

# ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування препарату

ГАБАНТИН 300

(GABANTIN 300)

## Склад:

*діюча речовина:* габапентин;

1 капсула містить 300 мг габапентину у перерахуванні на 100 % безводну речовину;

*допоміжні речовини:* целюлоза мікрокристалічна, крохмаль кукурудзяний, тальк;

*склад капсули:* желатин, титану діоксид (Е 171).

**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 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 з компонентів 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 визначається відповідно до індивідуальної переносимості та ефективності препарату. Коли, на думку лікаря, виникає необхідність у зменшенні дози, припиненні прийому препарату або його заміні альтернативним засобом, це необхідно проводити поступово впродовж мінімум одного тижня.

*Дорослі та діти віком від 12 років.*

Ефективна доза Габантину 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 три рази на добу в 1-й день. У подальшому, 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

доза 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-х днів. Добова доза ділиться на три прийоми, максимальна перерва між прийомами препарату не має перевищувати 12 годин.

*Невропатичний біль у дорослих.*

Лікування може бути розпочато або з титрування дози, як описано в таблиці 1, або з призначення початкової дози 900 мг на добу, розподіленої на три прийоми. Надалі, 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 досягнення дози 1800 мг на добу відповідає одному 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 за 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 з меншим дозуванням препарату 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 в таблиці 2.

Таблиця 2

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

<sup>a</sup> Загальну добову дозу слід розподілити на три прийоми. Зниження дозування застосовують для пацієнтів з порушенням функції нирок (кліренс креатиніну <79 мл/хв).

<sup>b</sup> Призначати у дозі 300 мг через день.

<sup>c</sup> 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 застосовують пацієнти 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, підтримуюча доза габапентину призначається 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.*

Побічні реакції класифіковані за частотою виникнення: дуже часто ( $\geq 1/10$ ); часто ( $\geq 1/100$  до  $<1/10$ ); нечасто ( $\geq 1/1000$  до  $<1/100$ ); поодинокі ( $\geq 1/10000$  до  $<1/1000$ ); рідкісні ( $<1/10000$ ); невідомо (частоту неможливо визначити на основі існуючих даних).

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

*З боку крові та лімфи:* часто – лейкопенія; невідомо – тромбоцитопенія.

*З боку імунної системи:* нечасто – алергічні реакції (включаючи кропив'янку); невідомо – лімфаденопатія, еозинofilія.

*З боку метаболічних процесів:* часто – анорексія, підвищення апетиту, збільшення маси тіла; невідомо – коливання рівня глюкози у хворих на цукровий діабет.

*Психічні порушення:* часто – ворожість, сплутаність свідомості, емоційна лабільність, депресія, тривожність, підвищена нервова збудливість, розлади мислення; невідомо – галюцинації.

*З боку нервової системи:* дуже часто – сонливість, запаморочення, атаксія; часто – судоми, гіперкінезія, дизартрія, амнезія, тремор, безсоння, головний біль, парестезії, гіпестезія, порушення координації, ністагм; посилення, послаблення або відсутність рефлексів; нечасто – гіпокінезія; невідомо – інші рухові порушення (хореоатетоз, дискінезія, дистонія).

*З боку органів зору:* часто – диплопія, амбліопія.

*З боку органів слуху:* часто – вертиго; невідомо – дзвін у вухах.

*З боку серцево-судинної системи:* часто – артеріальна гіпертензія, симптоми вазодилатації; нечасто – відчуття серцебиття.

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

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

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

*З боку опорно-рухового апарату:* часто – міалгія, артралгія, біль у спині, посмикування м'язів; невідомо – міоклонус.

*З боку сечовидільної системи:* часто – нетримання сечі; невідомо – гостра ниркова недостатність.

*З боку репродуктивної системи:* часто – імпотенція; невідомо – гіпертрофія молочних залоз, гінекомастія.

*Загальні порушення:* дуже часто – підвищена втомлюваність, гарячка; часто – периферичні набряки, порушення ходи, астенія, нездужання, грипоподібні симптоми; нечасто – генералізовані набряки; невідомо – реакція відміни (неспокій, безсоння, болі, нудота, пітливість), біль у грудях.

*Інше:* часто – випадки травм, переломи.

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

### *Передозування.*

Відомі випадки передозування габапентину при разовому прийомі препарату у дозі до 49 г.

При цьому, не зважаючи на розвиток деяких симптомів (запаморочення, діарея, двоїння в очах, порушення мовлення, сонливість, летаргія), випадків загрозливого стану для хворого не було і він 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 в цьому немає необхідності. Гемодіаліз може бути показаний пацієнтам з тяжкими порушеннями функції нирок.

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

Габантин не слід застосовувати у період вагітності; при вирішенні питання стосовно призначення препарату у період вагітності необхідно оцінити очікувану користь для матері та можливий ризик для плода.

Габапентин проникає грудне молоко. У зв'язку з цим необхідно припинити грудне годування на період лікування Габантином.

### ***Діти.***

Габантин показаний лише для лікування дітей з епілепсією: як додаткова терапія для дітей старше 6 років, як монотерапія для дітей старше 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 габапентину. Спроби відмови від супутньої терапії протиепілептичними препаратами при лікуванні пацієнтів з рефрактерною патологією, які отримують більше одного протиепілептичного препарату з метою перейти на монотерапію габапентином, 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, габапентин слід призначати з обережністю.

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

У випадку порушення функції нирок дозу габапентину підбирати відповідно до кліренсу креатиніну.

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

Ефекти тривалого (довше 36 тижнів) лікування габапентином на здатність до навчання, інтелект і розвиток у дітей та підлітків вивчені недостатньо. Тому користь від пролонгованої терапії має бути ретельно зважена стосовно потенційного ризику такого лікування.

Лабораторні тести.

При проведенні напівкількісного 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.***

Габапентин діє на центральну нервову систему і може спричиняти 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. Особливо це стосується періодів на початку лікування і після підвищення дози.

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

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

Габантин 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 Габантин 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 доза морфіну або габапентину має бути належним чином скоригована.

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, здатним 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<sub>A</sub>, ні з ГАМК<sub>B</sub>-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 збуджувальних 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 не 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 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. Проникає у грудне молоко. Габапентин не зв'язується з білками плазми крові, об'єм розподілу становить 57,7 літра. Габапентин практично не метаболізується. Не індукуює окиснювальних ферментів печінки. Виводиться через нирки у незміненому вигляді. Час напіввиведення не залежить від дози і в 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 знаходяться на гемодіалізі.

## Фармацевтичні характеристики.

**Основні фізико-хімічні властивості:** тверді желатинові капсули з білою непрозорою кришечкою та білим непрозорим корпусом. Вміст капсул – порошок білого або майже білого кольору допускається наявність спресованих стовпчиків або грудочок, які при надавлюванні розпадаються

### *Термін придатності.*

3 роки.

**Умови зберігання.**

У недоступному для дітей місці в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

**Упаковка.**

По 10 капсул у блістері; по 3 або 6 блістерів у пачку картонну.

**Категорія відпуску.** За рецептом.

**Виробник.** ТОВ «Фарма Старт».

**Місцезнаходження.** Україна, 03124, м. Київ, бул. І. Лепсе, 8.