

Rx : Thuốc bán theo đơn

# GABASOL

Gabapentin 300 mg/6ml

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng

Nếu cần thêm thông tin xin hỏi ý kiến Bác sĩ, dược sĩ.

### Thành phần

Mỗi ống 6 ml có chứa:

**Hoạt chất:** Gabapentin ..... 300 mg

**Tá dược:** Sucralose, propylen glycol, natri methyl paraben, natri propyl paraben, carmellose natri, hương tự nhiên, nước tinh khiết vừa đủ.

**Dạng bào chế:** Dung dịch uống

**Quy cách đóng gói:** 6 ml/ống nhựa, hộp 20 ống.

### Đặc tính dược lực học

Gabapentin có cấu trúc liên quan đến chất dẫn truyền thần kinh GABA ( $\gamma$ -aminobutyric acid) nhưng cơ chế tác dụng của nó lại khác với một số các thuốc khác mà có tương tác với các synap của GABA, bao gồm valproat, barbiturat, benzodiazepin, các thuốc ức chế GABA transaminase, các thuốc ức chế sự thụ thể GABA, các chất chủ vận trên thụ thể của GABA và các tiền chất của GABA. Các nghiên cứu trên *in vitro* sử dụng gabapentin được gắn chất phóng xạ đã mô tả có một vị trí gắn peptid mới ở các mô não chuột bao gồm vùng vỏ não mới và vùng chân hải mã, đặc tính này có thể liên quan đến tác dụng chống co giật của gabapentin và các dẫn chất có cấu trúc tương tự nó. Tuy nhiên, việc nhận diện và chức năng của vị trí gắn kết với gabapentin vẫn còn phải được làm rõ. Gabapentin ở liều có hiệu quả làm sàng không gắn kết với thụ thể của các thuốc thông thường khác hay của các chất dẫn truyền thần kinh ở não bao gồm GABA<sub>A</sub>, GABAB, benzodiazepin, glutamat, glycin hay các thụ thể của N-methyl-D-aspartat.

Trên *in vitro*, gabapentin không tương tác với các kênh natri và như vậy nó khác với phenytoin và carbamazepin. Gabapentin làm giảm một phần các đáp ứng đối với chất chủ vận của glutamat N-methyl-D-aspartat (NMDA) ở vài hệ thống xét nghiệm trên *in vitro*, nhưng chỉ với các nồng độ > 100 mM mà các nồng độ này không thể đạt được ở trên *in vivo*. Gabapentin làm giảm nhẹ sự giải phóng các chất dẫn truyền thần kinh ở cấu trúc monoamin trên *in vitro*. Sử dụng gabapentin cho chuột làm tăng sự tích lũy GABA ở một số vùng ở não theo một cách thức tương tự như là natri valproat, mặc dù là ở các vùng não khác nhau. Mỗi liên quan của các tác dụng khác nhau này của gabapentin với tác dụng chống co giật của nó vẫn còn phải được thiết lập. Trên động vật, gabapentin xâm nhập dễ dàng vào não và ngăn ngừa các cơn động kinh do bị sốc điện, do các tác nhân gây co giật hóa học bao gồm các chất ức chế sự tổng hợp của GABA, và các cơn động kinh trên những mô hình gây động kinh.

### Đặc tính dược động học

#### Hấp thu

Sau khi uống nồng độ đỉnh của gabapentin trong huyết tương đạt được trong vòng từ 2-3 giờ. Sinh khả dụng của gabapentin có xu hướng giảm khi tăng liều. Thức ăn, bao gồm cả các chế độ ăn nhiều chất béo, không có ảnh hưởng lên dược động học của gabapentin.

Các đặc tính dược động học của gabapentin không bị ảnh hưởng bởi việc dùng lặp lại các liều gabapentin và nồng độ của gabapentin ở trạng thái hằng định trong huyết tương có thể được suy ra từ dữ liệu đơn liều của gabapentin.

#### Phân bố

Gabapentin không gắn với protein huyết tương và có thể tích phân bố bằng 57,7 lít. Ở các bệnh nhân bị động kinh, nồng độ của gabapentin trong dịch não tủy xấp xỉ bằng 20% nồng độ thấp nhất của nó ở trạng thái nồng độ hằng định tương ứng trong huyết tương. Gabapentin cũng được phân bố vào sữa mẹ.

#### Chuyển hóa

Không có bằng chứng về sự chuyển hóa của nó ở người. Gabapentin không gây cảm ứng các enzym oxidase có chức năng hỗ trợ ở gan chịu trách nhiệm cho quá trình chuyển hóa thuốc.

#### Thải trừ

Gabapentin được thải trừ dưới dạng nguyên vẹn qua thận. Thời gian bán thải của gabapentin trong huyết tương không phụ thuộc theo liều và trung bình nằm trong khoảng từ 5-7 giờ. Hệ số đào thải, độ đào thải ra khỏi huyết tương, độ đào thải qua thận của gabapentin tỷ lệ thuận trực tiếp với độ thanh thải creatinin. Gabapentin được loại trừ ra khỏi huyết tương bởi quá trình thẩm phân lọc máu. Do đó cần điều chỉnh liều ở các bệnh nhân có chức năng thận suy giảm hay đang phải thẩm phân lọc máu. Các đặc tính dược động học của gabapentin ở trẻ em đã được xác định trên 12 đối tượng mạnh khỏe từ 4 đến 12 tuổi. Nhìn chung, nồng độ của gabapentin trong huyết tương ở trẻ em tương tự như ở người lớn. Ở các bệnh nhân cao tuổi và ở các bệnh nhân có chức năng thận bị suy giảm, sự đào thải của gabapentin ra khỏi huyết tương bị giảm.

#### Chỉ định

##### Động kinh:

- Gabapentin được chỉ định như là đơn trị liệu trong điều trị các cơn động kinh cục bộ có hay không kèm theo các cơn toàn thể thứ phát ở người lớn và trẻ em trên 12 tuổi. Độ an toàn và hiệu quả của phác đồ đơn trị liệu gabapentin ở trẻ em dưới 12 tuổi còn chưa được thiết lập.

- Gabapentin được chỉ định hỗ trợ trong điều trị các cơn động kinh cục bộ có hay không kèm theo các cơn toàn thể thứ phát ở người lớn và trẻ em từ 3 tuổi trở lên. Độ an toàn và hiệu quả của phác đồ điều trị hỗ trợ sử dụng gabapentin ở bệnh nhân nhi khoa dưới 3 tuổi vẫn chưa được thiết lập.

##### Đau thần kinh:

Gabapentin được chỉ định điều trị đau thần kinh ở người lớn từ 18 tuổi trở lên. Độ an toàn và hiệu quả của gabapentin ở bệnh nhân dưới 18 tuổi chưa được thiết lập.

*Thuốc này chỉ dùng theo đơn của thầy thuốc.*

### Liều lượng và cách dùng

#### Nên pha loãng với nước khi sử dụng

Gabapentin được dùng đường uống cùng hay không cùng thức ăn.

#### Trong điều trị bệnh động kinh:

##### Cho người lớn và bệnh nhân nhi khoa trên 12 tuổi:

Các thí nghiệm lâm sàng cho thấy rằng khoảng liều có hiệu quả của gabapentin là từ 900 đến 3600 mg/ngày. Có thể bắt đầu điều trị bằng cách sử dụng 300 mg, 3 lần/ngày ở ngày 1, hoặc bằng cách chuẩn liều như được mô tả ở bảng 1. Sau đó, dựa vào đáp ứng và khả năng dung nạp của bệnh nhân liều có thể được tăng lên tới liều tối đa 3600 mg/ngày chia làm 3 lần bằng nhau. Chuẩn độ chậm hơn liều gabapentin có

thể thích hợp trên từng bệnh nhân. Liều dùng lên đến 4800 mg/ngày đã được dung nạp tốt ở các nghiên cứu lâm sàng mở, dài hạn. Thời gian tối thiểu để đạt được liều 1800 mg / ngày là một tuần, để đạt 2400 mg/ngày tổng cộng là 2 tuần và để đạt 3600 mg / ngày (72 ml) tổng cộng là 3 tuần. Tổng liều hàng ngày nên được chia thành ba liều duy nhất, không nên vượt quá 12 giờ để tránh các cơn co giật bùng phát.

Ngày 1	Ngày 2	Ngày 3
300 mg, ngày 1 lần	300 mg, ngày 2 lần	300 mg, ngày 3 lần

Việc theo dõi nồng độ của gabapentin trong huyết tương nhằm tối ưu hóa trị liệu với gabapentin là không cần thiết. Hơn thế nữa, gabapentin có thể được sử dụng phối hợp với các thuốc chống động kinh khác mà không cần phải quan tâm đến sự thay đổi của nồng độ gabapentin hay nồng độ của các thuốc chống động kinh khác trong huyết tương.

#### Trong điều trị đau thần kinh ở người lớn:

Liều khởi đầu là 900 mg/kg chia làm 3 liều nhỏ bằng nhau hoặc bằng cách chuẩn liều như được mô tả ở bảng 1. Sau đó, dựa trên đáp ứng và khả năng dung nạp của từng bệnh nhân, có thể tăng liều thêm 300 mg / ngày cứ sau 2 đến 3 ngày với liều tối đa 3600 mg/ngày. Chuẩn độ chậm hơn liều gabapentin có thể thích hợp cho từng bệnh nhân. Thời gian tối thiểu để đạt được liều 1800 mg/ngày là một tuần, để đạt 2400 mg/ngày tổng cộng là 2 tuần và để đạt 3600 mg/ngày tổng cộng là 3 tuần.

##### Sử dụng ở bệnh nhân cao tuổi (trên 65 tuổi)

Bệnh nhân cao tuổi phải được điều chỉnh liều lượng do suy giảm chức năng thận theo tuổi (xem Bảng 2).

Điều chỉnh liều ở bệnh nhân bị đau thần kinh hay bị động kinh có suy giảm chức năng thận:

Nên điều chỉnh liều ở các bệnh nhân bị suy giảm chức năng thận theo mô tả trong bảng 2 và/hoặc những bệnh nhân đang được thẩm phân lọc máu.

Độ thanh thải creatinin (ml/phút)	Tổng liều hàng ngày* (mg/ngày)
≥80	900-3600
50-79	600-1800
30-49	300-900
15-29	150** - 600
<15***	150** - 300

\*Tổng liều hàng ngày nên được dùng theo phác đồ 3 lần/ngày. Các liều được dùng để điều trị các bệnh nhân có chức năng thận bình thường (độ thanh thải creatinin >80 ml/phút) nằm trong khoảng từ 900 – 3600 mg/ngày. Liều được giảm xuống ở các bệnh nhân suy thận (độ thanh thải creatinin <79 ml/phút)  
 \*\*Nên được dùng 300 mg cách ngày.  
 Đối với, bệnh nhân có độ thanh thải < 15 ml/phút, nên giảm liều hàng ngày theo tỷ lệ với độ thanh thải creatinin

#### Điều chỉnh liều ở các bệnh nhân đang được thẩm phân lọc máu:

Với các bệnh nhân đang được thẩm phân lọc máu mà chưa từng dùng gabapentin, nên dùng liều khởi đầu 300-400 mg, sau đó giảm xuống 200-300 mg gabapentin sau mỗi 4 giờ thẩm phân lọc máu.

#### Chống chỉ định

Bệnh nhân quá mẫn cảm với gabapentin hay bất kỳ thành phần nào của thuốc.

#### Thận trọng

Mặc dù chưa có các bằng chứng về các cơn động kinh bùng phát với gabapentin, nhưng sự ngừng đột ngột các thuốc chống co giật ở các bệnh nhân động kinh có thể làm xuất hiện cơn động kinh liên tục (trạng thái động kinh) ở bệnh nhân. Khi muốn giảm liều, dùng thuốc, hay thay thế bằng các thuốc chống co giật khác thì cần phải giảm từ từ trong 1 khoảng thời gian tối thiểu 1 tuần. Nếu một bệnh nhân bị viêm tụy cấp đang được điều trị với gabapentin, ngưng dùng gabapentin cần được xem xét.

Nhìn chung gabapentin không có hiệu quả trong điều trị các cơn động kinh vắng ý thức.

Không có nghiên cứu tin cậy ở bệnh nhân 65 tuổi trở lên được tiến hành với gabapentin. Trong một nghiên cứu mù đôi ở bệnh nhân đau thần kinh, buồn ngủ, phù ngoại biên và suy nhược xảy ra ở một tỷ lệ cao hơn ở những bệnh nhân từ 65 tuổi trở lên và so với bệnh nhân trẻ hơn. Ngoài những phát hiện trên, điều tra lâm sàng ở nhóm tuổi trên 65 tuổi không chỉ ra được một tác dụng phụ khác so với các nhóm tuổi trẻ hơn. Những ảnh hưởng của thời gian dài (trên 36 tuần) điều trị gabapentin về học tập, trí thông minh, phát triển ở trẻ em và thanh thiếu niên chưa được nghiên cứu đầy đủ. Những lợi ích của việc điều trị kéo dài do đó phải được cân nhắc với những rủi ro tiềm năng của liệu pháp này

Cảnh báo tá dược: Trong công thức thuốc có chứa natri methyl paraben và natri propyl paraben có thể gây ra phản ứng dị ứng.

#### Tác dụng không mong muốn

Tác dụng không mong muốn (ADR):

Các phản ứng phụ quan sát thấy trong các nghiên cứu lâm sàng về bệnh động kinh (bổ trợ và đơn trị liệu) và đau thần kinh đã được báo cáo.

Quy định về tần số xuất hiện như sau: rất phổ biến (≥1/10); bình thường (≥1/100 đến <1/100); không phổ biến (≥1/1000 đến <1/100); hiếm (≥1/10000 đến <1/10000); rất hiếm (<1/10000). Trong trường hợp một phản ứng bất lợi đã được nhìn thấy ở các tần số khác nhau trong các nghiên cứu lâm sàng, nó đã được gán cho tần số cao nhất được báo cáo. Phản ứng bất lợi được báo cáo sau khi tiếp tục được quy định là tần số không biết (không thể ước tính từ dữ liệu có sẵn).

Hệ thống cơ thể	Các phản ứng có hại của thuốc
<b>Nhiễm trùng và nhiễm ký sinh trùng</b>	
Rất phổ biến	Nhiễm virus



Bình thường	Viêm phổi, viêm đường hô hấp, nhiễm trùng đường tiết niệu, nhiễm trùng, viêm tai giữa
<b>Các rối loạn máu và hệ bạch huyết</b>	
Bình thường	Giảm bạch cầu
Không biết	Giảm tiểu cầu
<b>Rối loạn hệ thống miễn dịch</b>	
Không phổ biến	Các phản ứng dị ứng (ví dụ như nổi mề đay)
Không biết	Hội chứng quá mẫn, một phản ứng hệ thống có thể bao gồm sốt, phát ban, viêm gan, sưng hạch, bạch cầu ưa eosin, và các dấu hiệu và triệu chứng đôi khi khác
<b>Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng</b>	
Bình thường	Chán ăn, tăng sự thèm ăn
<b>Rối loạn tâm thần</b>	
Bình thường	Sự chống đối, lú lẫn và rối loạn cảm xúc, trầm cảm, lo âu, căng thẳng, suy nghĩ không bình thường
Không biết	Ảo giác
<b>Rối loạn hệ thần kinh</b>	
Rất phổ biến	Buồn ngủ, chóng mặt, mất điều hòa
Bình thường	Co giật, tăng động, loạn thể tạng, mất trí nhớ, run, mất ngủ, nhức đầu, cảm giác như liệt nhẹ, giảm cảm giác, phối hợp bất thường, rung giật nhãn cầu, tăng, giảm, hoặc không có phản xạ.
Không phổ biến	Hạ huyết áp, suy giảm tinh thần
Không biết	Rối loạn vận động khác (ví dụ như chứng múa giật múa vờn, rối loạn vận động, loạn trương lực cơ)
<b>Rối loạn thị giác</b>	
Bình thường	Rối loạn thị giác như giảm thị lực, nhìn đôi
<b>Rối loạn thính giác</b>	
Bình thường	Chóng mặt
Không biết	Ù tai
<b>Các rối loạn tim</b>	
Không phổ biến	Đánh trống ngực
<b>Rối loạn mạch máu</b>	
Bình thường	Tăng huyết áp, giãn mạch
<b>Rối loạn hô hấp, lồng ngực và trung thất</b>	
Bình thường	Khó thở, viêm phế quản, viêm họng, ho, viêm mũi
<b>Rối loạn tiêu hóa</b>	
Bình thường	Nôn, buồn nôn, bất thường về răng, viêm nước, tiêu chảy, đau bụng, khó tiêu, táo bón, khô miệng hoặc cổ họng, đầy hơi
Không biết	Viêm tụy
<b>Rối loạn gan mật</b>	
Không biết	Viêm gan, vàng da
<b>Rối loạn da và các mô dưới da</b>	
Bình thường	Phù mắt, ban xuất huyết thường được mô tả như vết bầm tím do chấn thương, phát ban, ngứa, mụn trứng cá.
Không biết	Hội chứng Stevens-Johnson, phù mạch, hồng ban đa dạng, rung tóc, phát ban, xanh xao và triệu chứng toàn thân.
<b>Rối loạn cơ xương, mô liên kết và xương</b>	
Bình thường	Đau khớp, đau cơ, đau lưng, co giật
Không biết	Tiêu cơ vân, rung giật cơ
<b>Rối loạn thận và tiết niệu</b>	
Không biết	Suy thận cấp, tiểu không tự chủ

<b>Hệ thống sinh sản và các bệnh vú</b>	
Bình thường	Liệt dương
Không biết	Phi đại vú, vú to ở nam
<b>Rối loạn chung</b>	
Rất phổ biến	Mệt mỏi, sốt.
Bình thường	Phù ngoại biên, bất thường dáng đi, suy nhược, đau, khó chịu, hội chứng cúm.
Không thông dụng	Phù tổng quát.
Không biết	Phản ứng cai thuốc (chủ yếu là lo âu, mất ngủ, buồn nôn, đau, ra mồ hôi), đau ngực.
<b>Chỉ số xét nghiệm sinh hóa</b>	
Bình thường	Giảm bạch cầu, tăng cân
Không thông dụng	Tăng cao men gan SGOT (AST), SGPT (ALT) và bilirubin
Không biết	Biến động đường huyết ở bệnh nhân đái tháo đường, creatine phosphokinase huyết tăng
<b>Chấn thương và ngộ độc</b>	
Bình thường	Chấn thương do tai nạn, gãy xương, trật da

**Tương tác thuốc**

Không quan sát thấy có sự tương tác nào giữa gabapentin và phenobarbital, phenytoin, acid valproic, hay carbamazepin. Các đặc tính dược động học của gabapentin ở trạng thái nồng độ hằng định trong huyết tương là tương tự giữa các đối tượng khỏe mạnh và các bệnh nhân có bệnh động kinh đang điều trị bằng các thuốc chống động kinh này.

Dùng đồng thời gabapentin và các thuốc uống tránh thai chứa norethindron và/hoặc ethinylestradiol, không làm ảnh hưởng đến các đặc tính dược động học ở trạng thái nồng độ hằng định trong huyết tương của cả hai thuốc.

Dùng đồng thời gabapentin với các thuốc kháng acid chứa muối nhôm và muối magnesi làm giảm sinh khả dụng của gabapentin khoảng 20%, do đó nên dùng gabapentin khoảng 2 giờ sau khi uống các thuốc kháng acid.

Sự bài tiết của gabapentin qua thận không bị ảnh hưởng bởi probenecid.

Sự bài tiết của gabapentin qua thận bị giảm nhẹ khi dùng phối hợp với cimetidin, nhưng sự giảm này không có ý nghĩa lâm sàng.

*Các xét nghiệm sinh hóa:* Kết quả dương tính giả đã được báo cáo ở các xét nghiệm sử dụng que thử Ames N-Multistix SG (khi phối hợp thêm gabapentin với các thuốc chống co giật khác). Do đó để xác định protein trong nước tiểu, nên dùng phương pháp kết tủa acid sulfosalicylic đặc hiệu hơn.

**Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai và cho con bú**

**\* Phụ nữ có thai:**

Không có các nghiên cứu đầy đủ và có kiểm chứng ở các phụ nữ mang thai. Vì các nghiên cứu trên hệ sinh sản của động vật không phải luôn luôn đúng với các đáp ứng trên người. Nên chỉ sử dụng thuốc này trong thời kỳ mang thai khi những lợi ích điều trị mang lại lớn hơn những rủi ro tiềm tàng trên phôi thai.

**\* Phụ nữ cho con bú:**

Gabapentin được bài tiết qua sữa người. Ảnh hưởng của gabapentin trên các đứa trẻ đang trong thời kỳ bú sữa mẹ còn chưa được biết. Nên thận trọng khi dùng gabapentin cho các bà mẹ trong thời kỳ cho con bú. Chỉ nên dùng gabapentin ở các bà mẹ trong thời kỳ cho con bú nếu những lợi ích điều trị mang lại lớn hơn một cách rõ ràng so với các nguy cơ có thể có.

**Ảnh hưởng đến khả năng lái xe và vận hành máy móc**

Nên khuyến các bệnh nhân không được lái xe và vận hành các máy có độ nguy hiểm cao cho đến khi biết chắc rằng thuốc này không ảnh hưởng trên khả năng tham gia vào các hoạt động này của họ.

**Quá liều**

Ngộ độc cấp, đe dọa tính mạng chưa được quan sát với các liều gabapentin lên đến 49g. Các triệu chứng của quá liều bao gồm chóng mặt, nhìn đôi, nói lưu lười, buồn ngủ, ngủ lịm, và tiêu chảy nhẹ. Tất cả các bệnh nhân này đều hồi phục hoàn toàn sau khi được điều trị hỗ trợ. Sự giảm hấp thụ của gabapentin ở liều cao có thể làm hạn chế sự hấp thu của thuốc tại thời điểm bệnh nhân bị quá liều và điều này làm giảm thiểu mức độ ngộ độc do dùng quá liều.

Mặc dù gabapentin có thể được đưa ra khỏi cơ thể bằng phương pháp thẩm phân lọc máu, nhưng theo những kinh nghiệm đã có thì thường là không cần đến phương pháp này. Tuy nhiên, với những bệnh nhân bị suy thận nặng, thẩm phân lọc máu có thể được chỉ định. Không xác định được liều gây chết của gabapentin ở chuột đồng và chuột bạch dùng với liều cao đến 8000 mg/kg. Các triệu chứng của ngộ độc cấp bao gồm: mất điều vận, khó thở, sa mí mắt, giảm hoạt động hoặc dễ bị kích động.

**Bảo quản**

Trong bao bì kín, tránh ẩm, tránh ánh sáng, nhiệt độ dưới 30°C.

**Hạn dùng:** 2 năm kể từ ngày sản xuất.

**ĐỌC KỸ HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG TRƯỚC KHI DÙNG ĐỂ THUỐC TRÁNH XA TÁM TAY TRẺ EM.**

Nhà sản xuất



**Công ty cổ phần Dược phẩm CPC1 Hà Nội**  
Cụm công nghiệp Hà Bình Phương, Thường Tín, Hà Nội

T2-D00001  
T2-02.11.19