

**УТВЕРЖДЕНО**  
**Приказ Министерства**  
**здравоохранения Украины**  
**06.11.14 № 812**  
**Регистрационное свидетельство**  
**№ UA/14034/01/01**

**ИНСТРУКЦИЯ**  
для медицинского применения лекарственного средства

**НЬЮРОПЕНТИН®**  
**(NUROPENTINE®)**

**Состав:**

*действующее вещество:* габапентин;

1 капсула содержит 300 мг габапентина;

*вспомогательные вещества:* маннит (Е 421), крахмал кукурузный, магния стеарат, тальк, кремния диоксид коллоидный безводный, твердая желатиновая капсула: желатин, вода очищенная, железа оксид красный (Е 172), титана диоксид (Е 171).

**Лекарственная форма.** Капсулы твердые.

*Основные физико-химические свойства:* твердые желатиновые капсулы размером «1» с белым корпусом и крышкой красного цвета, содержащие порошок от белого до почти белого цвета.

**Фармакотерапевтическая группа.**

Противоэпилептические средства. Код АТХ N03A X12.

**Фармакологические свойства.**

*Фармакодинамика.*

Габапентин - 1 - (аминометил) - циклогексануксусная кислота - является циклическим аналогом ГАМК, который способен проходить через гематоэнцефалический барьер. Противосудорожная активность габапентина показана на многих экспериментальных моделях судорожных состояний. Окончательный механизм противосудорожного действия габапентина на сегодня остается невыясненным. Несмотря на то, что габапентин структурно подобен ГАМК, он не является ГАМК-миметиком, поскольку не связывается ни с ГАМК<sub>A</sub>, ни с ГАМК<sub>B</sub> - рецепторами, не ингибирует обратный захват ГАМК или деградацию ГАМК при участии ГАМК-трансаминазы. Он не взаимодействует с потенциал-зависимыми натриевыми каналами, бензодиазепиновыми рецепторами, с центрами связывания возбуждающих нейротрансмиттеров, не влияет на катехоламиновые, ацетилхолиновые или опиатные рецепторы. Таким образом, габапентин имеет абсолютно новый механизм действия, связываясь с высокоспецифическими центрами в ЦНС, которые имеют белковую природу, локализованы преимущественно в неокортексе и не имеют родства с другими противоэпилептическими средствами.

Габапентин также эффективно купирует невропатическую боль.

*Фармакокинетика.*

Абсорбция быстрая. Биодоступность составляет около 60%. Биодоступность не пропорциональна дозе: при увеличении дозы уменьшается и составляет при дозе 300 мг - 60 %, а при дозе 1600 мг - 30 %. Пища не влияет на фармакокинетику габапентина. Время достижения максимальной концентрации составляет 2-3 часа. Концентрация препарата в

плазме крови пропорциональна дозе. Фармакокинетика не меняется при повторном приеме. Проходит через ГЭБ: у больных эпилепсией концентрация габапентина в спинномозговой жидкости составляет около 20% от соответствующей равновесной концентрации препарата в плазме крови. Попадает в грудное молоко. Габапентин не связывается с белками плазмы крови, объем распределения составляет 57,7 литра. Габапентин практически не метаболизируется. Не индуцирует окислительных ферментов печени. Выводится почками в неизменном виде. Период полувыведения не зависит от дозы и в среднем составляет 5-7 часов у пациентов с нормальной выделительной функцией почек. У пациентов пожилого возраста и у пациентов с нарушением функции почек скорость выведения снижается прямо пропорционально уровню клиренса креатинина. Выводится из крови при гемодиализе. Рекомендуется коррекция дозы пациентам с нарушением функции почек и пациентам, находящимся на гемодиализе.

### **Клинические характеристики.**

#### ***Показания.***

##### Эпилепсия.

Как дополнительная терапия при лечении парциальных припадков с вторичной генерализацией или без нее у взрослых и детей старше 6 лет.

Как монотерапия при лечении парциальных припадков с вторичной генерализацией или без нее у взрослых и детей старше 12 лет.

Лечение периферической невропатической боли, такой как болевая диабетическая нейропатия и постгерпетическая невралгия у взрослых.

#### ***Противопоказания.***

Гиперчувствительность к активному веществу или к любому из вспомогательных веществ.

#### ***Особые меры безопасности.***

Необходимо следить за проявлениями суицидального мышления и поведения у пациентов, которые принимают противоэпилептические средства, и при необходимости назначать соответствующее лечение.

При появлении симптомов панкреатита прием препарата необходимо прекратить.

Несмотря на отсутствие признаков судорожных припадков после прекращения приема габапентина, внезапное прекращение применения противосудорожных препаратов у больных эпилепсией может спровоцировать эпилептический приступ.

Как и в случае применения других противосудорожных препаратов, у некоторых пациентов частота приступов может повыситься или могут появиться новые типы приступов при лечении габапентином.

Попытки прекратить применение сопутствующих противоэпилептических средств с целью перехода на монотерапию габапентином у пациентов с рефрактерной эпилепсией, получавших несколько противоэпилептических средств, редко являются успешными.

Габапентин не считается эффективным при лечении первичных генерализованных припадков, например, абсансов, и может даже ухудшать такие приступы у некоторых пациентов. Поэтому габапентин следует назначать с осторожностью пациентам со смешанными приступами, включая абсанс.

У больных с нарушением функции почек дозу габапентина подбирают в соответствии с клиренсом креатинина (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Риск развития некоторых побочных реакций (сонливость, периферические отеки, астения) может быть выше у пациентов старше 65 лет по сравнению с пациентами младшего возраста.

Из-за отсутствия данных относительно влияния долгосрочной (более 36 недель) терапии габапентином на обучаемость, интеллектуальные способности и развитие у детей и

подростков следует анализировать преимущества длительной терапии относительно потенциальных рисков ее использования.

Поскольку при использовании метода полуколичественного определения белка в моче с помощью тест-полосок могут быть получены ложноположительные результаты, рекомендуется применение других методов для определения данного показателя (биуретовый, турбидиметрический и другие).

При терапии противозепилептическими средствами, включая габапентин, необходимо следить за развитием синдрома гиперчувствительности, индуцированного медикаментами с кожными и системными проявлениями и эозинофилией (DRESS - синдром). При появлении каких-либо ранних клинических проявлений гиперчувствительности (лихорадка, лимфаденопатия) даже без очевидных кожных проявлений (сыпь) следует немедленно провести обследование пациента. Габапентин следует отменить, если не было установлено других этиологических факторов относительно развития DRESS - синдрома.

### ***Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.***

***Морфин.*** Клинические исследования продемонстрировали, что одновременное применение габапентина и морфина приводило к увеличению AUC габапентина на 44% по сравнению с данным показателем для габапентина, который принимался без морфина. По этой причине необходимо тщательно наблюдать за состоянием пациентов, принимающих данные препараты для своевременного выявления признаков подавления ЦНС, в частности сонливости. При их обнаружении доза габапентина или морфина должна быть надлежащим образом снижена.

***Фенобарбитал, фенитоин, вальпроевая кислота, карбамазепин.*** Взаимодействия между данными препаратами и габапентином не наблюдалось.

Фармакокинетика стабильной концентрации габапентина в плазме крови похожа у здоровых людей и у пациентов с эпилепсией, получающих эти противозепилептические средства.

***Пероральные контрацептивы, содержащие норэтиндрон и/или этинилэстрадиол.*** Одновременный прием этих препаратов с габапентином не влияет на фармакокинетику этих препаратов.

***Антацидные лекарственные средства, содержащие алюминий и магний.*** Одновременный прием этих препаратов с габапентином приводит к уменьшению биодоступности габапентина на 24%. Габапентин следует принимать не ранее, чем через 2 часа после приема антацида.

***Пробенецид*** не влияет на выведение габапентина почками.

***Циметидин.*** Одновременный прием данного препарата с габапентином приводит к незначительному снижению почечной экскреции габапентина, что не является клинически значимым.

### ***Особенности применения.***

#### ***Вспомогательные вещества.***

Препарат содержит Маннит (Е 421), поэтому может оказывать мягкое слабительное действие.

#### ***Применение в период беременности или кормления грудью.***

Поскольку потенциальный риск репродуктивной токсичности для человека неизвестен, габапентин не следует применять во время беременности, если только ожидаемая польза такого лечения для матери не превышает потенциальный риск для плода.

Габапентин проникает в грудное молоко. Влияние на новорожденных, находящихся на грудном вскармливании, неизвестно, поэтому назначать габапентин в период кормления грудью следует только тогда, когда польза для матери превышает риск для ребенка.

В случае необходимости лечения рекомендуется отказаться от кормления грудью.

Риск, связанный с эпилепсией и противоэпилептическими лекарственными средствами в целом.

У потомства матерей, получавших лечение противоэпилептическими препаратами, риск врожденных пороков возрастает в 2-3 раза. Чаще всего сообщалось о таких пороки развития, как заячья губа, пороки развития со стороны сердечно-сосудистой системы и дефекты нервной трубки.

Лечение несколькими противоэпилептическими препаратами может вызывать повышенный риск врожденных пороков развития по сравнению с монотерапией, по этой причине важно соблюдать монотерапии в тех случаях, когда это возможно. Консультация специалиста необходима женщинам, которые планируют беременность, или для женщин репродуктивного возраста, которые нуждаются в проведении противоэпилептического лечения. Следует избегать резкого прекращения приема противоэпилептических препаратов, поскольку это может привести к резкому учащению/выраженности судом, который может иметь серьезные последствия как для матери, так и для ребенка.

Задержка развития детей матерей, больных эпилепсией, наблюдается редко. Невозможно отдифференцировать задержку развития, обусловленную генетическими причинами, социальными факторами, наличием эпилепсии у матери и проведением противоэпилептической терапии.

Риск, связанный с применением габапентина.

Невозможно определить, связано применение габапентина с повышенным риском врожденных пороков развития при его назначении во время беременности, так как во время беременности действие может вызывать как эпилепсия сама по себе, так и применение противоэпилептических препаратов.

*Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами.*

Габапентин может слабо или умеренно влиять на способность управлять автомобилем и другими механизмами. Габапентин влияет на центральную нервную систему и может вызвать сонливость, головокружение или другие симптомы. Даже если эти симптомы слабо или умеренно выражены, эти побочные эффекты могут быть потенциально опасными для управления автомобилем или механизмами, особенно в начале лечения и при условии увеличения дозы.

***Способ применения и дозы.***

Для перорального применения.

Габапентин можно принимать независимо от приема пищи. Капсулу необходимо проглотить целиком, запивая достаточным количеством жидкости (стакан воды).

В таблице 1 представлена схема титрования дозы препарата в начале лечения (для всех показаний), которая рекомендована для взрослых пациентов и детей старше 12 лет. (Рекомендации относительно доз для детей младше 6 лет представлены ниже).

Таблица 1.

<b>Схема начального титрования</b>		
<b>1-й день</b>	<b>2-й день</b>	<b>3-й день</b>
300 мг 1 раз в сутки	300 мг 2 раза в сутки	300 мг 3 раза в сутки

Эпилепсия

Эпилепсия обычно требует длительной терапии. Дозировка определяется врачом в соответствии с индивидуальной переносимостью и эффективностью. Когда возникает

необходимость в уменьшении дозы, прекращении приема препарата, замене его альтернативным лекарственным средством, снижение дозы препарата должно быть проведено постепенно (минимум в течение одной недели).

#### *Взрослые и дети старше 12 лет.*

Эффективная доза габапентина составляет от 900 до 3600 мг в сутки (разделенная на 3 приема). Лечение может быть начато путем титрования дозы, как это описано в таблице 1, или с назначения 300 мг три раза в сутки в 1-й день. Далее, в зависимости от индивидуального ответа пациента на терапию и ее переносимость, доза препарата может увеличиваться каждые 2-3 дня на 300 мг/сут до максимальной 3600 мг/сут. Для некоторых пациентов может понадобиться более медленное титрование дозы габапентина. Минимальное время до достижения дозы 1800 мг/сутки составляет одну неделю, дозы 2400 мг/сут — в целом 2 недели, дозы 3600 мг/сут — в целом 3 недели. Дозировка до 4800 мг/сут хорошо переносилась в длительных открытых клинических исследованиях. Максимальный перерыв между приемами препарата не должен превышать 12 часов для предупреждения развития судорог.

#### *Дети от 6 до 12 лет*

Лечение начинают с дозы 10-15 мг/кг/сут. Эффективная доза составляет 25-35 мг/кг/сутки, достигается путем титрования в течение примерно 3 дней. Суточную дозу делить на три приема, максимальный перерыв между приемами препарата не более 12 часов. Необходимости в мониторинге концентраций габапентина в плазме крови для оптимизации лечения нет. Кроме того, габапентин может быть использован в комбинации с другими противоэпилептическими лекарственными препаратами без изменений плазматической концентрации габапентина или сывороточных концентраций других противоэпилептических лекарственных средств.

#### Невропатическая боль у взрослых.

Лечение может быть начато или с титрования дозы, в соответствии с таблицей 1, или с назначения начальной дозы 900 мг в сутки, разделенной на три приема. Далее, в зависимости от индивидуального ответа пациента на лечение и переносимость препарата, дозу можно постепенно увеличивать по 300 мг в сутки каждые 2-3 дня до максимальной дозы 3600 мг в сутки.

Для некоторых пациентов может понадобиться более медленное титрование дозы габапентина.

Минимальный период достижения дозы 1800 мг в сутки соответствует 1 неделе, для дозы 2400 мг в сутки - 2 недели, дозы 3600 мг в сутки - всего 3 недели. Максимальный перерыв между приемами препарата не должен превышать 12 часов.

Безопасность терапии продолжительностью более 5 месяцев при лечении периферической невропатической боли не изучалась. При необходимости применения габапентина при лечении периферической невропатической боли более 5 месяцев врач должен оценить клиническое состояние пациента и определить необходимость дополнительного лечения.

#### Рекомендации, касающиеся назначения габапентина по всем показаниям.

В случае пропуска очередной дозы препарата пропущенную дозу необходимо принять при условии, что прием следующей дозы будет не ранее чем через 4 часа. В противном случае пропущенную дозу принимать не следует.

Для пациентов с ослабленным общим состоянием организма, с низкой массой тела, после трансплантации органов дозу габапентина следует титровать медленнее, путем применения лекарственной формы в меньшей дозе или увеличения интервала между повышением дозы.

*Пациенты пожилого возраста (старше 65 лет).*

Для пациентов пожилого возраста может потребоваться изменение дозировки в связи с возрастным снижением функции почек (см. таблицу 2).

*Пациенты с нарушением функции почек.*

Пациентам с нарушением функции почек или тем, которые находятся на гемодиализе рекомендуется корректировка дозы, в соответствии с таблицей 2.

Таблица 2.

Дозы габапентина у взрослых в зависимости от функции почек	
Клиренс креатинина (мл/мин)	Общая суточная доза <sup>a</sup> (мг/сутки)
>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> Общую суточную дозу следует разделить на три приема. Снижение дозировки для пациентов с нарушениями функции почек (клиренс креатинина <79 мл / мин).

<sup>b</sup> Назначается в дозе 300 мг через день.

<sup>c</sup> У пациентов с клиренсом креатинина <15 мл/мин суточную дозу необходимо уменьшить пропорционально клиренсу креатинина (например, пациенты с клиренсом креатинина 7,5 мл/мин должны получать половину той суточной дозы, которую получают пациенты с клиренсом креатинина 15 мл/мин).

В случае необходимости применения габапентина в дозе менее 300 мг на один прием необходимо применять лекарственные формы с соответствующим дозированием.

*Пациенты, находящиеся на гемодиализе.*

Пациентам с анурией, которые находятся на гемодиализе и ранее никогда не получали габапентин, рекомендуется применять дозы насыщения от 300 до 400 мг, далее 200-300 мг габапентина после каждого 4 - часового сеанса гемодиализа. В дни, когда диализ не проводится, габапентин принимать нельзя.

Пациентам с нарушением функции почек, находящимся на гемодиализе, поддерживающую дозу габапентина назначать в соответствии с рекомендациями, изложенными в таблице 2.

Дополнительно к поддерживающей дозе рекомендуется назначать 200-300 мг препарата после каждого 4 - часового сеанса гемодиализа.

*Дети.*

Габапентин показан в качестве дополнительной терапии при лечении парциальных припадков с вторичной генерализацией или без нее у взрослых и детей старше 6 лет. Габапентин показан в качестве монотерапии при лечении парциальных припадков с вторичной генерализацией или без нее у взрослых и детей старше 12 лет.

***Передозировка.***

Острая токсичность, которая бы угрожала жизни, не наблюдалась при передозировке габапентина до 49 г.

*Симптомы передозировки:* головокружение, двоение в глазах, нечеткость речи, сонливость, заторможенность и легкая диарея. Передозировка габапентина, особенно в комбинации с другими депрессантами ЦНС, может привести к коме.

*Лечение:* симптоматическое. Пониженное всасывание габапентина в более высоких дозах уменьшает его токсичность при передозировке. Несмотря на то, что габапентин может быть удален путем гемодиализа, полученный опыт говорит о том, что обычно этого не требуется. Тем не менее, пациентам с тяжелым нарушением функции почек показан гемодиализ.

### ***Побочные реакции.***

*Инфекции и инвазии:* вирусные инфекции, инфекции, пневмония, инфекции дыхательных путей, инфекции мочевыделительной системы, отит среднего уха.

*Со стороны крови и лимфы:* лейкопения, тромбоцитопения.

*Со стороны иммунной системы:* аллергические реакции (включая крапивницу), синдром гиперчувствительности с системными проявлениями, которые могут включать такие симптомы как лихорадка, сыпь, гепатит, лимфаденопатия, эозинофилия и др.

*Метаболические нарушения:* анорексия, повышение аппетита, увеличение массы тела, колебания уровня глюкозы у больных сахарным диабетом.

*Со стороны психики:* враждебность, агрессивное поведение, спутанность сознания, эмоциональная лабильность, депрессия, тревожность, повышенная возбудимость, расстройства мышления, галлюцинации.

*Со стороны нервной системы:* сонливость, головокружение, атаксия, судороги, гиперкинезия, дизартрия, амнезия, тремор, бессонница, головная боль, парестезии, гипестезия, нарушение координации, нистагм, усиление, послабления или отсутствие рефлексов, гипокинезия, двигательные нарушения (хореоатетоз, дискинезия, дистония).

*Со стороны органов зрения:* диплопия, амблиопия.

*Со стороны органов слуха:* вертиго, звон в ушах.

*Со стороны сердечно - сосудистой системы:* артериальная гипертензия, симптомы вазодилатации, ощущение сердцебиения.

*Со стороны дыхательной системы:* ринит, фарингит, диспноэ, бронхит, кашель.

*Со стороны пищеварительной системы:* тошнота, рвота, боль в животе, гингивит, запоры или диарея, сухость во рту, анорексия, повышение аппетита, диспепсия, изменение состояния зубов, метеоризм, панкреатит .

*Со стороны гепатобилиарной системы:* гепатит, желтуха, повышение уровня билирубина, повышение активности печеночных трансаминаз.

*Со стороны кожи и подкожной клетчатки:* отек лица, пурпура, кожная сыпь, зуд, акне, мультиформная экссудативная эритема, синдром Стивенса-Джонсона, ангионевротический отек, алопеция.

*Со стороны опорно-двигательного аппарата:* миалгия, артралгия, боль в спине, подергивания мышц, миоклонус.

*Со стороны мочевыделительной системы:* недержание мочи, острая почечная недостаточность.

*Со стороны репродуктивной системы и молочных желез:* импотенция, гипертрофия молочных желез, гинекомастия.

*Общие нарушения:* повышенная утомляемость, лихорадка, периферические отеки, нарушение походки, астения, недомогание, гриппоподобные симптомы, генерализованные отеки, реакция отмены (беспокойство, бессонница, боли, тошнота, потливость), боль в груди.

*Прочее:* случаи травм, переломы.

Сообщалось о миопатии с повышенными уровнями креатинина у пациентов с почечной недостаточностью последней стадии, находящихся на гемодиализе.

***Срок годности.*** 2 года.

***Условия хранения.*** Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

**Упаковка.** 10 капсул в блистере. По 1, 3 или 10 блистеров в картонной упаковке.

**Категория отпуска.** По рецепту.

**Производитель.**

КУСУМ ХЕЛТХКЕР ПБТ ЛТД/  
KUSUM HEALTHCARE PVT LTD.

**Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.**

СП-289 (А), РИИКО Индастриал ареа, Чопанки, Бхивади, Дист.Алвар (Раджастан),Индия /  
SP-289 (A), RIICO Industrial area, Chopanki, Bhiwadi, Dist. Alwar (Rajasthan), India.

**Дата последнего пересмотра.**