

QAB 143

BỘ Y TẾ
CỤC QUẢN LÝ DƯỢC
ĐÃ PHÊ DUYỆT

Lần đầu: 27/12/13



Thành phẩm: Epalrestat50mg
tá được vừa đủ.....1 viên
Chỉ định:
Phòng ngừa và điều trị các biến chứng thần kinh do tiểu đường.
Chống chỉ định:
Chống chỉ định cho bệnh nhân quá mẫn cảm với Epalrestat.
Liều lượng và cách dùng: Liều thông thường với người lớn 50 mg/lần,
3 lần/ngày, uống trước khi ăn. Liều lượng có thể được điều chỉnh tùy

thuộc tình trạng bệnh tật, tuổi tác. Thời gian điều trị tối thiểu để đạt
được hiệu quả là 12 tuần.
Các thông tin khác: Xin xem tờ hướng dẫn sử dụng.
Bảo quản: Nơi khô mát dưới 30°C, tránh ánh sáng.
Tiêu chuẩn chất lượng: TCCS.

ĐỂ XA TẮM TAY TRẺ EM.
ĐỌC KỸ HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG TRƯỚC KHI DÙNG.



HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG THUỐC

Rx Thuốc bán theo đơn

EPALREST 50mg

Epalrestat 50mg

TRÌNH BÀY

EPALREST trình bày ở dạng viên bao phim hình tròn, màu trắng. Mỗi viên chứa 50 mg Epalrestat.
Hộp 2 vỉ x 14 viên nén bao phim.

ĐƯỢC LỰC HỌC

Epalrestat là chất ức chế thuận nghịch, không cạnh tranh men khử aldose, một men tham gia vào tiến trình polyol. Trong điều kiện đường bình thường, hầu hết glucose tế bào được phosphoryl hóa thành glucose-6-phosphate bởi enzyme hexokinase. Khoảng 3% lượng glucose không phosphoryl hóa chuyển hóa theo tiến trình polyol thành sorbitol bởi men khử aldose với sự có mặt của nicotinamideadenosine dinucleotide phosphate (NADPH). Sorbitol sau đó được chuyển thành fructose bởi enzyme sorbitol dehydrogenase với sự tham gia đồng thời của dạng oxy hóa của nicotinamide adenine dinucleotide (NAD⁺). Trong điều kiện đường cao, tiến trình polyol được gia tăng và chiếm tới trên 90% sản phẩm chuyển hóa glucose.

Các nghiên cứu cho thấy việc tăng cường hoạt tính tiến trình polyol gây nên một chuỗi các mất cân bằng chuyển hóa có thể làm tăng các biến chứng vi mạch kéo dài do tiểu đường như bệnh lý thần kinh, mắt và thận, cũng như các biến chứng mạch lớn bao gồm nhồi máu cơ tim và đột quỵ. Tình trạng tăng đường và tăng hoạt tính khử aldose gây ra quá trình tích lũy sorbitol và tăng tính thấm tế bào, gây thiếu myo-inositol. Từ đó làm giảm hoạt tính sodium-potassium adenosine triphosphate và làm thay đổi chuyển hóa tế bào và cấu trúc màng. Sự mất cân bằng oxy hóa-khử xảy ra do tăng tỷ lệ NADPH:NAD⁺ có thể làm hoạt hóa protein kinase C và hình thành các gốc oxy hoạt tính và các sản phẩm sacarin hóa. Sự hoạt hóa protein kinase C gia tăng biểu hiện bề mặt của các phân tử gắn kết nội mạc, từ đó có thể gia tăng quá trình xơ vữa động mạch.

Việc ức chế men khử aldose có thể khắc phục các rối loạn chuyển hóa liên quan đến tiến trình polyol và bệnh học của các biến chứng do tiểu đường.

ĐƯỢC ĐỘNG HỌC

Theo các tài liệu hướng dẫn sử dụng được cấp phép cho epalrestat, nồng độ tối đa trong huyết tương là 3.9 µg/ml đạt được khoảng 1 giờ sau khi uống liều 50 mg sau khi ăn ở người khỏe mạnh, diện tích đường cong nồng độ - thời gian (AUC_{0-∞}) là 6.4 µghour/ml. Chuyển hóa của thuốc xảy ra ở gan theo các phản ứng pha 1 và pha 2. Trong quá trình chuyển hóa pha 1, epalrestat được chuyển hóa bởi quá trình hydroxyl hóa thành 2 sản phẩm chuyển hóa là các hợp chất dạng monohydroxy và dihydroxy. Các enzyme tham gia vào quá trình chuyển hóa pha 1 chưa được xác định rõ. Các chất chuyển hóa pha 1 sau đó được chuyển hóa bởi các phản ứng trong pha 2 tạo ra các dạng liên kết glucuronide và sulfate. Epalrestat nguyên dạng không chuyển hóa được bài tiết vào nước tiểu cùng với dạng liên hợp sulfate của 2 sản phẩm chuyển hóa. Epalrestat có tỷ lệ liên kết protein cao là 90.1%. Chưa có nghiên cứu về được động học của epalrestat tiến hành trên bệnh nhân suy gan hoặc thận, trên bệnh nhân tiểu đường hoặc bệnh nhân cao tuổi. Chưa có tương tác thuốc nào với epalrestat được báo cáo.

CHỈ ĐỊNH

Phòng ngừa và điều trị các biến chứng thần kinh do tiểu đường: Cải thiện các triệu chứng chủ quan đi kèm các tổn thương thần kinh ngoại vi (cảm giác tê bì, đau buốt), rối loạn cảm giác rung.

LIỀU LƯỢNG VÀ CÁCH DÙNG

EPALREST được dùng đường uống, liều thông thường với người lớn 50 mg/lần, 3 lần/ngày, uống trước khi ăn.

Liều lượng có thể được điều chỉnh tùy thuộc tình trạng bệnh tật, tuổi tác. Thời gian điều trị tối thiểu để đạt được hiệu quả của epalrestat là 12 tuần.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

Chống chỉ định cho bệnh nhân quá mẫn cảm với Epalrestat.

LƯU Ý/ THẬN TRỌNG KHI SỬ DỤNG

Hiệu quả của thuốc chưa được thiết lập ở những bệnh nhân biến chứng thần kinh ngoại vi do tiểu đường không có khả năng hồi phục, do đó những bệnh nhân này cần được theo dõi trong quá trình sử dụng thuốc, có thể thay thế phương pháp điều trị khác thích hợp hơn nếu hiệu quả điều trị chưa được ghi nhận sau khi sử dụng thuốc trong 12 tuần.

Việc sử dụng epalrestat ở bệnh nhân suy gan hoặc thận chưa được đánh giá đầy đủ, tuy nhiên nồng độ men gan tăng có thể gia tăng nồng độ creatinin huyết thanh và ure huyết. Khi sử dụng thuốc nước tiểu có thể biến màu thành nâu vàng hoặc đỏ, tuy nhiên không gây ảnh hưởng tới sức khỏe.

TƯƠNG TÁC THUỐC

Chưa có tương tác thuốc được báo cáo.

PHỤ NỮ MANG THAI VÀ CHO CON BÚ

Epalrestat không nằm trong danh mục thuốc chống chỉ định cho phụ nữ mang thai, tuy nhiên cần cân nhắc sử dụng thuốc khi lợi ích điều trị vượt trội hơn nguy cơ rủi ro có thể xảy ra đối với thai do việc sử dụng thuốc. Cần tránh sử dụng thuốc khi đang cho con bú.

TÁC DỤNG KHI ĐIỀU KHIỂN XE VÀ VẬN HÀNH MÁY:

Không có tài liệu báo cáo.

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN

Các tác dụng không mong muốn đã được báo cáo ở 129 (2.5%) trong tổng số 5249 bệnh nhân. Các triệu chứng được báo cáo cụ thể bao gồm: rối loạn chức năng gan (23.2%), buồn nôn và/hoặc nôn (10.6%), dạ dày khó chịu (7.7%), nổi ban da (4.9%), rối loạn chức năng thận (2.8%), tê bì (4.2%), phù (4.9%), tiêu chảy (5.6%), các triệu chứng không đặc hiệu khác (51%). Không có trường hợp nào xảy ra ở mức độ nặng.

QUẢN LÝ VÀ XỬ TRÍ

Không có tài liệu báo cáo.

Thông báo cho bác sĩ những tác dụng phụ gặp phải trong quá trình sử dụng thuốc.

BẢO QUẢN: Bảo quản thuốc ở nơi khô mát, tránh ánh sáng, nhiệt độ dưới 30°C.

HẠN DÙNG: 36 tháng kể từ ngày sản xuất.

TIÊU CHUẨN: TCCS.

THUỐC CHỈ DÙNG THEO ĐƠN CỦA BÁC SỸ

ĐỂ XA TẮM TAY TRẺ EM

ĐỌC KỸ HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG TRƯỚC KHI DÙNG

NẾU CẦN THÊM THÔNG TIN HỎI Ý KIẾN CỦA BÁC SỸ, DƯỢC SỸ



Sản xuất tại: CÔNG TY CỔ PHẦN DƯỢC PHẨM SAO KIM
KCN Quang Minh - Mê Linh - Hà Nội - Việt Nam
ĐT: 04.35841213/14/15 • Fax: 04.35840788

PHÓ CỤC TRƯỞNG
Nguyễn Văn Thanh