

PEMIROLAST

Tên chung quốc tế: Pemirolast.

Loại thuốc: Làm bền vững đường bào, chống dị ứng. Thuốc dùng trong nhãn khoa.

Dạng thuốc và hàm lượng

Dung dịch thuốc nhỏ mắt 0,1%.

Dược lực học

Pemirolast là một chất làm bền vững màng đường bào (mastocyte) có tác dụng chống dị ứng. Pemirolast cũng có tác dụng giống như cromolyn, ức chế đường bào giải phóng các chất trung gian gây viêm (như histamin, leukotrien C₄, D₄, E₄). Thuốc ức chế phản ứng quá mẫn nhanh typ 1. Pemirolast cũng ức chế hóa ứng động của bạch cầu ưa eosin đi đến các mô của mắt, và ức chế sự giải phóng các chất trung gian gây viêm từ bạch cầu ưa eosin ở người. Mặc dù cơ chế chính xác chưa được biết, thuốc được cho là ức chế dòng ion calci đi vào đường bào do kích thích của kháng nguyên. Tuy pemirolast dạng nhỏ mắt đã được chứng tỏ có hiệu quả trong viêm kết mạc dị ứng do ngứa, nhưng số liệu so sánh với tác dụng của thuốc kháng histamin tại chỗ vẫn chưa có. Kinh nghiệm cũ đã cho thấy thuốc kháng histamin dạng nhỏ mắt có tác dụng nhanh và mạnh hơn các thuốc làm bền vững đường bào. Nếu người bệnh chỉ có ngứa đơn độc, thuốc kháng histamin dùng tại chỗ như levocabastin thường được lựa chọn, vì ít gây tác dụng phụ hơn pemirolast. Có thể cân nhắc dùng pemirolast cho người bệnh có triệu chứng kéo dài suốt mùa dị ứng, hoặc một số người bệnh không đáp ứng tốt với thuốc kháng histamin dùng tại chỗ. Không chỉ định pemirolast cho viêm kết mạc dị ứng nặng, nên lựa chọn steroid tại chỗ. Hiện nay chưa có số liệu lâm sàng thỏa đáng để có thể khuyến cáo nên dùng pemirolast hơn các thuốc làm bền vững đường bào khác trong viêm kết mạc dị ứng (như olopatadin, cromolyn, lodoxamid, nedocromil). Olopatadin là một chất làm bền vững đường bào và kháng histamin tỏ ra có ưu điểm hơn pemirolast trong đa số các chỉ định.

Dược động học

Thuốc nhỏ mắt bắt đầu tác dụng đối với viêm kết mạc dị ứng (dở ngứa) trong vòng 1 tuần (thường sau vài ngày điều trị, có khi tới 4 tuần).

Sau khi nhỏ 1 - 2 giọt dung dịch nhỏ mắt vào mỗi mắt, 4 lần mỗi ngày, trong 2 tuần điều trị cho 16 người tình nguyện, đã phát hiện thấy thuốc trong huyết tương. Nồng độ tối đa trung bình trong huyết tương là $4,7 \pm 0,8$ nanogram/ml thu được sau $0,42 \pm 0,05$ giờ và nửa đời thải trừ trung bình là $4,5 \pm 0,2$ giờ. Thuốc chuyển hóa tại gan, chất chuyển hóa pemirolast glucuronid được tìm thấy trong nước tiểu. Sau khi dùng tại chỗ, khoảng 10 - 15% liều dùng thải trừ qua nước tiểu dưới dạng không đổi.

Chỉ định

Dự phòng viêm kết mạc dị ứng.

Chống chỉ định

Quá mẫn với pemirolast.

Thận trọng

Phải đảm bảo vô khuẩn: Tránh để đầu lọ thuốc chạm vào xung quanh mắt.

Người bệnh cần phải chờ ít nhất 10 phút sau khi nhỏ thuốc mới được đeo kính áp tròng vì chất bảo quản lauralkonium clorid có thể bị hấp phụ vào kính áp tròng. Người bệnh không được sử dụng kính áp tròng nếu mắt bị đỏ.

Không sử dụng pemirolast để điều trị kích ứng mắt do đeo kính áp tròng. Cũng cần thận trọng với người bệnh có bệnh khác ở mắt. Hiệu quả và độ an toàn của pemirolast dạng nhỏ mắt ở trẻ em dưới

3 tuổi chưa được xác nhận. Hiện chưa có thông tin về mối liên quan giữa tuổi và tác dụng của thuốc ở người cao tuổi.

Cần thận trọng khi sử dụng cho người bệnh suy gan hoặc suy thận do chưa có số liệu về dược động học ở các bệnh nhân này.

Thời kỳ mang thai

Chưa có nghiên cứu đủ lớn và có kiểm soát trên phụ nữ mang thai. Chưa rõ thuốc có qua được nhau thai hay không. Chỉ dùng pemirolast cho phụ nữ mang thai khi lợi ích cho mẹ vượt trội nguy cơ đối với thai nhi.

Thời kỳ cho con bú

Chưa rõ thuốc có bài tiết qua sữa mẹ hay không. Tuy nhiên, nghiên cứu trên động vật cho thấy pemirolast bài tiết vào sữa với nồng độ cao hơn nồng độ trong huyết tương. Cần thận trọng khi dùng pemirolast cho phụ nữ đang cho con bú.

Tác dụng không mong muốn (ADR)

Rất thường gặp

Toàn thân: triệu chứng giống cúm, đau đầu, viêm mũi.

Mắt: nóng mắt, khô mắt, cảm giác có vật lạ, khó chịu ở mắt.

Ngoài mắt: dị ứng, đau lưng, đau bụng kinh, sốt, viêm phế quản, viêm xoang, ho, hắt hơi, ngạt mũi.

Hướng dẫn cách xử trí ADR

ADR của thuốc thường nhẹ, một số ADR tương tự như triệu chứng của bệnh đang được điều trị.

Liều lượng và cách dùng

Triệu chứng ngứa mắt sẽ giảm sau vài ngày điều trị, thông thường cần điều trị kéo dài tới 4 tuần để có được đáp ứng lâm sàng đầy đủ. Dự phòng viêm kết mạc dị ứng - ngứa: Người lớn và trẻ em trên 3 tuổi: Nhỏ 1 - 2 giọt dung dịch nhỏ mắt 0,1% vào mỗi bên mắt bị ngứa, 4 lần mỗi ngày.

Quá liều và xử trí

Hiện chưa có báo cáo về quá liều khi sử dụng dung dịch nhỏ mắt pemirolast.

Cập nhật lần cuối: 2016.

PENICILAMIN

(D-penicilamin)

Tên chung quốc tế: Penicillamine.

Mã ATC: M01CC01.

Loại thuốc: Tác nhân tạo phức, giải độc kim loại nặng.

Dạng thuốc và hàm lượng

Viên nén, nang: 125 mg, 250 mg.

Dược lực học

Penicilamin là dimethylcystein. Trong y học chỉ dùng đồng phân D, còn đồng phân L là một chất đối kháng pyridoxin và có tác dụng độc. Penicilamin dùng đường uống là một tác nhân giải độc trong điều trị bệnh Wilson, cystin niệu và nhiễm độc kim loại nặng. Nó còn được dùng điều trị viêm khớp dạng thấp, nhưng là thứ yếu; viêm gan mạn tính tiến triển.

Penicilamin tạo phức với Cu, Hg, Zn, Pb và làm tăng thải trừ các kim loại này qua nước tiểu.

Cơ chế trong bệnh Wilson: Một nguyên tử đồng kết hợp với 2 phân tử penicilamin, vì vậy 1 g penicilamin có thể kéo theo sự bài tiết 200 mg đồng.

Trong bệnh cystin niệu, acid amin này được đào thải nhiều. Do rất ít tan nên rất dễ bị kết tinh, tạo sỏi ở đường tiết niệu. Penicilamin tương tác với cystin tạo ra disulfid penicilamin-cystin dễ hòa tan