

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату

ГАБАЛЕПТ
(GABALEPT)

Склад:

діюча речовина: 1 капсула містить габапентину 300 мг;

допоміжні речовини: крохмаль кукурудзяний, гіпромелоза, тальк, кремнію діоксид колоїдний безводний, кармоїзин (Е 122), понсо 4R (Е 124), титану діоксид (Е 171), метилпарабен (Е 218), пропілпарабен (Е 216), натрію лаурилсульфат, вода очищена.

Лікарська форма. Капсули.

Фармакотерапевтична група. Протиепілептичні засоби.

Код АТС N03A X12.

Клінічні характеристики.

Показання.

Епілепсія. Як монотерапія при лікуванні парціальних судомних нападів з вторинною генералізацією або без неї у дорослих та дітей віком від 12 років.

Як додаткова терапія при лікуванні парціальних судомних нападів з вторинною генералізацією або без неї у дорослих і дітей віком від 6 років.

Лікування периферичного неврологічного болю при постгерпетичній невралгії або діабетичній невралгії у дорослих.

Протипоказання.

Гіперчутливість до габапентину або до будь-якого компонента препарату.

Спосіб застосування та дози.

Внутрішньо, незалежно від прийому їжі, запиваючи достатньою кількістю води.

На самому початку лікування дорослим і дітям віком від 12 років рекомендується схема титрування, наведена у таблиці 1.

Таблиця 1.

Схема застосування препарату – початкове титрування		
1-й день	2-й день	3-й день
300 мг 1 раз на добу	300 мг 2 рази на добу	300 мг 3 рази на добу

Епілепсія.

Хворі на епілепсію потребують тривалої терапії. Дозування визначати відповідно до індивідуальної переносимості та ефективності препарату. Коли, на думку лікаря, виникає

необхідність у зменшенні дози, припиненні прийому препарату або його заміни альтернативним засобом, це необхідно проводити поступово впродовж мінімум одного тижня.

Дорослі та діти віком від 12 років.

Ефективна доза Габалепту становить 900-3600 мг на добу (розподілена на 3 прийоми).

Лікування може бути розпочато з титрування дози, як це описано у таблиці 1, або з призначення по 300 мг 3 рази на добу в 1-й день. Далі, залежно від індивідуальної відповіді пацієнта на лікування та переносимість препарату, дозу можна поступово збільшувати по 300 мг на добу кожні 2-3 дні до максимальної дози 3600 мг на добу. Для деяких пацієнтів може знадобитися більш повільне титрування дози габапентину.

Мінімальний період до досягнення дози 1800 мг на добу відповідає одному тижню, дози 2400 мг на добу – 2 тижні, дози 3600 мг на добу – загалом 3 тижні. Максимальна перерва між прийомами препарату не має перевищувати 12 годин для попередження розвитку судом.

Діти віком від 6 до 12 років.

Лікування розпочинати з дози 10-15 мг/кг/добу. Ефективна доза становить 25-35 мг/кг/добу, досягається шляхом титрування протягом приблизно 3 днів. Дозу ділити на три прийоми, максимальна перерва між прийомами препарату не більше 12 годин.

Невропатичний біль у дорослих.

Лікування може бути розпочато або з титрування дози, як описано у таблиці 1, або з призначення початкової дози 900 мг на добу, розподіленої на три прийоми. Далі, залежно від індивідуальної відповіді пацієнта на лікування та переносимість препарату, дозу можна поступово збільшувати по 300 мг на добу кожні 2-3 дні до максимальної дози 3600 мг на добу.

Для деяких пацієнтів може знадобитися повільніше титрування дози габапентину.

Мінімальний період досягнення дози 1800 мг на добу відповідає 1 тижню, дози 2400 мг на добу – необхідно 2 тижні, дози 3600 мг на добу – загалом 3 тижні. Максимальна перерва між прийомами препарату не має перевищувати 12 годин.

Безпека терапії тривалістю довше 5 місяців при лікуванні периферичного невропатичного болю не вивчалась. При необхідності застосування габапентину при лікуванні периферичного невропатичного болю більше 5 місяців лікар має оцінити клінічний стан пацієнта і визначити необхідність додаткового лікування.

У випадку пропуску чергової дози препарату пропущену дозу необхідно прийняти з умови, що прийом наступної дози буде не раніше ніж через 4 години. В іншому випадку пропущену дозу приймати не слід. Для пацієнтів з ослабленим загальним станом організму, з низькою масою тіла, після трансплантації органів дозу габапентину слід титрувати повільніше, шляхом застосування лікарської форми меншій дозі або збільшенням інтервалу між підвищенням дози.

Пацієнти літнього віку (старше 65 років).

Для пацієнтів літнього віку може знадобитися зміна дозування у зв'язку з віковим зниженням функції нирок (див. таблицю 2).

Пацієнти з порушенням функції нирок.

У пацієнтів з порушенням функції нирок або тих, які знаходяться на гемодіалізі рекомендується корегування дози, як описано у таблиці 2.

Таблиця 2.

Дози габапентину у дорослих залежно від функції нирок	
Кліренс креатиніну (мл/хв)	Загальна добова доза ^a (мг/добу)
>80	900-3600
50-79	600-1800
30-49	300-900
15-29	150 ^b -600
15 ^c	150 ^b -300

^a Загальну добову дозу слід розподілити на три прийоми. Знижені дози застосовувати для пацієнтів з порушенням функції нирок (кліренс креатиніну <79 мл/хв).

^b Призначається у дозі 300 мг через день.

с У пацієнтів з кліренсом креатиніну <15мл/хв добову дозу необхідно зменшити пропорційно до кліренсу креатиніну (наприклад при кліренсі креатиніну 7,5 мл/хв необхідно застосовувати половину добової дози, яку приймає пацієнт з кліренсом креатиніну 15 мл/хв).

Пацієнти, які знаходяться на гемодіалізі.

Пацієнтам з анурією, які знаходяться на гемодіалізі і які раніше ніколи не отримували габапентин, рекомендується застосовувати дози насичення від 300 до 400 мг, далі 200-300 мг габапентину після кожного 4-годинного сеансу гемодіалізу. У дні, коли діаліз не проводиться, габапентин приймати не можна.

Пацієнтам з порушенням функції нирок, які знаходяться на гемодіалізі, підтримують дозу габапентину призначати відповідно до рекомендацій, викладених у таблиці 2.

Додатково до підтримуючої дози рекомендується призначати 200-300 мг препарату після кожного 4-годинного сеансу гемодіалізу.

Побічні реакції.

Інфекції та інвазії: вірусні інфекції; пневмонія, респіраторні інфекції, інфекції сечовидільної системи, отит середнього вуха.

З боку крові та лімфи: лейкопенія, тромбоцитопенія.

З боку імунної системи: алергічні реакції (включаючи кропив'янку), лімфаденопатія, еозинофілія.

З боку метаболічних процесів: збільшення маси тіла, коливання рівня глюкози у хворих на цукровий діабет. Психічні порушення: ворожість, сплутаність свідомості, емоційна лабільність, депресія, тривожність, підвищена нервова збудливість, розлади мислення, галюцинації.

З боку нервової системи: сонливість, запаморочення, атаксія, судороги, гіперкінезія, дизартрія, амнезія, тремор, безсоння, головний біль, парестезії, гіпестезія, порушення координації, ністагм, посилення, послаблення або відсутність рефлексів, гіпокінезія, інші рухові порушення (хореоатетоз, дискінезія, дистонія).

З боку органів зору: диплопія, амбліопія.

З боку органів слуху: вертиго, дзвін у вухах.

З боку серцево-судинної системи: артеріальна гіпертензія, симптоми вазодилатації, відчуття серцебиття.

З боку дихальної системи: риніт, фарингіт, диспное, бронхіт, кашель.

З боку травної системи: нудота, блювання, біль у животі, гінгівіт, запори або діарея, сухість у роті, анорексія, підвищення апетиту, диспепсія, дентальні зміни, метеоризм, підвищення активності печінкових трансаміназ, панкреатит, гепатит, жовтяниця, підвищення рівня білірубіну.

З боку шкіри і підшкірної клітковини: набряк обличчя, пурпура, шкірний висип, свербіж, акне, мультиформна ексудативна еритема, синдром Стівенса-Джонсона, ангіоневротичний набряк, алопеція.

З боку опорно-рухового апарату: міалгія, артралгія, біль у спині, посмикування язів, міоклонус.

З боку сечовидільної системи: нетримання сечі, гостра ниркова недостатність.

З боку репродуктивної системи та молочних залоз: імпотенція, гіпертрофія молочних залоз, гінекомастія.

Загальні порушення: підвищена втомлюваність, гарячка, периферичні набряки, порушення ходи, астенія, нездужання, грипоподібні симптоми, генералізовані набряки, реакція відміни (непокій, безсоння, болі, нудота, пітливість), біль у грудях.

Інше: випадки травм, переломи.

Повідомлялося про міопатію з підвищеними рівнями креатиніну у пацієнтів з нирковою недостатністю останньої стадії, які перебувають на гемодіалізі.

Передозування.

Відомі випадки передозування габапентину при разовому прийомі препарату у дозі до 49 г. При цьому, незважаючи на розвиток деяких симптомів (запаморочення, діарея, двоїння в очах, порушення мовлення, сонливість, летаргія), випадків загрозливого стану для хворого не було, стан нормалізувався після симптоматичної терапії. Знижене всмоктування габапентину у високих дозах зменшує його токсичність при передозуванні. Передозування габапентином у комбінації з депресантами ЦНС може призвести до коми. Залежно від клінічної картини можна провести гемодіаліз, хоча накопичений досвід показує, що цьому немає необхідності. Гемодіаліз може бути показаний пацієнтам з тяжкими порушеннями функції нирок.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Габалепт не можна застосовувати у період вагітності; при вирішенні питання щодо призначення препарату у період вагітності необхідно оцінити очікувану користь для матері та можливий ризик для плода.

Габалептин проникає у грудне молоко. У зв'язку з цим необхідно припинити грудне годування на період лікування Габалептом.

Діти.

Габалепт показаний лише для лікування дітей з епілепсією: як додаткова терапія для дітей віком від 6 років, як монотерапія для дітей віком від 12 років.

Особливості застосування.

При появі симптомів панкреатиту прийом препарату необхідно припинити.

Різка припинення терапії протиепілептичними препаратами може спровокувати збільшення частоти нападів.

Як і у випадку з іншими протиепілептичними препаратами, у деяких пацієнтів може спостерігатися збільшення частоти або поява нових видів нападів при застосуванні габалептину. Спроби відмови від супутньої терапії протиепілептичними препаратами при лікуванні пацієнтів з рефрактерною патологією, які отримують більше одного протиепілептичного препарату, з метою перейти на монотерапію габалептином, рідко є успішними. Препарат неефективний для лікування абсансних епілептичних нападів і може навіть погіршити їх перебіг у деяких пацієнтів. Тому пацієнтам зі змішаними нападами, включаючи абсанси, габалептин слід призначати з обережністю.

Слід уважно спостерігати за появою ознак суїцидальних намірів та поведінки у пацієнтів, які приймають протиепілептичні засоби і у разі необхідності проводити відповідне лікування.

У випадку порушення функції нирок дозу габалептину підбирають відповідно до кліренсу креатиніну.

Системних досліджень щодо застосування габалептину пацієнтам віком від 65 років не проводилося, однак існуючі дані вказують на те, що у пацієнтів літнього віку можуть частіше виникати сонливість, периферичні набряки, астенія.

Ефекти тривалого (довше 36 тижнів) лікування габалептином на здатність до навчання, інтелекті розвитку у дітей та підлітків вивчені недостатньо. Тому користь від пролонгованої терапії необхідно ретельно зважити.

Лабораторні тести.

При проведенні кількісного визначення загального білка в сечі за допомогою експрес-тестів можуть бути отримані помилкові позитивні результати. Тому рекомендується перевіряти такі результати експрес-тестів за допомогою методів, що ґрунтуються на іншому аналітичному принципі, таких як біуретова проба, турбідиметричний метод або метод зв'язування фарбника, чи використовувати ці методи на самому початку.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.

Габалептин діє на центральну нервову систему і може спричинити сонливість, запаморочення та інші схожі симптоми. Це може виявитися потенційно небезпечним для пацієнтів, які керують автотранспортом або виконують інші потенційно небезпечні роботи, що потребують особливої уваги і швидкості психомоторних реакцій. Побічні дії частіше виникають на початку лікування та при збільшенні дози.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Оскільки габалептин практично не зв'язується з білками сироватки крові, не метаболізується, не індукує окиснювальні ферменти печінки, імовірність його взаємодії з іншими лікарськими засобами дуже низька. Можливе одночасне застосування Габалепту з іншими протиепілептичними препаратами (фенітоїн, карбамазепін, вальпроати, фенобарбітал), взаємодія між ними не виявлена.

Габалепт не впливає на ефективність пероральних контрацептивних препаратів, що містять норетиндрон або етинілестрадіол.

При одночасному застосуванні з антацидними засобами, що містять алюміній і магній біодоступність габапентину зменшується приблизно на 24%. У зв'язку з цим рекомендується приймати Габалепт не раніше ніж через 2 години після прийому антацидних засобів.

При сумісному застосуванні з морфіном концентрація габапентину у крові може підвищуватися. Необхідний ретельний нагляд за станом пацієнта для виявлення проявів пригнічення центральної нервової системи, таких як сонливість. При цьому дозу морфіну або габапентину необхідно належним чином скоригувати.

Пробенецид не впливає на екскрецію габапентину нирками.

При сумісному застосуванні з циметидином кліренс габапентину незначною мірою знижується, однак це не має клінічної значущості.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Габапентин – 1-(амінометил)-циклогексаноцтова кислота – є циклічним аналогом ГАМК, який здатний проходити через гематоенцефалічний бар'єр. Протисудомна активність габапентину показана на багатьох експериментальних моделях судомних станів. Остаточний механізм протисудомної дії габапентину на сьогодні залишається нез'ясованим. Незважаючи на те, що габапентин структурно подібний до ГАМК, він не є ГАМК-міметиком, оскільки не зв'язується ні з ГАМК_A, ні з ГАМК_B-рецепторами, не інгібує зворотне захоплення ГАМК чи деградацію ГАМК за участю ГАМК-трансамінази. Він не взаємодіє з потенціал-залежними натрієвими каналами, з бензодіазепіновими рецепторами, з центрами зв'язування збуджуючих нейротрансмітерів, не впливає на катехоламінові, ацетилхолінові чи опіатні рецептори. Таким чином, габапентин має абсолютно новий механізм дії, зв'язуючись з високоспецифічними центрами у ЦНС, які мають білкову природу, локалізовані переважно у неокортексі і не мають спорідненості з іншими протиепілептичними засобами.

Габапентин також ефективно купірує невропатичний біль.

Фармакокінетика.

Абсорбція – швидка. Біодоступність становить приблизно 60%. Біодоступність є пропорційна до дози: при збільшенні дози зменшується і становить при дозі 300 мг – 60%, а при дозі 1600 мг – 30%. Їжа не впливає на фармакокінетику габапентину. Час досягнення максимальної концентрації становить 2-3 години. Концентрація препарату у плазмі крові пропорційна до дози. Фармакокінетика не змінюється при повторному прийомі. Проходить через ГЕБ: у хворих на епілепсію концентрація габапентину у спинномозковій рідині становить приблизно 20% від відповідної рівноважної концентрації препарату у плазмі крові. Потрапляє у грудне молоко. Габапентин не зв'язується з білками плазми крові, об'єм розподілу становить 57,7 літра. Габапентин практично не метаболізується. Не індукує окиснювальних ферментів печінки. Виводиться через нирки у незміненому вигляді. Час напіввиведення не залежить від дози і у середньому становить 5-7 годин у пацієнтів з нормальною видільною функцією нирок. У пацієнтів літнього віку і у пацієнтів з порушенням функції нирок швидкість виведення знижується прямо пропорційно до рівня кліренсу креатиніну. Виводиться з крові при гемодіалізі. Рекомендується коригування дози пацієнтам з порушенням функції нирок і пацієнтам, які перебувають на гемодіалізі.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: капсули темно-червоного кольору, розміром «1», що містять порошок білого кольору.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. Зберігати при температурі не вище 25 °С у сухому, недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 10 капсул у блістері; по 3 блістери в коробці з картону.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. Мікро Лабс Лімітед/

Micro Labs Limited

Місцезнаходження.

92, Сіпкот, Хосур – 635 126, Індія/

92, Sipcot, Hosur – 635 126, India