

**ІНСТРУКЦІЯ**  
**для медичного застосування препарату**  
**ГАБАПЕНТИН**  
**(GABAPENTIN)**

**Склад:**

*діюча речовина:* габапентин, 1-(амінометил)циклогексаноцтова кислота;  
1 капсула містить 300 мг габапентину;  
*допоміжні речовини:* лактоза безводна, крохмаль кукурудзяний, тальк;  
*склад капсули:* желатин, титану діоксид Е 171.

**Лікарська форма.** Капсули тверді.

**Фармакотерапевтична група.**

Засоби, що діють на нервову систему. Протиепілептичні засоби. Габапентин.  
Код АТС N03A X12.

**Клінічні характеристики.**

**Показання.**

- Як додаткове лікування при парціальних епілептичних нападах з або без вторинних генералізованих нападів у дорослих та дітей віком від 12 років, які не реагують на стандартні антиепілептичні засоби.
- Супутній біль при діабетичній нейропатії та постгерпетичній невралгії.

**Протипоказання.**

- Підвищена чутливість до компонентів препарату.
- Гострий панкреатит.
- Спадкова непереносимість галактози, дефіцит лактази або порушення всмоктування глюкози і галактози.
- Діти віком до 12 років.
- Вагітність та період годування груддю.

**Спосіб застосування та дози.**

Дози призначає лікар залежно від індивідуальної переносимості та ефективності препарату.

**Епілепсія**

Ефективна доза становить 900 - 3600 мг габапентину на добу.

*Дорослі та діти віком від 12 років.*

Лікування починається з прийому 300 мг препарату. Збільшення дози до досягнення ефективної дози може бути проведено швидко, протягом кількох діб, коли в перший день приймають 300 мг 1 раз на добу, на другий день – по 300 мг 2 рази на добу і на третій день – по 300 мг 3 рази на добу згідно з такою схемою лікування:

Дні прийому препарату	Ранкова доза	Денна доза	Вечірня доза
1-й день (300 мг)	-	-	300 мг
2-й день (600 мг)	300 мг	-	300 мг
3-й день (900 мг)	300 мг	300 мг	300 мг

Як альтернативний варіант можливе початкове дозування по 300 мг габапентину 3 рази на добу (відповідно 900 мг габапентину на добу).

Після цього добова доза може бути збільшена до 1200 мг з поділом на 3 разові дози і, за необхідності, у подальшому може збільшуватися на 300 мг на добу з поділом на 3 разові дози до максимальної добової дози – 3600 мг.

Якщо необхідна вища доза і збільшення дози відбувається швидко, зростає ризик появи запаморочення під час фази титрування.

Іншим пацієнтам може знадобитися більш повільне титрування доз габапентину. Мінімальний термін досягнення дози 1800 мг на добу становить 1 тиждень, для досягнення 2400 мг на добу необхідно 2 тижні, а для досягнення 3600 мг на добу необхідний загальний термін – 3 тижні.

Проміжок часу між прийомом вечірньої дози та наступної ранкової дози повинен становити не більше 12 годин, щоб уникнути появи нових нападів.

#### Супутній біль при діабетичній нейропатії і постгерпетичній невралгії

Зазвичай доза становить 1800 - 2400 мг на добу. У деяких випадках може бути необхідним збільшення дози до максимальної – 3600 мг на добу.

#### *Дорослі.*

Лікування починається з прийому 300 мг препарату. Збільшення дози до досягнення ефективної дози може бути проведено швидко, протягом кількох діб, коли в перший день приймають 300 мг 1 раз на добу, на другий день – по 300 мг 2 рази на добу і на третій день – по 300 мг 3 рази на добу згідно з такою схемою лікування:

Дні прийому препарату	Ранкова доза	Денна доза	Вечірня доза
1-й день (300 мг)	-	-	300 мг
2-й день (600 мг)	300 мг	-	300 мг
3-й день (900 мг)	300 мг	300 мг	300 мг

Після цього доза протягом тижня збільшується до 1800 мг на добу з поділом на 3 разові дози. Наступного тижня, за необхідності, доза може збільшуватися до 2400 мг на добу з поділом на 3 разові дози. За необхідності можливе подальше збільшення дози на 300 мг на добу з поділом на 3 разові дози для досягнення максимальної дози, що становить 3600 мг на добу.

Збільшення дози до отримання підтримуючої повинно здійснюватися повільно з метою зменшення ризику побічної дії. Проміжок часу між прийняттям вечірньої дози та наступної ранкової дози повинен становити не більше 12 годин.

#### *Пацієнти літнього віку та пацієнти з порушеннями функції нирок.*

Пацієнтам з порушеннями функції нирок та пацієнтам літнього віку, у яких знижена функція нирок знижена рекомендується менша доза. Таким пацієнтам необхідно підбирати дози індивідуально.

Дози габапентину для дорослих залежно від функції нирок:

Кліренс креатиніну (мл/хв)	Сумарна добова доза (мг)*
≥ 80	900 - 3600
50 - 79	600 - 1800
30 - 49	300 - 900
15 - 29	150** - 600
< 15***	150** - 300

\* Сумарну добову дозу слід розділити на 3 окремі дози. Знижені дози застосовують пацієнтам з нирковою недостатністю (кліренс креатиніну < 79 мл/хв).

\*\* Приймати по 300 мг через день.

\*\*\* При кліренсі креатиніну < 15 мл/хв добову дозу слід зменшити пропорційно кліренсу креатиніну (наприклад, при кліренсі креатиніну < 7,5 мл/хв необхідно застосовувати половину добової дози, що призначається при кліренсі креатиніну < 15 мл/хв).

#### *Пацієнти, які знаходяться на гемодіалізі.*

Початкова доза становить 300 - 400 мг, а потім підтримуюча доза – 200 - 300 мг габапентину після відповідного 4-годинного гемодіалізу. Коли гемодіаліз не проводять, габапентин не приймають.

#### *Пацієнти з високим ступенем ризику.*

Пацієнтам з поганим загальним станом, малою масою тіла або після трансплантації органів дозу необхідно збільшувати поступово, призначаючи капсули по 100 мг габапентину.

Лікування епілепсії є тривалим. Лікар повинен приймати рішення про те, в якій мірі пропущений прийом разової дози габапентину (наприклад, останній прийом ліків був більше 12 годин тому) повинен компенсуватися додатковою дозою, яку будуть приймати пізніше.

Капсули приймають внутрішньо, незалежно від прийому їжі, запиваючи достатньою кількістю води.  
Капсули не розжовувати.

### **Побічні реакції.**

Побічні реакції класифіковано за частотою виникнення: дуже поширені ( $\geq 1/10$ ), поширені ( $\geq 1/100, < 1/10$ ), непоширені ( $\geq 1/1000, < 1/100$ ), рідко поширені ( $\geq 1/10\ 000, < 1/1000$ ), дуже рідко поширені ( $< 1/10\ 000$ ), включаючи поодинокі випадки.

*Інфекції:* дуже поширені – вірусна інфекція; поширені – пневмонія, інфекція дихальних шляхів, інфекція сечовидільного тракту, отит.

*З боку кровоносної та лімфатичної системи:* поширені – лейкопенія; непоширені – тромбоцитопенія.

*З боку імунної системи:* непоширені – алергічні реакції (наприклад, кропив'янка).

*Метаболічні порушення:* поширені – анорексія, підвищення апетиту.

*Психічні розлади:* поширені – ворожість, сплутаність свідомості, емоційна лабільність, депресія, тривога, нервові напруження, порушення мислення; непоширені – галюцинації.

*З боку нервової системи:* дуже поширені – сонливість, запаморочення, атаксія; поширені – судомні напади, гіперкінезія, дизартрія, амнезія, безсоння, головний біль, парестезія, гіпостезія, розлади координації, ністагм, підвищення, зниження або відсутність рефлексів; рідко поширені – рухові розлади (наприклад, хореоатетоз, дискінезія, дистонія).

*З боку органа зору:* амбліопія, диплопія.

*З боку органа слуху та лабіринтної системи:* поширені – системне запаморочення; рідко поширені – дзвін у вухах.

*З боку серцево-судинної системи:* поширені – артеріальна гіпертензія, розширення судин; рідко поширені – відчуття серцебиття.

*З боку дихальної системи:* поширені – розлади дихання, бронхіт, фарингіт, кашель, риніт.

*З боку шлунково-кишкового тракту:* поширені – блювання, нудота, пошкодження зубів, гінгівіт, діарея, біль у животі, диспепсія, запор, сухість у роті або горлі; метеоризм; рідко поширені – панкреатит.

*З боку гепатобіліарної системи:* рідко поширені – гепатит, жовтяниця.

*З боку шкіри та підшкірних тканин:* поширені – набряк обличчя, пурпура, висипання, свербіж, акне; рідко поширені – синдром Стівенса-Джонсона, ангіоневротичний набряк, мультиформна еритема, алопеція.

*З боку опорно-рухового апарату:* поширені – біль у суглобах, м'язах та спині, м'язові посмикування.

*З боку нирок та сечовидільної системи:* поширені – нетримання сечі; рідко поширені – гостра ниркова недостатність.

*З боку репродуктивної системи:* поширені – імпотенція.

*Загальні порушення:* дуже поширені – стомленість, гарячка; поширені – периферичні та генералізовані набряки, порушення ходи, астенія, біль, грипоподібний синдром; рідко поширені – реакція синдрому відміни (тривога, безсоння, нудота, біль, підвищена пітливість), біль у грудях.

*Лабораторні дослідження:* поширені – лейкопенія; рідко поширені – коливання рівня глюкози у крові хворих на діабет, підвищення функціональних печінкових проб.

*Інші:* поширені – випадкові травми, переломи.

### **Передозування.**

*Симптомами передозування є* посилення проявів побічних реакцій (запаморочення, атаксії, диплопії, нечіткості мови, дизартрії, сонливості, летаргії, апатії, легкої діареї).

*Лікування:* симптоматичне. Габапентин може виводитися з кровообігу шляхом гемодіалізу. Але, як показує досвід, у цьому немає необхідності. Однак для пацієнтів із хронічною нирковою недостатністю гемодіаліз може бути ефективним.

### **Застосування у період вагітності або годування груддю.**

Застосування препарату під час вагітності можливе лише тоді, коли очікувана користь для матері перевищує потенційний ризик для плода або дитини.

Габапентин проникає в грудне молоко. Вплив на новонароджених, що знаходяться на грудному вигодовуванні, невідомий, тому призначати габапентин у період годування груддю слід тільки тоді, коли користь для матері перевищує ризик для дитини.

### ***Діти.***

Габапентин можна призначати дітям віком від 12 років у комбінації з іншими протиепілептичними засобами для лікування парціальних епілептичних нападів з або без вторинної генералізації у випадках, коли загальноприйнята терапія недостатньо ефективна.

### ***Особливості застосування.***

При появі симптомів панкреатиту прийом препарату необхідно припинити.

Незважаючи на відсутність вказівок на судомні напади після припинення прийому габапентину, раптове припинення застосування протисудомних препаратів у хворих на епілепсію може спровокувати епілептичний напад.

Як і у випадку застосування інших протисудомних препаратів, у деяких пацієнтів частота нападів може підвищитися або можуть з'явитися нові типи нападів при лікуванні габапентином.

Спроби припинити застосування супутніх протиепілептичних засобів з метою переходу на монотерапію габапентином у стійких до лікування пацієнтів, які отримували кілька протиепілептичних засобів, рідко є успішними.

Немає необхідності проводити спостереження щодо вмісту габапентину в плазмі крові для оптимізації лікування. Крім того, габапентин можна застосовувати з іншими протиепілептичними засобами, не побоюючись змін вмісту габапентину або інших протиепілептичних препаратів у плазмі крові.

Габапентин не вважається ефективним при лікуванні первинних генералізованих нападів, наприклад, абсансів, і може навіть погіршувати такі напади у деяких пацієнтів. Тому габапентин слід призначати з обережністю пацієнтам зі змішаними нападами, включаючи абсанс.

Необхідно слідкувати за проявами суїцидального мислення та поведінки у пацієнтів, які приймають протиепілептичні засоби, і за необхідності призначати відповідне лікування. У хворих з порушенням функції нирок дозу габапентину підбирають відповідно до кліренсу креатиніну (див. розділ «Спосіб застосування та дози»).

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

При застосуванні препарату слід утримуватися від керування транспортними засобами та роботи з потенційно небезпечними механізмами.

### ***Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.***

Можливе одночасне застосування з іншими протиепілептичними засобами (фенітоїном, карбамазепіном, вальпроєвою кислотою, фенобарбіталом); з пероральними контрацептивними лікарськими засобами (що містять норетиндрон та/або етинілестрадіол); препаратами, що блокують канальцеву секрецію і знижують виведення габапентину нирками.

Антациди, що містять  $\text{Al}^{3+}$  і  $\text{Mg}^{2+}$ , знижують біодоступність габапентину приблизно на 24 %. У зв'язку з цим препарат рекомендується застосовувати не раніше ніж через 2 години після прийому антацидів.

Мієлотоксичні лікарські засоби – посилення гематотоксичності (лейкопенії).

Вживання алкоголю та наркотичних засобів одночасно з прийомом габапентину може посилювати побічні реакції з боку центральної нервової системи, зокрема обнібуляцію свідомості й атаксію.

### ***Фармакологічні властивості.***

**Фармакодинаміка.** Габапентин є циклічним структурним аналогом  $\gamma$ -аміномасляної кислоти (ГАМК), який добре проникає через гематоенцефалічний бар'єр. Незважаючи на структурну подібність до ГАМК, габапентин не є ГАМК-міметиком або агоністом ГАМК $\alpha$  та ГАМК $\beta$ -рецепторів. Він також не взаємодіє з бензодіазепіновими, глутаматними, N-метил-D-аспартатними та стрихніннечутливими гліциновими рецепторами. Однак у неокортексі та гіпокампі головного мозку тварин виявлені високоспецифічні (поки що не ідентифіковані) центри зв'язування габапентину. Отже, механізм протиепілептичної дії препарату дотепер залишається нез'ясованим.

**Фармакокінетика.** Біодоступність не пропорційна дозі: при збільшенні дози знижується і становить 60 % при дозі 300 мг, 30 % – при дозі 1600 мг. Абсолютна біодоступність – 60 %. Їжа, у тому числі з великим вмістом жирів, не впливає на фармакокінетику. Час, необхідний для досягнення максимальної

концентрації, – 2 - 4 години. Концентрація в плазмі крові пропорційна дозі. Максимальна концентрація – 4,02 мкг/мл при застосуванні дози 300 мг кожні 8 годин і 5,5 мкг/мл – при дозі 400 мг. Площа під кривою «концентрація-час» відповідно – 24,8 мкг/мл на годину і 33,3 мкг/мл на годину. Проходить через гематоенцефалічний бар'єр, проникає у грудне молоко. Об'єм розподілу – 57,7 л. У хворих на епілепсію концентрація у спинномозковій рідині становить приблизно 20 % від відповідної рівноважної концентрації препарату в плазмі. Зв'язок з білками плазми дуже низький (менше 5 %).

Практично не метаболізується, не індукує окисні ферменти зі змішаною функцією, що беруть участь у метаболізмі лікарського засобу. Виводиться нирками. Виведення з плазми має лінійну залежність. Період напіввиведення становить в середньому 5 - 7 годин та не залежить від дози (при дозі 300 мг – 5,2 години, 400 мг – 6,1 години). Виводиться при гемодіалізі.

Кліренс габапентину в плазмі знижується у пацієнтів літнього віку і хворих з порушеннями функції нирок, період напіввиведення при кліренсі креатиніну 30 мл/хв становить 52 години.

Фармакокінетика не змінюється при повторному застосуванні.

### **Фармацевтичні характеристики.**

**Основні фізико-хімічні властивості:** тверді желатинові капсули циліндричної форми, білого кольору, заповнені білим порошком.

**Термін придатності.** 2 роки.

### **Умови зберігання.**

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

### **Упаковка.**

По 10 капсул у блістері. По 2 блістери у пачці з картону.

### **Категорія відпуску.**

За рецептом.

### **Виробник.**

ПрАТ «Технолог».

### **Місцезнаходження.**

Україна, 20300, Черкаська обл., м. Умань, вул. Мануїльського, 8.