

Tờ hướng dẫn sử dụng

ESSIVIDINE

Rx THUỐC BÁN THEO ĐƠN

THÀNH PHẦN

Mỗi viên nang chứa:

- **Hoạt chất:** Pregabalin.....75.00 mg
- **Tá dược:** Lactose monohydrat, tinh bột ngô, talc vừa đủ 1 viên.

DƯỢC LỰC

Nhóm trị liệu: chống động kinh và đau thần kinh.

Cơ chế tác dụng:

- Các nghiên cứu in vitro đã cho thấy pregabalin gắn với subunit phụ ($\alpha 2\text{-}^{\text{TM}}\text{ protein}$) của dòng calci mang điện trong hệ thống thần kinh trung ương, thay thế [3H]-gabapentin. Hai dẫn chứng trên cho thấy sự gắn kết của pregabalin vào $\alpha 2\text{-}^{\text{TM}}\text{ protein}$ là cần thiết cho tác dụng giảm đau và chống co giật trên động vật: (1) Các nghiên cứu với đồng phân hữu tuyến không có hoạt tính và các dẫn chất có cấu trúc khác của pregabalin và (2) Các nghiên cứu trên chuột đột biến với thuốc có khả năng gắn vào $\alpha 2\text{-}^{\text{TM}}\text{ protein}$ kém. Thêm vào đó, pregabalin giảm giải phóng một chất dẫn truyền thần kinh, bao gồm glutamat, noradrenalin. Sự quan trọng của những tác động này trên lâm sàng với pregabalin chưa được biết.
- Pregabalin không có ái lực với các thụ thể tiếp nhận hoặc các đáp ứng gắn với tác dụng của một số thuốc thường sử dụng trong điều trị động kinh hoặc đau. Pregabalin không tương tác với các chất ức chế GABA_A hoặc GABA_B; không được chuyển hóa thành GABA_A hoặc chất ức chế GABA_A. Pregabalin không phải là một chất ức chế sự tạo thành và phân hủy của GABA.
- Pregabalin ngăn ngừa đau liên quan tới hoạt động trên động vật với đau thần kinh hoặc đau sau phẫu thuật, bao gồm tăng cảm giác đau và đau do kích thích.
- Pregabalin có hoạt tính trên động vật động kinh, bao gồm động kinh do sốc điện cơ đuôi trên chuột, động kinh ngưỡng rung giật với pentylenetetrazol, động kinh hành vi và điện đố ở chuột được kích thích vùng hải mã.

DƯỢC ĐỘNG HỌC

Hấp thu:

- Pregabalin được hấp thu nhanh khi uống lúc đói, nồng độ đỉnh trong huyết tương đạt được sau 1 giờ.
- Khả dụng sinh học đường uống của pregabalin khoảng 90% và phụ thuộc vào liều dùng. Trong dùng nhắc lại, tình trạng ổn định đạt được trong 24-48 giờ. Tỷ lệ hấp thu của pregabalin giảm khi dùng cùng thức ăn dẫn đến C_{max} giảm khoảng 25-30% và kéo dài t_{1/2}, sau khoảng 2,5 giờ. Tuy nhiên, dùng pregabalin cùng thức ăn không có ảnh hưởng lâm sàng đáng kể nào đến mức độ hấp thu pregabalin.

Phân phối:

- Ở người, thể tích phân phối của pregabalin sau khi dùng đường uống khoảng 0.56 L/kg. Không gắn kết với protein huyết tương.

Chuyển hóa:

- Pregabalin được chuyển hóa không đáng kể trong cơ thể người. Sau khi dùng pregabalin phóng xạ đánh dấu, khoảng 98% được tìm thấy trong nước tiểu là pregabalin ở dạng chưa chuyển hóa. Dẫn xuất N-methylat của pregabalin, chất chuyển hóa chính của pregabalin được tìm thấy trong nước tiểu, chiếm khoảng 0,9% liều dùng. Trong các nghiên cứu tiền lâm sàng, không có dấu hiệu nào về sự biến đổi pregabalin đồng phân tá tuyến thành đồng phân hữu tuyến.

Thải trừ:

- Pregabalin được thải trừ khỏi hệ thống tuần hoàn chủ yếu do bài tiết qua thận nguyên dạng. Thời gian bán thải trung bình của pregabalin là 6,3 giờ. Thanh thải pregabalin huyết tương và thanh thải thận tỷ lệ thuận với thanh thải creatinin.
- Điều chỉnh liều trên các bệnh nhân giảm chức năng thận hoặc thẩm tách máu là cần thiết.

CHỈ ĐỊNH

Đau thần kinh: Essividine được chỉ định trong điều trị đau thần kinh cho người lớn.

Động kinh: Essividine được chỉ định như là liệu pháp bổ trợ trong động kinh cục bộ, có hoặc không kết hợp điều trị tổng quát với bệnh nhân trên 12 tuổi.

LIỀU LƯỢNG VÀ CÁCH DÙNG

Cách dùng: Essividine được dùng bằng đường uống, cùng thức ăn hoặc không.

Liều lượng:

- Liều khởi đầu đề nghị với Essividine là 75 mg dùng 2 liều/ngày (150mg/ngày), cùng thức ăn hoặc không. Trên các thử nghiệm lâm sàng, hiệu quả của Pregabalin được chứng minh trên bệnh nhân dùng

liều từ 150-600 mg/ngày. Với phần lớn bệnh nhân, liều 150 mg chia 2 lần/ngày là liều tối ưu.

Tùy theo sự dung nạp và đáp ứng của từng bệnh nhân, liều dùng có thể tăng từ 150 mg dùng 2 liều sau 3-7 ngày, và nếu cần, có thể tăng liều tối đa 300 mg dùng 2 liều sau tuần kế tiếp.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

Quá mẫn với hoạt chất chính và bất kỳ tá dược nào của thuốc.

THẬN TRỌNG

- Các bệnh nhân với các bệnh lý di truyền hiếm gặp về dung nạp galactose, thiếu enzyme Lapp latase hoặc kém hấp thu glucose-galactose không dùng thuốc này.
- Một số bệnh nhân tiểu đường tăng cân khi dùng Essividine, cần điều chỉnh việc dùng các thuốc hạ đường huyết.
- Thường xảy ra chóng mặt và buồn ngủ, cần thận trọng cho đến khi quen với các ảnh hưởng có thể của thuốc.

TƯƠNG TÁC THUỐC

- Do pregabalin được thải trừ chính qua nước tiểu ở dạng chưa chuyển hóa, một lượng không đáng kể được chuyển hóa (<math><2\%</math> của liều dùng được tìm thấy trong nước tiểu ở dạng chuyển hóa), không tìm hàm chuyển hóa thuốc trong ống nghiệm (in vitro), và không gắn với protein huyết tương, pregabalin không tạo ra tương tác, hoặc bị tương tác dược động học.
- Các thuốc điều trị tiểu đường đường uống, các thuốc lợi tiểu và insulin và các thuốc chống động kinh phenytoin, carbamazepin, valproic acid, lamotrigin, Phenobarbital, tiagabine và topiramate, không có ảnh hưởng lâm sàng đáng kể nào đến thanh thải pregabalin và ngược lại pregabalin cũng không thay đổi độ thanh thải của các thuốc trên.
- Dùng pregabalin kết hợp với oxycodon, lorazepam, hoặc ethanol không có tác động lâm sàng quan trọng nào đến sự hô hấp. Sự có mặt của pregabalin làm tăng thêm rối loạn nhận thức và chức năng vận động gây ra bởi oxycodon, pregabalin có thể tăng tác dụng của ethanol và lorazepam.

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN

- Tác dụng không mong muốn thường gặp là chóng mặt và buồn ngủ. Tỷ lệ ngưng dùng thuốc do các tác dụng không mong muốn là 13% với các bệnh nhân dùng pregabalin và 7% với các bệnh nhân dùng giả dược.

PHỤ NỮ CÓ THAI VÀ CHO CON BÚ

- Chưa có các dữ liệu đầy đủ về dùng Essividine trên phụ nữ có thai.
- Các nghiên cứu trên động vật đã cho thấy tác dụng gây độc trên khả năng sinh sản, nguy cơ về rủi ro trên người chưa được biết. Do vậy, pregabalin không dùng khi đang mang thai trừ khi lợi ích mang lại cho người mẹ rõ ràng quan trọng hơn những khả năng rủi ro có thể xảy ra cho thai nhi.
- Chưa biết được pregabalin có bài tiết qua sữa người hay không; tuy nhiên, thuốc có xuất hiện trong sữa chuột. Do vậy, không được nuôi con bằng sữa mẹ khi đang dùng thuốc.

TÁC ĐỘNG CỦA THUỐC KHI LÁI XE VÀ VẬN HÀNH MÁY MÓC

- Essividine có thể gây chóng mặt hoặc buồn ngủ. Do vậy, bệnh nhân được khuyến không nên lái xe hay vận hành máy móc khi đang dùng thuốc.

QUÁ LIỀU VÀ XỬ LÝ

Trong trường hợp quá liều đến 15g, không có tác dụng không mong muốn nào được báo cáo. Quá liều Essividine cần tiến hành các biện pháp hỗ trợ có thể gồm cả thẩm tách máu nếu cần thiết.

BẢO QUẢN: Nơi khô, dưới 30°C, tránh ánh sáng.

HẠN DÙNG: 36 tháng kể từ ngày sản xuất.

ĐÓNG GÓI: Hộp 4 vỉ x 14 viên nang.

TIÊU CHUẨN: Tiêu chuẩn nhà sản xuất.

ĐỂ XA TÁM TAY CỦA TRẺ EM

THUỐC NÀY CHỈ DÙNG THEO ĐƠN CỦA BÁC SĨ ĐỌC KỸ HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG TRƯỚC KHI DÙNG NẾU CẦN THÊM THÔNG TIN XIN HỎI Ý KIẾN BÁC SĨ

Sản xuất tại:

CÔNG TY CỔ PHẦN DƯỢC PHẨM BOSTON VIỆT NAM
43 Đường số 8, Khu công nghiệp Việt Nam - Singapore,
Thuận An, Bình Dương, Việt Nam
ĐT: 06503 769 606 FAX: 06503 769 601

