



Methycobal[®] Viên nén

MECOBALAMIN

METHYCOBAL là một chế phẩm có gốc mecobalamin dùng để điều trị các bệnh lý thần kinh ngoại biên được điều chế bằng công nghệ gốc của công ty Eisai Co., Ltd. Về mặt sinh hóa, mecobalamin tham gia vào chu trình chuyển nhóm methyl như một vitamin B₁₂ chứa coenzyme có trong máu.

Mô tả
Mỗi viên nén METHYCOBAL chứa 500 µg mecobalamin.

Tài liệu
Calcium stearate, Microcrystalline cellulose, Lactose, Corn starch, Hydrated silicon dioxide, Precipitated calcium carbonate, Talc, Titanium oxide, Pullulan, Macrogol 6000, Povidone, Hydroxypropylcellulose, Stearic acid, White shellac, Carmauba wax, Sucrose

Hoạt chất chính
Tên gốc: Mecobalamin
Tên hóa học: α-(5,6-Dimethylbenzimidazolyl)-C-methylcobamide
Công thức phân tử: C₃₇H₄₂CoN₇O₆P
Trọng lượng phân tử: 1.344,40
Công thức cấu tạo:



Tính chất lý hóa
Mecobalamin tồn tại tự nhiên dưới dạng tinh thể màu đỏ sẫm hoặc bột tinh thể, không mùi, không v, ít tan trong nước và ethanol, hầu như không tan trong acetone và ether. Nó bị ánh sáng phân hủy.

Chỉ định
Các bệnh lý thần kinh ngoại biên.

Chống chỉ định
Những bệnh nhân có tiền sử quá mẫn với Mecobalamin.

Tương tác thuốc
Không có sự tương tác thuốc đặc hiệu nào được ghi nhận.

Liều lượng và cách dùng
Liều thông thường đối với người lớn là uống 3 viên x 3 lần/ngày (1.500 µg mecobalamin).
Liều dùng nên được chỉnh tùy theo tuổi bệnh nhân và mức độ nghiêm trọng của các triệu chứng.

Sử dụng cho phụ nữ có thai và cho con bú
Độ an toàn của viên nén METHYCOBAL, trong khi có thai chưa được xác định. Chỉ nên dùng thuốc này cho bệnh nhân có thai hoặc những phụ nữ nghi ngờ đang có thai nếu lợi ích điều trị dự kiến cao hơn bất kỳ nguy cơ nào có thể xảy ra.

Tác động khi lái xe và vận hành máy móc
Dựa trên các đặc tính dược lý học và các báo cáo về phản ứng phụ, không chắc là METHYCOBAL làm suy giảm khả năng lái xe hoặc sử dụng máy móc.

Quai liều
Đến nay chưa có kinh nghiệm về quai liều có chủ ý.
Thuốc giải độc đặc hiệu chưa được biết.

Thận trọng
(1) Tổng quát
Không nên dùng thuốc trong thời gian quá lâu nếu không thấy đáp ứng sau một thời gian đầu tiên.
(2) Tác dụng không mong muốn
Các triệu chứng như chán ăn, buồn nôn, tiêu chảy hoặc các triệu chứng rối loạn đường tiêu hóa khác có thể xảy ra sau khi dùng thuốc.
Thông báo cho bác sĩ những tác dụng không mong muốn gặp phải khi sử dụng thuốc.

Được lý học
Được bào chế

- Mecobalamin là một loại coenzyme vitamin B₁₂ nội sinh**
Mecobalamin giữ vai trò quan trọng trong việc chuyển methyl như một coenzyme trong sự tổng hợp methionine từ homocysteine.
- Mecobalamin được vận chuyển hiệu quả đến các cơ quan tế bào thần kinh và tăng cường tổng hợp acid nucleic và protein**
Ở chuột cống, mecobalamin được vận chuyển đến các cơ quan tế bào thần kinh tốt hơn so với cyanocobalamin. Trong thực nghiệm với các tế bào có nguồn gốc từ não và các tế bào thần kinh tủy sống, đã ghi nhận có liên quan trong sự tổng hợp thymidine từ deoxyuridine, tăng sử dụng acid folic bị ứ đọng và tăng chuyển hóa acid nucleic. Ngoài ra, mecobalamin còn tăng cường tổng hợp acid nucleic và protein ở chuột nhắt nhiều hơn so với cobalamine.
- Mecobalamin tăng cường sự vận chuyển qua sợi trục và tái sinh sợi trục**
Mecobalamin bình thường hóa sự vận chuyển qua sợi trục trong tế bào thần kinh tọa ở chuột cống đã được gây bệnh đa xơ cứng bằng streptozotocin. Mecobalamin cho thấy tác dụng ức chế về mặt bệnh học thần kinh và điện sinh lý trên sự thoái hóa dây thần kinh trong các bệnh thần kinh gây ra do thuốc như adriamycin, acrylamide và vincristine ở chuột cống và thỏ. Trong các mô hình thoái hóa sợi trục ở chuột nhắt và bệnh thần kinh ở chuột cống bị bệnh đa xơ cứng thực nghiệm.
- Mecobalamin tăng cường tạo myelin (tổng hợp phospholipid)**
Mecobalamin tăng cường tổng hợp lecithin là thành phần chính của lipid của bao myelin và tăng tạo myelin của các tế bào thần kinh trong nuôi cấy mô chuột cống tốt hơn so với cobalamine.
- Mecobalamin phục hồi sự dẫn truyền chậm qua synap và phục hồi sự giảm chất dẫn truyền thần kinh trở về bình thường**
Mecobalamin phục hồi sớm cảm ứng có thể có ở màng tận cùng tăng cách làm tăng tính ổn định kích thích của sợi thần kinh trong tế bào thần kinh tọa đã bị ức chế ở chuột cống. Ngoài ra, mecobalamin bình thường hóa mức acetylcholine trong mô não đã bị giảm của chuột cống được cho chế độ ăn thiếu choline.

Được đồng hợp
1. Đồng liều đơn

Sau khi cho những người nam tình nguyện khỏe mạnh uống một liều đơn 120 µg hoặc 1.500 µg ¹⁴C-METHYCOBAL, nồng độ vitamin B₁₂ toàn phần cao nhất trong huyết thanh đạt được cho cả hai liều là 3 giờ và điều này phụ thuộc liều. Thời gian bán hủy, sự gia tăng về nồng độ vitamin B₁₂ toàn phần trong huyết thanh và diện tích dưới đường cong nồng độ trong huyết thanh (AUC⁰⁻²⁴) được cho thấy trong số lấy và bảng dưới đây. 40-60% lượng vitamin B₁₂ toàn phần tích lũy được bài tiết trong nước tiểu 24 giờ sau khi dùng đã được bài xuất trong vòng 3 giờ đầu.

Lưu ý) Liều đơn 1.500 µg chưa được duyệt!



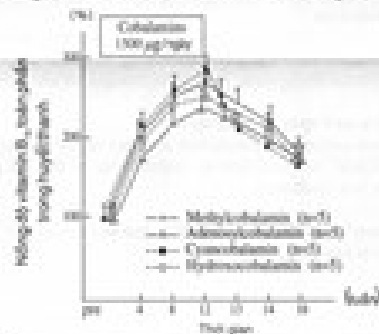
Biểu đồ nồng độ vitamin B₁₂ toàn phần trong huyết thanh

| Liều dùng | T _{max} (giờ) | C _{max} (µg/mL) | ΔC _{max} (µg/mL) | ΔC _{max} (%) | ΔAUC ⁰⁻²⁴ (giờ µg/mL) | t _{1/2} [*] (giờ) |
|-----------|------------------------|--------------------------|---------------------------|-----------------------|----------------------------------|-------------------------------------|
| 120 µg | 2,8±0,2 | 743±47 | 37±15 | 5,1±2,1 | 168±58 | N.A. |
| 1500 µg | 3,6±0,5 | 972±95 | 250±51 | 26,0±7,9 | 2033±910 | 12,5 |

*1) Được tính theo phương pháp tính trung từ sự gia tăng được quan sát ở các trị số sau 12 giờ, khi so với các trị số trước khi dùng thuốc.
*2) Được tính từ trung bình của các trị số sau 24-48 giờ
Mean ± S.E., n=6

2. Đồng liều lặp lại

Nồng độ vitamin B₁₂ toàn phần trong huyết thanh đã được xác định ở những người nam tình nguyện khỏe mạnh uống liều METHYCOBAL 1.500 µg/ngày trong 12 tuần liên tiếp. Nồng độ vitamin B₁₂ toàn phần trong huyết thanh cũng đã được xác định ở nhóm bệnh nhân này trong 4 tuần ngay sau khi dùng liều cuối cùng. Nồng độ trong huyết thanh tăng lên trong 4 tuần đầu sau khi dùng, đạt đến một trị số cao gấp hai lần nồng độ ban đầu. Sau đó, có sự tăng dần đạt đến một nồng độ cao nhất gấp khoảng 2,8 lần trị số ban đầu vào tuần thứ 12 sau khi dùng. Nồng độ trong huyết thanh giảm sau khi dùng liều cuối cùng (12 tuần), nhưng vẫn còn gấp khoảng 1,8 lần mức đầu tiên 4 tuần sau khi dùng liều cuối cùng.



Quy cách đóng gói

- Hộp 3 vỉ x 10 viên/nén
- Hộp 50 vỉ x 10 viên/nén

Hạn dùng

36 tháng kể từ ngày sản xuất.

(Bảo quản và sử dụng)

(Bảo quản)

METHYCOBAL nên được bảo quản ở nhiệt độ phòng không quá 30° C, tránh ánh sáng và tránh ẩm sau khi mở nắp hộp.

(Ngày hết hạn)

Thuốc này chỉ được sử dụng trước ngày hết hạn ghi trên nhãn hoặc bao bì.

Để thuốc xa tầm tay trẻ em.

Độc tự tương đối sử dụng trước khi dùng.

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

Thuốc này chỉ dùng theo đơn của bác sĩ.

Tài liệu tham khảo

- Walencyk, W.S. et al.: Biochem. Res. Comm., 23, 368 (1969)
- Nakazawa, T. et al.: Vitamin, 42, 193 (1970)
- Nakazawa, T. et al.: Vitamin, 42, 375 (1970)
- Yamatsu, K. et al.: Folia Pharmacol. Jap., 72, 269 (1976)
- Yamatsu, K. et al.: Folia Pharmacol. Jap., 72, 259 (1976)
- Iguchi, A. et al.: Jap. J. Clin. Exp. Med., 49, 269 (1972)
- Kameyama, M. et al.: Jap. J. Clin. Exp. Med., 49, 241 (1972)
- Funase, M. et al.: Modern Clinica, 5, 327 (1971)
- Funase, M. et al.: Modern Clinica, 5, 391 (1971)
- Noguchi, Y. et al.: Modern Clinica, 5, 413 (1971)

Sản xuất bởi: Eisai Pharmaceuticals Ltd. Misato Factory 950, Hiroki, Otsuka, Misato-machi, Kodama-gun, Satama-shi, Nhật Bản

Theo ủy quyền của: Eisai Co., Ltd., Tokyo, Nhật Bản

Đóng gói: InterThai Pharmaceutical Manufacturing Ltd. 1809 Phaholyothin Road, Latyao, Chatuchak, Bangkok 10900, Thái Lan

