گاباپِنتین

(Gabapentin)

دسته دارویی: ضد صرع پارشیال ، ضد درد نوروپاتیک

شکل دارویی: کپسول های ۱۰۰ و ۳۰۰ میلی گرمی

نحوه عملکرد دارو

گاباپنتین از لحاظ ساختار شیمیایی آنالوگ گابا است که حلالیت در چربی آن زیاد بوده و براحتی از سد خونی مغزی عبور می کند. این دارو بر خلاف انتظار به گیرنده گابا متصل نمی شود. محل اتصال آن کانالهای کلسیم N-Type پیش سیناپسی است که در آنجا به ساب یونیت های آلفا ۲ دلتا متصل شده و از ورود کلسیم به داخل عصب و آزاد شدن ناقل های عصبی تحریکی مثل گلوتامات، نور آدرنالین و ماده P جلوگیری می گردد و لذا اثر ضد تشنجی و antinociceptive (ضد احساس درد) ایجاد نماید.

مشخصات فارماکوکینتیکی گاباپنتین

جذب گاباپنتین از دستگاه گوارش نسبتاً آهسته است و غلظت پیک در۳ ساعت ایجاد می شود.از راه خوراکی۶۰-۵۰ ٪ جذب می گردد. با مصرف۹۰۰ میلی گرم در سه دوز منقسم در روز، فراهمی زیستی دارو۶۰ ٪ است. با افزایش دوز دارو، میزان جذب و فراهمی زیستی دارو کاهش می یابد به طوری که با مصرف ۳۶۰۰ میلی گرم در سه دوز منقسم در روز، فراهمی زیستی دارو ۳۳ ٪ می شود. جذب دارو از قسمت اولیه روده کوچک توسط سیستم انتقال آمینواسید انجام می گیرد که این سیستم قابل اشباع شدن است و به همین جهت فراهمی زیستی دارو dose proportional نمی باشد. بنابراین، دوز های کوچک به دفعات بیشتر برای جذب مناسب ، ارجحیت دارد.کمتر از ۳ ٪ دارو به پروتئین های پلاسما متصل می شود.حجم توزیع دارو حدود۶۰ لیتر است. غلظت دارو در مایع مغزی نخاعی۲۰ ٪ غلظت خونی آن می باشد. گاباپنتین در بدن متابولیزه نشده و به صورت داروی دست نخورده از ادرار دفع می‌گردد. نیمه عمر حذف دارو ۷ -۵ ساعت است و در افراد مسن و بیمارانی که کلیه نارسا دارند کلیرنس پلاسمایی دارو، کم می شود. ازخون توسط همودیالیزخارج می شود. گاباپنتین از جفت عبور کرده و وارد شیر مادر شیرده می شود.

موارد مصرف دارو

۱- به عنوان داروی کمکی در درمان حملات پارشیال (با یا بدون جنرالیزاسیون ثانویه) در بزرگسالان و بچه های ۳ تا ۱۲ سال مبتلا به اپی لپسی (صرع)

۲- کنترل نورالژی پس از عفونت هرپس زوستر(زونا)

۳- درمان ALS (Amyotrophic Lateral Sclerosis)

۴- گرفتگی و درد نوروپاتیک

مقدار و روش مصرف

گاباپنتین از راه خوراکی با یا بدون غذا مصرف می شود. دوز دارو برای درمان صرع ابتدا ۳۰۰ میلی گرم در روز است که می تواند به ۶۰۰ و ۹۰۰ میلی گرم سه بار در روز افزایش داده شود.

برای درمان نورالژی postherptic ، در روز اول ۳۰۰ میلی گرم ، در روز دوم ۳۰۰ میلی گرم دوبار و در روز سوم ۳۰۰ میلی گرم سه بار مصرف می شود. دوز دارو در کودکان بر حسب سن از ۱۵ تا ۴۰ میلی گرم برای هر کیلوگرم در روز است. دوز دارو بر حسب کلیرنس کراتینین تعدیل می شود.

موارد منع مصرف

در بیماران حساس به گاباپنتین و یا سایر اجزاء فرمولاسیون

عوارض جانبی دارو

در برخی بیماران بعضی از عوارض جانبی زیر ممکن است ایجاد شوند:

سرگیجه ،خواب آلودگی ،عصبانیت ،احساس خستگی ، آتاکسی ، دوبینی ، لرز ، خارش ، تهوع ، استفراغ، سوء هاضمه، یبوست ، اسهال ، خشک شدن دهان ، افزایش وزن ، ادم در صورت ، ایجاد ایده خودکشی، ناتوانی جنسی ، ائوزینوفیلی .

تداخل اثر

مصرف همزمان آنتاسیدها جذب گاباپنتین را کاهش میدهند و لذا توصیه می شود که با ۲ ساعت فاصله از آنها استفاده گردد.

مصرف دارو در دوران حاملگی و شیردهی

گاباپنتین در FDA Pregnancy Category ، در گروه C قرار دارد . در دوران حاملگی باید فقط موقعی مصرف شود که سودمندی آن در مقابل خطرآن برای جنین قابل توجیه باشد.

حداکثر ۱میلی گرم در روز از طریق شیر وارد بدن بچه شیرخوار می شود . با توجه به اینکه اثر دارو روی طفل شیرخوار مشخص نشده ، گاباپنتین در مادران شیرده باید موقعی مصرف شود که سودمندی آن به وضوح بیشتر از خطرات آن باشد.

مصرف دوز بیش از حد و درمان آن

در بیماران مسموم شده با مقدارزیاد دارو، دوبینی ،خواب آلودگی ، لتارژی و اسهال مشاهده شده که همه آنها با درمان حمایتی بهبود یافته اند. گاباپنتین به راحتی توسط همودیالیز از خون خارج می گردد.

نکات آموزشی درباره دارو

۱- در صورتی که تصمیم به کاهش دوز ، قطع درمان یا جایگزینی درمان با گاباپنتین باشد باید به تدریج در عرض یک هفته اقدام شود.

۲- باتوجه به اینکه این دارو ایجاد سرگیجه وخواب آلودگی می نماید ، بهتر است به بیماران تحت درمان با آن توصیه گردد که از کار کردن با دستگاه ها و ماشین آلات پیچیده اجتناب کنند.

۳- سرگیجه و خواب آلودگی از عوارض عادی گاباپنتین هستند ولی می توانند منجر به تصمیم برای عدم ادامه درمان باشند .

۴- بعضی از گزارش های Postmarketing دال بر Abuse ، Misuse این دارو است که اغلب این افراد سابقه poly-substance abuse داشته و یا آن را برای تسکین علائم قطع مصرف مواد دیگر استفاده می کردند.

شرایط نگهداری دارو

دارو دور از نور و در دمای کمتر از ۳۰ درجه سانتی گراد نگهداری شود.

نوع بسته‌بندی دارو

جعبه حاوی بلیسترهای۱۰ عددی