https://trungtamthuoc.com/

Rx

Regabin 150

(Viên nang pregabalin 150 mg)

Các dấu hiệu lưu ý và khuyến cáo:
Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.
Để xa tầm tay trẻ em.
Thông báo ngay cho bác sỹ hoặc dược sỹ những tác dụng không mong muốn gặp phải khi sử dụng thuốc.
Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc

1. Thành phần công thức thuốc

Mỗi viên nang cứng chứa:

Thành phần hoạt chất: Pregabalin 150 mg

Thành phần tá dược: Lactose monohydrate; pregelatinized starch; talc; empty hard gelatin capsule, size '2' (white colour cap and white colour body imprinted with 'M5' on cap and '150mg' on body)

Thành phần của vỏ nang: Titanium dioxide, gelatin, water, sodium lauryl sulfate.

Thành phần của mực in: Shellac, dehydrated alcohol, isopropyl alcohol, butyl alcohol, propylene glycol, strong ammonia solution, black iron oxide, potassium hydroxide, purified water.

2. Dạng bào chế: Viên nang cứng.

Mô tả đặc điểm thuốc: Viên nang cứng cỡ 2 màu trắng, nắp được in "M5" và thân được in "150" chứa bột màu trắng.

3. Chỉ định

Đau thần kinh

Pregabalin được chỉ định để điều trị đau thần kinh ngoại biên và trung ương ở người trưởng thành.

Động kinh

Pregabalin được chỉ định như phác đồ hỗ trợ ở người trưởng thành bị động kinh một phần có hoặc không có cơn toàn thể hoá thứ phát.

Rối loạn lo âu lan toả

Pregabalin được chỉ định để điều trị rối loạn lo âu lan toả (GAD) ở người trưởng thành.

4. Liều dùng – Cách dùng

Liều dùng

Khoảng liều là từ 150 đến 600 mg/ngày được chia thành 2 hoặc 3 lần.

Đau thần kinh

Điều trị với pregabalin có thể được bắt đầu ở liều 150 mg/ngày được chia thành 2 hoặc 3 lần. Dựa vào đáp ứng của từng bệnh nhân và khả năng dung nạp, liều có thể được tăng lên 300 mg/ngày sau một khoảng thời gian 3 đến 7 ngày, và nếu cần, đến liều tối đa 600 mg/ngày sau một khoảng thời gian 7 ngày tiếp theo.

Động kinh

Điều trị với pregabalin có thể được bắt đầu bởi liều 150 mg/ngày được chia thành 2 hoặc 3

https://trungtamthuoc.com/

lần. Dựa vào đáp ứng của từng bệnh nhân và khả năng dung nạp, liều có thể tăng lên 300 mg mỗi ngày sau 1 tuần. Liều tối đa có thể tăng lên 600 mg/ngày sau tuần tiếp theo.

Rối loạn lo âu lan toả

Khoảng liều từ 150 đến 600 mg/ngày được chia thành 2 hoặc 3 lần. Cần phải đánh giá lại đáp ứng bệnh nhân sau khoảng thời gian điều trị.

Điều trị bằng pregabalin có thể bắt đầu với liều 150 mg/ngày. Dựa vào đáp ứng của từng bệnh nhân và khả năng dung nạp, liều có thể tăng lên 300 mg/ngày sau 1 tuần điều trị. Sau đó có thể tăng lên đến 450 mg/ngày. Liều tối đa 600 mg/ngày có thể đạt được sau tuần kế tiếp.

Ngưng dùng pregabalin

Theo dữ liệu lâm sàng hiện tại, nếu cần ngưng dùng pregabalin, nên tiến hành giảm liều từ từ trong vòng tối thiểu 1 tuần tùy theo từng chỉ định.

Bệnh nhân suy thận

Pregabalin được thải trừ chủ yếu ở thận dưới dạng không đổi. Do sự thanh thải của pregabalin có liên quan trực tiếp và tỷ lệ thuận với độ thanh thải creatinin, phải giảm liều ở bệnh nhân suy thận tùy theo độ thanh thải creatinin (ClCr), được chỉ ra trong Bảng 1 sau:

$$ClCr_{(mL/phút)} = [\ \frac{1{,}23 \times (140 - \text{tuổi}) \times \text{cân nặng (kg)}}{\text{Creatinin huyết thanh (µmol/L)}}\ ] \text{ (x 0,85 cho bệnh nhân nữ)}$$

Pregabalin được thải trừ hiệu quả từ huyết tương bằng thẩm phân máu (50% thuốc trong 4 giờ). Đối với những bệnh nhân được thẩm phân máu, liều pregabalin mỗi ngày nên được điều chỉnh dựa trên chức năng thận. Ngoài liều hàng ngày, cần phải dùng thêm liều bổ sung ngay sau mỗi 4 giờ điều trị thẩm phân máu (xem Bảng 1).

Bảng 1: Hiệu chỉnh liều pregabalin dựa trên chức năng thận:

Độ thanh thải creatinin (ClCr) (mL/phút)	Tổng liều pregabalin hàng ngày*		Số lần dùng
	Liều khởi đầu (mg/ngày)	Liều tối đa (mg/ngày)	
≥ 60	150	600	BID hoặc TID
≥ 30 - < 60	75	300	BID hoặc TID
≥ 15 - < 30	25 – 50	150	1 lần/ngày hoặc BID
< 15	25	75	1 lần/ngày
Liều bổ sung ngay sau điều trị thẩm phân máu (mg)			
	25	100	Liều duy nhất*

TID = 3 lần/ngày

BID = 2 lần/ngày

* Tổng liều hàng ngày (mg/ngày) nên được chia theo số lần dùng như được chỉ định (mg/liều)

* Liều bổ sung là liều duy nhất.

Bệnh nhân suy gan

Không cần điều chỉnh liều cho bệnh nhân bị suy gan.

Trẻ em

https://trungtamthuoc.com/

Tính an toàn và hiệu quả của pregabalin ở trẻ dưới 12 tuổi và ở thanh thiếu niên (12 - 17 tuổi) chưa được thiết lập.

Người cao tuổi

Người cao tuổi có thể cần giảm liều pregabalin do suy giảm chức năng thận.

Cách dùng

Pregabalin có thể được dùng cùng hoặc không cùng thức ăn.

5. Chống chỉ định

Chống chỉ định ở những bệnh nhân quá mẫn với pregabalin hoặc bất kì tá dược nào của thuốc.

6. Cảnh báo và thận trọng khi dùng thuốc

Bệnh nhân đái tháo đường

Theo thực hành lâm sàng hiện tại, một số bệnh nhân đái tháo đường tăng cân trở lại do điều trị bằng pregabalin có thể cần điều chỉnh các thuốc làm hạ đường huyết.

Phản ứng quá mẫn

Đã có những báo cáo sau khi thuốc lưu hành về phản ứng quá mẫn, bao gồm những trường hợp phù mạch. Phải ngưng ngay pregabalin nếu triệu chứng của phù mạch xảy ra như sưng mặt, sưng miệng, hoặc sưng đường hô hấp trên.

Chóng mặt, buồn ngủ, mất ý thức, lú lẫn, và suy giảm tâm thần

Điều trị bằng pregabalin gây ra chóng mặt và buồn ngủ, có thể làm tăng sự xuất hiện của các chấn thương vô ý (té ngã) ở những bệnh nhân cao tuổi. Đã có những báo cáo sau khi thuốc lưu hành về mất ý thức, lú lẫn và suy giảm tâm thần. Do đó, bệnh nhân cần được khuyến cáo thận trọng khi vận động cho đến khi đã quen với các tác động tiềm ẩn của thuốc.

Ảnh hưởng đến thị giác

Trong các thử nghiệm lâm sàng có đối chứng, đã có báo cáo giảm thị lực ở một số lượng lớn hơn các bệnh nhân được điều trị bằng pregabalin so với những bệnh nhân sử dụng giả dược, và đã hồi phục trong phần lớn các trường hợp tiếp tục sử dụng. Trong các nghiên cứu lâm sàng có thực hiện kiểm tra chức năng thị giác, tỷ lệ giảm thị lực và thay đổi thị giác ở những bệnh nhân được điều trị bằng pregabalin là lớn hơn ở những bệnh nhân được điều trị bằng giả dược, tỷ lệ những thay đổi khi soi đáy mắt cao hơn ở những bệnh nhân được điều trị bằng giả dược.

Khi lưu hành thuốc trên thị trường, tác dụng không mong muốn trên thị giác đã được báo cáo, bao gồm mất thị lực, nhìn mờ hoặc những thay đổi khác về thị lực, nhiều trường hợp là thoáng qua. Ngưng sử dụng pregabalin có thể giúp phục hồi hoặc cải thiện những triệu chứng thị lực này.

Suy thận

Những trường hợp suy thận đã được báo cáo và trong một số trường hợp việc ngưng điều trị pregabalin đã cho thấy sự đảo ngược của tác dụng không mong muốn này.

Ngưng những thuốc chống động kinh dùng đồng thời

Không có dữ liệu đầy đủ về việc ngưng các thuốc chống động kinh sử dụng đồng thời, một khi kiểm soát được cơn co giật với pregabalin trong liệu pháp bổ sung đã đạt được, sau đó thực hiện liệu pháp đơn trị liệu bằng pregabalin.

Triệu chứng ngưng thuốc

https://trungtamthuoc.com/

Sau khi ngưng điều trị ngắn hạn và dài hạn bằng pregabalin, các triệu chứng ngưng thuốc đã được quan sát thấy ở một số bệnh nhân. Các triệu chứng sau đã được nhắc đến: mất ngủ, đau đầu, buồn nôn, lo âu, tiêu chảy, hội chứng cúm, căng thẳng, trầm cảm, đau, co giật, tăng tiết mồ hôi và chóng mặt, có phụ thuộc vào thể chất. Bệnh nhân phải được thông báo về điều này khi bắt đầu điều trị.

Các cơn co giật bao gồm động kinh trạng thái và co giật mạn tính lớn, có thể xảy ra trong khi sử dụng pregabalin hoặc thời gian ngắn sau khi ngưng sử dụng pregabalin.

Liên quan đến ngưng pregabalin khi điều trị dài hạn, các dữ liệu cho thấy rằng tỷ lệ và mức độ nghiêm trọng của triệu chứng ngưng thuốc có liên quan đến liều.

Suy tim sung huyết

Đã có báo cáo sau khi thuốc lưu hành về suy tim sung huyết ở một số bệnh nhân sử dụng pregabalin. Những phản ứng này phần lớn được nhận thấy ở những bệnh nhân lớn tuổi có tổn thương tim mạch trong khi điều trị bằng pregabalin cho chỉ định đau thần kinh. Pregabalin nên được sử dụng thận trọng ở những bệnh nhân này. Ngưng sử dụng pregabalin có thể giải quyết được ảnh hưởng này.

Điều trị đau thần kinh trung ương do tổn thương tủy sống

Trong điều trị đau thần kinh trung ương do tổn thương tủy sống, tỷ lệ các tác dụng không mong muốn nói chung, tác dụng không mong muốn trên hệ thần kinh trung ương và đặc biệt là buồn ngủ đã tăng lên. Điều này có thể là do các tác dụng không mong muốn của các thuốc dùng đồng thời (như thuốc chống co cứng) cần thiết sử dụng cho tình trạng này. Điều này phải được xem xét khi kê đơn pregabalin.

Suy nghĩ và hành vi tự sát

Suy nghĩ và hành vi tự sát đã được báo cáo ở những bệnh nhân được điều trị bằng các thuốc chống động kinh trong một vài chỉ định. Một phân tích tổng hợp những nghiên cứu ngẫu nhiên có đối chứng với giả dược của thuốc chống động kinh cũng đã cho thấy có nguy cơ tăng nhẹ suy nghĩ và hành vi tự sát. Cơ chế của nguy cơ này chưa được biết và những dữ liệu sẵn có không thể loại trừ được khả năng tăng nguy cơ là do pregabalin. Do đó, bệnh nhân phải được theo dõi các dấu hiệu của suy nghĩ và hành vi tự sát và điều trị thích hợp nên được xem xét. Những bệnh nhân (và những người chăm sóc bệnh nhân) phải được khuyến cáo tìm kiếm tư vấn y khoa khi dấu hiệu của suy nghĩ và hành vi tự sát xuất hiện.

Giảm chức năng đường tiêu hóa dưới

Đã có những báo cáo sau khi thuốc được lưu hành về các biến cố liên quan đến giảm chức năng đường tiêu hóa dưới (như tắc ruột, liệt ruột, táo bón) khi pregabalin được sử dụng đồng thời với các thuốc có khả năng gây táo bón, như thuốc giảm đau opioid. Khi pregabalin và các opioid được sử dụng kết hợp, xem xét các biện pháp ngăn ngừa táo bón (đặc biệt ở bệnh nhân nữ và người cao tuổi).

Khả năng lạm dụng hoặc phụ thuộc thuốc

Các trường hợp lạm dụng hoặc phụ thuộc thuốc đã được báo cáo. Thận trọng khi kê đơn thuốc ở những bệnh nhân có tiền sử lạm dụng thuốc và những bệnh nhân này phải được theo dõi những triệu chứng của lạm dụng hoặc phụ thuộc pregabalin (phát triển dung nạp, tăng liều, hành vi tìm thuốc đã được báo cáo).

Bệnh não

https://trungtamthuoc.com/

Những trường hợp bệnh não đã được báo cáo, phần lớn ở những bệnh nhân có những bệnh lý có sẵn có thể dẫn đến bệnh não.

Không dung nạp lactose

Viên nang pregabalin có chứa lactose monohydrat. Bệnh nhân có các vấn đề di truyền hiếm gặp không dung nạp galactose, thiếu Lapp lactase hoặc kém hấp thu glucose-galactose không nên dùng thuốc này.

7. Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai và cho con bú

Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai

Không có đủ dữ liệu về việc sử dụng pregabalin ở phụ nữ mang thai. Những nghiên cứu ở động vật đã cho thấy độc tính sinh sản. Nguy cơ có thể xảy ra ở người là chưa biết. Không nên sử dụng pregabalin trong thai kỳ trừ khi thật sự cần thiết (nếu lợi ích cho người mẹ là lớn hơn nguy cơ có thể xảy với thai nhi).

Sử dụng thuốc cho phụ nữ cho con bú

Pregabalin được tiết vào sữa ở người. Ảnh hưởng của pregabalin ở trẻ sơ sinh/trẻ nhỏ là chưa được biết. Quyết định ngừng cho con bú hoặc ngừng sử dụng pregabalin nên xem xét đến lợi ích của việc cho con bú và lợi ích của việc điều trị ở người mẹ.

8. Ảnh hưởng của thuốc lên khả năng lái xe, vận hành máy móc

Pregabalin có thể gây chóng mặt, buồn ngủ hoặc giảm tập trung. Không nên lái xe, vận hành máy móc phức tạp hoặc tham gia các hoạt động có thể nguy hiểm cho đến khi biết rõ thuốc ảnh hưởng như thế nào đến khả năng thực hiện các hoạt động này.

9. Tương tác, tương kỵ của thuốc

Tương tác

Do pregabalin được đào thải chủ yếu ở dạng không đổi trong nước tiểu, trải qua quá trình chuyển hoá không đáng kể ở người (< 2% liều được tìm thấy trong nước tiểu dưới dạng chuyển hoá), không ức chế sự chuyển hoá thuốc *in vitro*, và thuốc không gắn với protein huyết tương, không gây, hoặc chịu các tương tác dược động học.

Các nghiên cứu in vivo và phân tích dược động học dân số

Dựa vào các nghiên cứu *in vivo* không có tương tác dược động học liên quan trên lâm sàng được ghi nhận giữa pregabalin và phenytoin, carbamazebin, acid valproic, lamotrigin, gabapentin, lorazepam, oxycodon hoặc ethanol. Phân tích dược động học dân số cho thấy các thuốc điều trị đái tháo đường đường uống, thuốc lợi tiểu, insulin, phenobarbital, tiagabin và topiramat không có ảnh hưởng đáng kể trên lâm sàng đến sự đào thải pregabalin.

Thuốc tránh thai đường uống, norethisteron và/hoặc ethinyl oestradiol

Sử dụng đồng thời pregabalin với các thuốc tránh thai đường uống norethisteron và/hoặc ethinyl oestradiol không ảnh hưởng đến các thông số dược động học ở giai đoạn ổn định của cả hai thuốc.

Các thuốc ảnh hưởng đến hệ thần kinh trung ương

Pregabalin có thể làm tăng ảnh hưởng của ethanol và lorazepam. Trong các thử nghiệm lâm sàng có kiểm soát, nhiều liều pregabalin đường uống được sử dụng đồng thời với oxycodon, lorazepam hoặc ethanol không dẫn đến các ảnh hưởng quan trọng trên lâm sàng đối với sự hô hấp. Sau khi lưu hành, có nhiều báo cáo về suy hô hấp và hôn mê ở những bệnh nhân đang sử dụng pregabalin và các thuốc ức chế hệ thần kinh trung ương. Pregabalin dường như làm tăng thêm sự suy giảm nhận thức, chức năng vận động gây ra bởi oxycodon.

https://trungtamthuoc.com/

Các tương tác ở người cao tuổi

Không có nghiên cứu tương tác dược lực học nào được thực hiện ở những tình nguyện viên cao tuổi. Các nghiên cứu tương tác chỉ được thực hiện ở người trưởng thành.

Tương kỵ

Do không có các nghiên cứu về tính tương kỵ của thuốc, không trộn lẫn thuốc này với các thuốc khác.

10. Tác dụng không mong muốn của thuốc

Các tác dụng không mong muốn được báo cáo phổ biến nhất là chóng mặt và buồn ngủ. Các tác dụng không mong muốn thường nhẹ đến trung bình về mức độ. Tác dụng không mong muốn phổ biến nhất dẫn đến việc ngưng sử dụng thuốc từ nhóm được điều trị bằng pregabalin là chóng mặt và buồn ngủ.

Các tác dụng không mong muốn sau được ghi nhận trong các thử nghiệm lâm sàng. Rất thường gặp (≥ 1/10); thường gặp (≥ 1/100 đến < 1/10); ít gặp (≥ 1/1000 đến < 1/100); hiếm gặp (≥ 1/10000 đến < 1/1000); rất hiếm gặp (< 1/10000); chưa được biết (không thể ước tính từ dữ liệu có sẵn).

Hệ cơ quan	Tác dụng không mong muốn
Nhiễm khuẩn và nhiễm ký sinh trùng	
Thường gặp	Viêm mũi họng
Rối loạn máu và hệ bạch huyết	
Ít gặp	Giảm bạch cầu trung tính
Rối loạn hệ miễn dịch	
Ít gặp	Quá mẫn
Hiếm gặp	Phù mạch, phản ứng dị ứng
Rối loạn chuyển hoá và dinh dưỡng	
Thường gặp	Tăng sự thèm ăn
Ít gặp	Chán ăn, hạ đường huyết
Rối loạn hô hấp, lồng ngực và trung thất	
Ít gặp	Khó thở, chảy máu cam, ho, nghẹt mũi, viêm mũi, ngáy, khô mũi
Hiếm gặp	Phù phổi, đau họng
Rối loạn tiêu hoá	
Thường gặp	Nôn, buồn nôn, táo bón, tiêu chảy, đầy hơi, trướng bụng, khô miệng
Ít gặp	Trào ngược dạ dày thực quản, tăng tiết nước bọt, giảm cảm giác ở miệng
Hiếm	Cổ trướng, viêm tụy, lưỡi sưng, khó nuốt
Rối loạn gan mật	
Thường gặp	Tăng các enzym gan
Hiếm gặp	Vàng da
Rất hiếm gặp	Suy gan, viêm gan
Rối loạn da và mô dưới da	
Ít gặp	Ban sần, nổi mày đay, tăng tiết mồ hôi, ngứa
Hiếm gặp	Hội chứng Steven Johnson, mồ hôi lạnh
Rối loạn cơ xương và mô liên kết	
Thường gặp	Co thắt cơ, đau khớp, đau lưng, đau chân tay, co thắt cổ tử cung

https://trungtamthuoc.com/

Ít gặp	Sưng khớp, đau cơ, co giật cơ, đau cổ, cứng cơ
Hiếm	Tiêu cơ vân
Rối loạn thận và tiết niệu	
Ít gặp	Tiểu không tự chủ, khó tiểu
Hiếm gặp	Suy thận, thiểu niệu, bí tiểu
Rối loạn hệ sinh sản và tuyến vú	
Thường gặp	Rối loạn cương dương
Ít gặp	Rối loạn chức năng tình dục, xuất tinh chậm, đau bụng kinh, đau vú
Hiếm gặp	Vô kinh, vú tiết dịch, ngực nở, vú to ở nam giới
Rối loạn toàn thân và tại chỗ	
Thường gặp	Phù ngoại biên, phù, dáng đi bất thường, té ngã, cảm giác say, cảm giác bất thường, mệt mỏi
Ít gặp	Phù toàn thân, phù mặt, tức ngực, đau, sốt, khát, ớn lạnh, suy nhược
Cận lâm sàng	
Thường gặp	Tăng cân
Ít gặp	Creatin phosphokinase máu tăng, alanin amonotransferase tăng, aspartat aminotransferase tăng, glucose máu tăng, số lượng tiểu cầu giảm, creatinin máu tăng, kali máu tăng, giảm cân
Hiếm gặp	Số lượng bạch cầu tăng

Ngừng sử dụng: Sau khi ngừng điều trị ngắn hạn và dài hạn với pregabalin, các triệu chứng ngưng thuốc có thể được ghi nhận ở một số bệnh nhân. Các phản ứng sau đã được đề cập: mất ngủ, đau đầu, buồn nôn, lo lắng, tiêu chảy, hội chứng cúm, co giật, hồi hộp, trầm cảm, đau, tăng tiết mồ hôi và chóng mặt, cho thấy sự phụ thuộc về thể chất. Bệnh nhân nên được thông báo về điều này khi bắt đầu điều trị.

Liên quan đến việc ngừng điều trị dài hạn pregabalin, dữ liệu cho thấy tỷ lệ và mức độ nghiêm trọng của hội chứng ngưng thuốc có thể phụ thuộc liều.

Báo cáo nghi ngờ các tác dụng không mong muốn của thuốc

Thông báo ngay cho bác sĩ hoặc dược sĩ khi gặp các tác dụng không mong muốn như trên khi sử dụng thuốc hoặc báo cáo các phản ứng có hại của thuốc về Trung tâm Quốc gia về thông tin thuốc và theo dõi phản ứng có hại (ADR) của thuốc.

Địa chỉ: 13 - 15 Lê Thánh Tông - Hoàn Kiếm - Hà Nội.

Điện thoại: 024.3.9335.618; Fax: 024.3.9335642; Email: di.pvcenter@gmail.com

11. Quá liều và cách xử trí

Trong kinh nghiệm sau khi thuốc lưu hành, các tác dụng không mong muốn được báo cáo phổ biến nhất được ghi nhận khi sử dụng quá liều pregabalin bao gồm buồn ngủ, tình trạng nhầm lẫn, kích động và bồn chồn.

Trong các trường hợp hiếm, hôn mê đã được báo cáo.

Điều trị quá liều pregabalin nên bao gồm các điều trị hỗ trợ chung và có thể bao gồm thẩm phân nếu cần.

12. Đặc tính dược lực

Nhóm dược lý: Thuốc chống động kinh.

Mã ATC: N03AX16

https://trungtamthuoc.com/

Cơ chế tác dụng

Pregabalin liên kết với một tiểu đơn vị phụ (protein α2-δ) của các kênh calci bị kiểm soát điện áp trong hệ thống thần kinh trung ương.

13. Đặc tính dược động

Hấp thu

Pregabalin được hấp thu nhanh khi sử dụng lúc đói, với nồng độ đỉnh huyết tương đạt được trong vòng 1 giờ sau khi sử dụng một liều đơn độc hoặc nhiều liều. Sinh khả dụng đường uống của pregabalin được ước tính vào khoảng ≥ 90% và không phụ thuộc vào liều. Sau khi sử dụng lặp lại, giai đoạn ổn định đạt được trong vòng 24 đến 48 giờ. Tỷ lệ hấp thu pregabalin giảm khi sử dụng với thức ăn dẫn đến giảm C_{max} khoảng 25 - 30% và làm chậm t_{max} đến khoảng 2,5 giờ. Tuy nhiên, sử dụng pregabalin với thức ăn không ảnh hưởng đáng kể trên lâm sàng đến sự hấp thu của pregabalin.

Phân bố

Trong các nghiên cứu tiền lâm sàng, pragabalin đã được chứng minh là qua được hàng rào máu não ở chuột và khỉ. Pregabalin đã được chứng minh qua được hàng rào nhau thai ở chuột và hiện diện trong sữa ở chuột. Ở người, thể tích phân bố của pregabalin sau khi sử dụng đường uống là khoảng 0,56 L/kg. Pregabalin không gắn kết với protein huyết tương.

Chuyển hoá

Pregabalin trải qua quá trình chuyển hoá không đáng kể ở người. Sau một liều pregabalin được đánh dấu phóng xạ, khoảng 98% hoạt tính phóng xạ được tìm thấy trong nước tiểu là dạng pregabalin không đổi. Dẫn xuất N-methyl hóa của pregabalin, chất chuyển hoá chủ yếu của pregabalin được tìm thấy trong nước tiểu, chiếm khoảng 0,9% liều. Trong các nghiên cứu tiền lâm sàng, không có dấu hiệu để phân biệt đồng phân pregabalin S-enantiomer với R-enantiomer.

Thải trừ

Pregabalin bị thải trừ khỏi hệ tuần hoàn chủ yếu bởi sự đào thải ở thận dưới dạng không thay đổi. Thời gian bán thải trung bình của pregabalin là 6,3 giờ. Sự thanh thải pregabalin huyết tương và sự thanh thải thận là tỷ lệ trực tiếp với sự thanh thải creatinin. Điều chỉnh liều ở những bệnh nhân giảm chức năng thận hoặc đang được phẩm phân máu là cần thiết.

Tuyến tính/không tuyến tính

Dược động học của pregabalin là tuyến tính trong khoảng liều được khuyến cáo mỗi ngày. Biến đổi dược động học của pregabalin giữa các đối tượng là thấp (< 20%). Dược động học đa liều được dự đoán từ dữ liệu đơn liều. Do đó, không cần theo dõi thường quy nồng độ huyết tương của pregabalin.

Giới tính

Các thử nghiệm lâm sàng cho thấy giới tính không ảnh hưởng đáng kể về mặt lâm sàng đối với nồng độ huyết tương của pregabalin.

Suy thận

Độ thanh thải pregabalin tỷ lệ trực tiếp với độ thanh thải creatinin. Ngoài ra, pregabalin được đào thải hiệu quả khỏi huyết tương bằng thẩm phân máu (sau 4 giờ thẩm phân nồng độ huyết tương của pregabalin giảm khoảng 50%). Do đào thải ở thận là con đường đào thải chủ yếu, giảm liều ở những bệnh nhân suy thận và bổ sung liều sau khi thẩm phân là cần thiết.

Suy gan

https://trungtamthuoc.com/

Không có các nghiên cứu dược động học cụ thể được thực hiện ở những bệnh nhân suy giảm chức năng gan. Do pregabalin không được chuyển hoá đáng kể và được đào thải chủ yếu ở dạng không đổi trong nước tiểu, suy giảm chức năng gan không được cho là thay đổi đáng kể nồng độ pregabalin trong huyết tương.

Trẻ em

Dược động học của pregabalin được đánh giá ở những bệnh nhân trẻ em bị động kinh (nhóm tuổi: 1 đến 23 tháng, 2 đến 6 tuổi, 7 đến 11 tuổi và 12 đến 16 tuổi) ở những mức liều 2,5, 5, 10 và 15 mg/kg/ngày trong nghiên cứu dược động học và khả năng dung nạp.

Sau khi sử dụng pregabalin đường uống ở trẻ em lúc đói, nhìn chung, thời gian đạt nồng độ đỉnh trong huyết tương là tương tự giữa các nhóm tuổi sau 0,5 đến 2 giờ sau khi sử dụng.

Các thông số C_{max} và AUC của pregabalin tăng tuyến tính khi tăng liều trong mỗi nhóm tuổi. AUC là thấp hơn 30% ở trẻ em dưới 30 kg do khối lượng cơ thể tăng đã điều chỉnh độ thanh thải 43% cho những bệnh nhân này so với bệnh nhân nặng ≥ 30 kg.

Thời gian bán thải cuối của pregabalin trung bình khoảng 3 đến 4 giờ ở trẻ em đến 6 tuổi và 4 đến 6 giờ ở những trẻ từ 7 tuổi trở lên.

Phân tích dược động học dân số đã chứng minh sự thanh thải creatinin là một đồng tham số quan trọng đối với sự thanh thải pregabalin đường uống, khối lượng cơ thể là một đồng tham số của thể tích phân bố pregabalin, và những mối quan hệ này là tương tự ở trẻ em và người trưởng thành. Dược động học của pregabalin ở những bệnh nhân nhỏ hơn 3 tháng tuổi chưa được nghiên cứu.

Người cao tuổi

Sự thanh thải pregabalin có xu hướng giảm khi tuổi tăng. Sự thanh thải pregabalin đường uống giảm tương ứng với sự giảm độ thanh thải creatinin liên quan khi tuổi tăng. Giảm liều pregabalin có thể cần ở những bệnh nhân cao tuổi bị suy giảm chức năng thận

14. Quy cách đóng gói: Hộp 3 vỉ x 10 viên.

15. Điều kiện bảo quản, hạn dùng, tiêu chuẩn chất lượng của thuốc

Bảo quản: Bảo quản dưới 30°C ở nơi khô ráo. Tránh ánh sáng.

Hạn dùng: 36 tháng kể từ ngày sản xuất.

Tiêu chuẩn: NSX

16. Tên, địa chỉ cơ sở sản xuất thuốc

MACLEODS PHARMACEUTICALS LTD.

Block N-2, Village Theda, Post Office Lodhimajra Tehsil Baddi, Distt. Solan, Himachal Pradesh - 174101, Ấn Độ.