суточная доза препарата составляет 600-1800 мг/сут, **при КК 30-49 мл/мин** - 300-900 мг/сут, **при КК 15-29 мл/мин** - 300-600 мг/сут, **при КК менее 15 мл/мин** - 300 мг через день или ежедневно.

У **пациентов, находящихся на гемодиализе**, начальная доза Конвалиса составляет 300 мг. Дополнительная постгемодиализная доза составляет 300 мг после каждого 4-часового сеанса гемодиализа. В дни, когда диализ не проводится, Конвалис не применяют.

Применение в детском возрасте

Применение препарата противопоказано у детей в возрасте до 12 лет.

Условия хранения:

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

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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