https://vnras.com/drug/

Rx Thuốc bán theo đơn

PREMILIN 75 mg

Viên nang cứng

Thành phần

- ***Hoạt chất:*** Pregabalin 75 mg.
- ***Tá dược:*** Lactose monohydrat, tinh bột ngô, magnesi stearat.

Dược lực học

- Pregabalin là một chất chống co giật. Cơ chế tác dụng chính xác của pregabalin chưa được biết. Giống như gabapetin, pregabalin gắn mạnh vào tiểu đơn vị α_2-δ của kênh calci điện thế trong các mô của hệ thần kinh trung ương. Trên *in vitro*, pregabalin làm giảm phóng thích (phụ thuộc calci) một số chất dẫn truyền thần kinh như glutamat, norepinephrin, peptid liên quan với gen calcitonin (CGRP) và chất P bằng cách điều hoà chức năng kênh calci.
- Pregabalin không gắn trực tiếp vào thụ thể $GABA_A$, $GABA_B$ hay thụ thể benzodiazepin, không làm tăng đáp ứng $GABA_A$ trên các nơron nuôi cấy, không làm thay đổi nồng độ GABA trong não chuột, không ảnh hưởng đến sự tạo thành hay phân huỷ GABA. Trên các nơron nuôi cấy, sử dụng pregabalin kéo dài làm tăng mật độ protein vận chuyển GABA và tăng tốc độ vận chuyển GABA.
- Pregabalin không chẹn kênh natri, không có tác dụng với thụ thể opiat và không làm thay đổi hoạt tính của enzym cyclooxygenase.
- Pregabalin không tác dụng với thụ thể serotonin và dopamin, không ức chế sự tái tạo dopamin, serotonin hoặc noradrenalin.

Dược động học

- ***Hấp thu:*** Pregabalin được hấp thu nhanh sau khi uống. Nồng độ đỉnh của thuốc trong huyết tương đạt được sau 1,5 giờ. Sinh khả dụng của pregabalin khi dùng theo đường uống ≥ 90% và không phụ thuộc vào liều. Thức ăn làm giảm nồng độ đỉnh trong huyết tương khoảng 25 – 30% và kéo dài thời gian đạt nồng độ đỉnh trong huyết tương khoảng 3 giờ nhưng không ảnh hưởng đến mức độ hấp thu. Trạng thái ổn định đạt được sau 1 – 2 ngày.
- ***Phân bố:*** Pregabalin không gắn với protein huyết tương. Pregabalin là chất nền cho hệ thống vận chuyển L – có vai trò vận chuyển các amino acid lớn xuyên qua hàng rào máu não. Mặc dù không có dữ liệu ở người nhưng các nghiên cứu tiền lâm sàng cho thấy pregabalin qua được hàng rào máu não trên chuột cống, chuột nhắt, khỉ; qua được hàng rào nhau thai và dịch tiết sữa trên chuột cống. Thể tích phân bố biểu kiến sau khi uống đạt khoảng 0,5 lít/kg.
- ***Chuyển hoá:*** Pregabalin được chuyển hóa không đáng kể trong cơ thể người.
- ***Thải trừ:*** Khoảng 98% pregabalin được thải trừ qua nước tiểu ở dạng không chuyển hóa. Thời gian bán thải trung bình 6,3 giờ. Pregabalin bị loại bỏ bởi thẩm phân máu.

Dược động học ở một số đối tượng lâm sàng đặc biệt:

- *Chủng tộc:* Dược động học của pregabalin thay đổi không đáng kể theo chủng tộc.
- *Giới tính:* Các thử nghiệm lâm sàng cho thấy dược động học của pregabalin không có khác biệt đáng kể theo giới tính.
- *Người cao tuổi (> 65 tuổi):* Độ thanh thải pregabalin có khuynh hướng giảm khi độ tuổi tăng, phù hợp với việc giảm độ thanh thải creatinin theo độ tuổi. Cần giảm liều ở bệnh nhân có chức năng thận suy giảm liên quan đến độ tuổi.
- *Trẻ em:* Dược động học của pregabalin chưa được nghiên cứu đầy đủ ở trẻ em.
- *Bệnh nhân suy thận và thẩm phân máu:* Độ thanh thải pregabalin gần như tỉ lệ với độ thanh thải creatinin. Cần giảm liều ở bệnh nhân suy thận. Pregabalin được đào thải khỏi huyết tương bằng quá trình thẩm phân máu, sau 4 giờ thẩm phân, nồng độ huyết tương giảm khoảng 50%. Vì vậy cần điều chỉnh liều ở bệnh nhân đang thẩm phân máu.
- *Bệnh nhân suy gan:* Không có nghiên cứu dược động học rõ ràng ở bệnh nhân suy gan. Tuy nhiên, pregabalin không được chuyển hóa mạnh qua gan và được đào thải chủ yếu qua thận dưới dạng nguyên vẹn. Vì vậy suy giảm chức năng gan không được đánh giá làm thay đổi lớn nồng độ pregabalin trong huyết tương.

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.
- Rối loạn lo âu.
- Đau thần kinh liên quan đến đau thần kinh ngoại vi ở bệnh nhân đái tháo đường, đau thần kinh sau bệnh herpes.
- Đau do xơ cơ.

Liều lượng và cách dùng

Liều lượng:

Động kinh:

- Liều khởi đầu: 75 mg x 2 lần/ngày.
- Tùy theo sự dung nạp và đáp ứng của từng bệnh nhân, có thể tăng liều lên 300 mg/ngày sau 1 tuần, sau đó tăng liều đến 600 mg/ngày sau tuần tiếp theo.
- Liều duy trì hiệu quả: 150 – 600 mg/ngày, chia 2 – 3 lần/ngày

Rối loạn lo âu:

- Liều khởi đầu: 75 mg x 2 lần/ngày.
- Có thể tăng liều từng bước 150 mg/tuần đến tối đa 600 mg/ngày.

Đau thần kinh:

- Liều khởi đầu: 75 mg x 2 lần/ngày.
- Tùy theo sự dung nạp và đáp ứng của từng bệnh nhân, có thể tăng liều lên 300 mg/ngày sau 3 – 7 ngày, sau đó tăng liều đến 600 mg/ngày sau tuần tiếp theo.

Đau do xơ cơ:

- Liều khởi đầu: 75 mg x 2 lần/ngày.
- Tùy theo sự dung nạp và đáp ứng của từng bệnh nhân, có thể tăng liều lên 300 mg/ngày, chia 2 lần/ngày sau 1 tuần. Có thể tăng liều đến 450 mg/ngày nếu cần thiết.

Chỉnh liều ở bệnh nhân suy thận:

Điều chỉnh liều ở bệnh nhân suy giảm chức năng thận hoặc đang được thẩm tách máu được đề nghị trong bảng sau:

Bảng 1. Liều của pregabalin dựa vào chức năng thận

QD = liều đơn/ngày, BID = chia 2 liều/ngày, TID = chia 3 liều/ngày.

Thanh thải Creatinin (CL_{cr}) (ml/phút)	Tổng liều Pregabalin hàng ngày		Chế độ trị liệu
	Liều khởi đầu (mg/ ngày)	Liều tối đa (mg/ ngày)	
≥ 30 - < 60	75	300	BID hoặc TID
≥ 15 - < 30	25 – 50	150	QD hoặc BID
< 15	25	75	QD
Liều bổ trợ sau thẩm tách máu			
	25	100	Liều đơn*

* Liều bổ trợ là liều đơn bổ sung.

Cách dùng:

- Dùng đường uống, chia làm 2 – 3 lần mỗi ngày, có thể sử dụng cùng hoặc không cùng với bữa ăn.
- Cần giảm liều pregabalin từ từ trong ít nhất 1 tuần trước khi ngừng sử dụng thuốc để tránh sự tăng tần suất động kinh như đối với các thuốc chống co giật nói chung.

Chống chỉ định

Quá mẫn cảm với pregabalin hay bất kỳ thành phần nào của thuốc.

Tác dụng phụ

- Phản ứng dị ứng xảy ra khi bắt đầu điều trị với pregabalin bao gồm phát ban, mụn nước, nổi mề đay, khó thở, thở khò khè.
- *Thường gặp:* Tác dụng phụ thường gặp nhất đã được báo cáo là chóng mặt, buồn ngủ. Các tác dụng phụ khác bao gồm: rối loạn thị lực, hoa mắt, tăng cảm giác ngon miệng, tăng cân, mất điều hòa, chứng loạn vận ngôn, run, ngủ lịm, mệt mỏi, phù nề, giảm trí nhớ, sảng khoái, táo bón, khô miệng, nôn mửa, đầy hơi, phù ngoại biên, mất hoặc giảm dục năng, rối loạn cương dương. Mất tập trung, rối loạn trí nhớ, điều phối bất thường, mất cân bằng cũng thường xảy ra.
- *Ít gặp:* ngất, suy tim sung huyết.
- *Hiếm gặp:* suy thận có hồi phục, tăng creatin kinase, tiêu cơ vân. Hội chứng Stevens-Johnson cũng đã được báo cáo.

https://vnras.com/drug/

Thận trọng

- Phù mạch, có thể đe doạ đến tính mạng và suy hô hấp cấp cần được điều trị khẩn cấp, đã được báo cáo trong suốt quá trình giám sát ở bệnh nhân sau khi uống liều đầu tiên và ở bệnh nhân điều trị với pregabalin trong thời gian dài. Bệnh nhân dùng thuốc khác có liên quan đến phù mạch (thuốc ức chế men chuyển) có thể tăng nguy cơ phù mạch.
- Ngừng sử dụng pregabalin khi có phản ứng quá mẫn xảy ra, bao gồm phù mạch (mặt, quanh miệng, đường hô hấp trên).
- Ngừng thuốc đột ngột gây tăng tần suất co giật, những dấu hiệu lệ thuộc thuốc như mất ngủ, buồn nôn, nhức đầu, tiêu chảy. Giảm liều pregabalin từ từ trong vòng 1 tuần. Cần đánh giá bệnh nhân về tiền sử lạm dụng thuốc và theo dõi các triệu chứng khi lạm dụng pregabalin.
- Trẻ em dưới 18 tuổi, người cao tuổi.
- Tăng cân: Pregabalin gây tăng trọng lượng cơ thể liên quan đến liều và thời gian dùng thuốc; tuy nhiên, tăng cân không liên quan đến chỉ số khối lượng cơ thể (BMI) trước khi điều trị, giới tính hoặc tuổi, và cũng không do phù. Tuy trong nghiên cứu ngắn hạn có kiểm soát, tăng cân không kết hợp với biến đổi lâm sàng quan trọng về huyết áp, nhưng tác dụng lâu dài về tim mạch chưa được làm rõ. Ngoài ra, pregabalin không làm mất kiểm soát glucose huyết.
- Bệnh nhân đái tháo đường bị tăng cân trong quá trình điều trị với pregabalin có thể cần phải điều chỉnh các thuốc chống đái tháo đường đang sử dụng.
- Suy thận đã được báo cáo khi điều trị với pregabalin, trong một số trường hợp, tác dụng này có thể đảo ngược khi ngừng sử dụng thuốc.
- Suy tim sung huyết đã được báo cáo ở vài bệnh nhân đang điều trị với pregabalin, phần lớn ở bệnh nhân cao tuổi có chức năng tim mạch suy giảm và có thể mất đi khi ngừng sử dụng thuốc. Cần thận trọng khi sử dụng pregabalin ở những bệnh nhân này.
- Các thuốc chống co giật, kể cả pregabalin thường làm tăng nguy cơ có suy nghĩ/ hành vi tự sát. Do đó, bệnh nhân cần được giám sát chặt chẽ về các biểu hiện trầm cảm, khuynh hướng muốn tự sát, những hành vi bất thường trong quá trình điều trị và cần thông báo với bác sĩ ngay khi các dấu hiệu trên xuất hiện.
- Các ảnh hưởng đến thần kinh trung ương (chóng mặt, buồn ngủ, mất ý thức, lú lẫn, suy giảm tinh thần): Pregabalin có thể gây chóng mặt, buồn ngủ nên làm tăng nguy cơ gây ra các tai nạn bất ngờ (té ngã) ở người cao tuổi. Cũng có báo cáo về khả năng gây mất ý thức, lú lẫn, suy giảm tinh thần. Bệnh nhân cần được cảnh báo về những tác động trên.
- Những tác động trên thị giác: Đã có báo cáo về các tác dụng không mong muốn trên thị giác (mất thị giác, nhìn mờ, các thay đổi khác về độ nhạy bén của thị giác), nhiều triệu chứng chỉ biểu hiện thoáng qua và được cải thiện khi ngừng sử dụng thuốc.
- Không có đủ dữ liệu về việc ngừng sử dụng thuốc chống động kinh khác trong chế độ phối hợp với pregabalin để chuyển sang pregabalin đơn trị liệu khi đã kiểm soát được cơn động kinh.
- Các triệu chứng khi ngừng thuốc: Sau khi ngừng điều trị với pregabalin, các triệu chứng ngừng thuốc có thể gặp như mất ngủ, đau đầu, buồn nôn, mệt mỏi, tiêu chảy, hội chứng cúm, căng thẳng, trầm cảm, đau, tiết nhiều mồ hôi, chóng mặt. Cần thông báo cho bệnh nhân về vấn đề trên ngay khi khởi đầu trị liệu. Các cơn động kinh cũng có thể xảy trong và ngay sau khi ngừng sử dụng pregabalin.
- Trong điều trị đau thần kinh trung ương do tổn thương tủy sống, các tác dụng không mong muốn nói chung, trên hệ thần kinh trung ương và đặc biệt tình trạng buồn ngủ gia tăng. Cần cân nhắc khi sử dụng pregabalin.
- Đã có báo cáo về việc giảm chức năng đường tiêu hóa dưới (tắc ruột, táo bón) khi sử dụng pregabalin phối hợp với các thuốc có khả năng gây táo bón (thuốc giảm đau opioid). Khi phối hợp các thuốc trên, có thể cần biện pháp ngăn ngừa táo bón, đặc biệt ở bệnh nhân nữ và người cao tuổi.
- Cần thận trọng với các bệnh nhân có tiền sử nghiện thuốc. Theo dõi các dấu hiệu lạm dụng thuốc (như nhờn thuốc, xu hướng tăng liều hay hành vi tìm kiếm thuốc).
- Các trường hợp bệnh não đã được báo cáo, phần lớn xuất hiện ở bệnh nhân có các bệnh nguy cơ.
- Chế phẩm Premilin 75 mg có chứa lactose, bệnh nhân mắc các rối loạn di truyền hiếm gặp về dung nạp galactose, thiếu hụt Lapp lactase hay rối loạn hấp thu glucose – galactose không nên sử dụng thuốc này.

Tương tác thuốc và các dạng tương tác khác

- Do pregabalin được thải trừ chủ yếu qua nước tiểu ở dạng chưa chuyển hóa, một lượng không đáng kể được chuyển hóa (< 2% của liều dùng được tìm thấy trong nước tiểu ở dạng chuyển hóa), không gắn với protein huyết tương, pregabalin không tạo ra tương tác, hoặc bị tương tác dược động học với các thuốc chống động kinh (carbamazepin, lamotrigin, phenytoin, phenobarbital, valproat và topiramat), thuốc trị đái tháo đường (glyburid, insulin, metformin), thuốc lợi tiểu (furosemid), thuốc tránh thai đường uống.
- *Thuốc ức chế men chuyển:* tăng nguy cơ phù mạch khi dùng chung với pregabalin.
- *Thuốc chống động kinh:* Tốc độ hấp thu pregabalin có thể giảm nhẹ khi dùng chung với gabapentin.
- *Thuốc trị đái tháo đường:* Tăng nguy cơ tăng cân và phù ngoại biên khi dùng pregabalin với thiazolidindion.
- *Thuốc ức chế thần kinh trung ương (opiat, benzodiazepin):* có thể ảnh hưởng xấu đến hệ thần kinh trung ương (buồn ngủ).
- *Lorazepam, oxycodon, ethanol:* tăng thêm rối loạn nhận thức và chức năng vận động khi dùng phối hợp với pregabalin. Không có tác động lâm sàng quan trọng nào đến sự hô hấp.

Quá liều và cách xử trí

- Các dấu hiệu của việc dùng thuốc quá liều có thể bao gồm rối loạn cảm xúc, ngủ gà, tình trạng lú lẫn, trầm cảm, lo âu, bồn chồn.
- Không có tác dụng không mong muốn nào được báo cáo trong trường hợp quá liều đến 15 g. Quá liều pregabalin cần tiến hành các biện pháp bổ trợ có thể gồm cả thẩm tách máu nếu cần thiết.

Sử dụng thuốc cho phụ nữ mang thai và cho con bú

- ***Thời kỳ mang thai:*** Chưa có các dữ liệu đầy đủ về dùng pregabalin trên phụ nữ có thai. Nguy cơ về rủi ro trên người chưa được biết. Do vậy, không dùng pregabalin khi đang mang thai trừ khi lợi ích mang lại cho người mẹ quan trọng hơn những khả năng rủi ro có thể xảy ra cho thai nhi. Sử dụng biện pháp tránh thai có hiệu quả cho bệnh nhân nữ có khả năng thụ thai trong thời gian dùng thuốc.
- ***Thời kỳ cho con bú:*** Chưa biết pregabalin có bài tiết qua sữa mẹ 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 vận hành tàu xe, máy móc

Pregabalin có thể gây chóng mặt, buồn ngủ, rối loạn thị giác. Sử dụng thuốc thận trọng khi vận hành tàu xe, máy móc.

Trình bày

Hộp 03 vỉ x 10 viên nang cứng. Vỉ bấm Al – PVC trong.

Hộp 10 vỉ x 10 viên nang cứng. Vỉ bấm Al – PVC trong.

Bảo quản: Nơi khô, dưới 30°C. Tránh ánh sáng.

Tiêu chuẩn: Tiêu chuẩn cơ sở.

Hạn dùng: 36 tháng (kể từ ngày sản xuất).

Lưu ý

Thuốc này chỉ dùng theo đơn của bác sĩ.

Không dùng thuốc quá liều chỉ định

Không dùng thuốc quá hạn dùng ghi trên bao bì

Thông báo cho bác sĩ những tác dụng không mong muốn gặp phải khi sử dụng thuốc.

Nếu cần thêm thông tin xin hỏi ý kiến bác sĩ.

HASAN

CÔNG TY TNHH HASAN - DERMAPHARM

Đường số 2, Khu công nghiệp Đồng An,

Bình Dương, Việt Nam