

TỜ HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG THUỐC

Rx Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc



UKepal

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng - Để xa tầm tay trẻ em

THÀNH PHẦN CÔNG THỨC: Mỗi viên nén bao phim chứa:

Thành phần được chứa:

Epalrestat50 mg

Thành phần tá dược:

Mannitol, PVP K30, natri croscarmellose, magnesi stearat, HPMC 15 cps, PEG 6000, titan dioxyd, talc.

DẠNG BÀO CHẾ: Viên nén bao phim

Mô tả: Viên nén bao phim tròn, màu trắng.

CHỈ ĐỊNH:

Điều trị các biến chứng thần kinh do đái tháo đường: Cải thiện các triệu chứng chủ quan (cảm giác tê bì, đau buốt), rối loạn cảm giác rung, thay đổi bất thường nhịp tim (khi có trị số glycohemoglobin cao).

CÁCH DÙNG & LIỀU DÙNG:

Dùng đường uống. Thuốc được uống trước khi ăn.

Liều thông thường cho người lớn là 50 mg/lần x 3 lần/ngày, uống trước bữa ăn.

Liều lượng có thể được điều chỉnh tùy theo tình trạng bệnh và tuổi tác.

Thời gian điều trị tối thiểu để đạt được hiệu quả của epalrestat là 12 tuần.

Bệnh nhân suy gan hoặc suy thận:

An toàn và hiệu quả của thuốc trên nhóm bệnh nhân này chưa được thiết lập. Tuy nhiên, nồng độ enzym gan tăng và gia tăng nồng độ creatinin huyết thanh và urê huyết đã được ghi nhận.

Trẻ em và thanh thiếu niên:

An toàn và hiệu quả của thuốc ở trẻ em và thanh thiếu niên chưa được thiết lập. Do vậy, không nên dùng thuốc cho nhóm bệnh nhân này.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH:

Quá mẫn với epalrestat hay với bất cứ thành phần nào của thuốc.

Trẻ em và thanh thiếu niên.

CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG KHI DÙNG THUỐC:

Khi sử dụng thuốc, nước tiểu có thể biến màu thành vàng nâu hoặc đỏ, tuy nhiên không ảnh hưởng tới sức khỏe.

Hiệu quả của thuốc chưa được thiết lập ở những bệnh nhân có biến chứng thần kinh ngoại vi không hồi phục do đái tháo đường, do vậy 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 12 tuần.

Việc sử dụng epalrestat ở bệnh nhân suy gan hoặc thận chưa được đánh giá đầy đủ. Tuy nhiên, nồng độ enzym gan tăng và gia tăng nồng độ creatinin huyết thanh và urê huyết đã được ghi nhận.

SỬ DỤNG THUỐC CHO PHỤ NỮ CÓ THAI VÀ CHO CON BÚ:

Phụ nữ có thai:

Epalrestat không nằm trong danh mục thuốc chống chỉ định cho phụ nữ mang thai. Tuy nhiên, chỉ nên sử dụng epalrestat cho phụ nữ có thai khi lợi ích điều trị vượt trội nguy cơ rủi ro đối với thai nhi.

Phụ nữ cho con bú:

Nghiên cứu trên động vật (chuột cống) cho thấy thuốc đi vào sữa mẹ. Vì vậy, cần tránh cho con bú khi sử dụng thuốc.

ẢNH HƯỞNG CỦA THUỐC LÊN KHẢ NĂNG LÁI XE, VẬN HÀNH MÁY MÓC:

Epalrestat có thể gây chóng mặt, buồn ngủ, đau nhức chân tay....điều này có thể ảnh hưởng đến khả năng lái xe và vận hành máy móc.

TƯƠNG TÁC, TƯƠNG Kỵ CỦA THUỐC:

Tương tác của thuốc: Chưa có tài liệu, báo cáo nào của thuốc được ghi nhận.

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

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN CỦA THUỐC:

Các tác dụng không mong muốn đã được báo cáo ở 149 (1,4%) trong tổng số 8498 bệnh nhân. Các triệu chứng được báo cáo cụ thể bao gồm: Rối loạn chức năng gan như tăng AST (aspartat aminotransferase), ALT (alanin aminotransferase) (0,4%), đau bụng (0,1%), buồn nôn (0,1%), khó chịu (0,07%).

Các ADR nghiêm trọng bao gồm: Giảm tiểu cầu (chưa rõ tần suất); viêm gan (chưa rõ tần suất), rối loạn chức năng gan (0,04%), vàng da (chưa rõ tần suất), suy gan (chưa rõ tần suất).

Các ADR khác được liệt kê trong bảng dưới đây:

Tần suất	$\geq 0,1\%$ và $< 0,5\%$	$< 0,1\%$	Chưa rõ
Phản ứng quá mẫn		Phát ban, ngứa, hồng ban, bóng nước	
Gan	Tăng AST, ALT	Tăng bilirubin	
Dạ dày-ruột	Đau bụng, buồn nôn	Nôn, tiêu chảy, chán ăn, đầy hơi, táo bón	Ợ nóng
Thận		Tăng nitơ urê máu, tăng creatinin	Thiếu niệu, tiểu rất
Huyết học		Thiếu máu, giảm bạch cầu	
Khác		Khó chịu, buồn ngủ, nhức đầu, co cứng, đau tứ chi, khó chịu ở ngực, hồi hộp, phù, nóng bừng	Tê, rụng tóc, ban xuất huyết, tăng CK, sốt

Cách xử trí ADR: Nếu gặp tác dụng phụ nghiêm trọng, nên ngưng thuốc và thông báo ngay cho bác sĩ điều trị.

Thông báo ngay cho bác sĩ hoặc dược sĩ những phản ứng có hại gặp phải khi sử dụng thuốc.

QUÁ LIỀU VÀ CÁCH XỬ TRÍ: Không có dữ liệu về sử dụng thuốc quá liều, không dùng quá liều chỉ định của thuốc. Trường hợp dùng thuốc quá liều, cần tích cực theo dõi để có biện pháp xử trí kịp thời.

ĐẶC TÍNH DƯỢC LỰC HỌC:

Cơ chế tác dụng:

Epalrestat là chất ức chế thuận nghịch, không cạnh tranh với enzym aldose reductase, một enzym tham gia vào tiến trình polyol. Trong điều kiện đường bình thường, hầu hết glucose tế bào được phosphoryl hóa thành glucose-6-phosphat bởi enzym hexokinase. Khoảng 3% lượng glucose không phosphoryl hóa được chuyển hóa theo tiến trình polyol thành sorbitol bởi enzym aldose reductase với sự có mặt của nicotinamid adenosin dinucleotid phosphat (NADPH). Sorbitol sau đó được chuyển thành fructose bởi enzym sorbitol dehydrogenase

với sự tham gia đồng thời của dạng oxy hóa của nicotinamid adenin dinucleotid (NAD^+). Trong điều kiện nồng độ glucose cao, tiến trình polyol được gia tăng và chiếm tới trên 30% quá trình chuyển hóa glucose.

Các nghiên cứu cho thấy việc tăng cường hoạt tính tiến trình polyol gây ra một chuỗi các mất cân bằng chuyển hóa có thể làm tăng các biến chứng vi mạch kéo dài do đái tháo 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 glucose và tăng hoạt tính enzym aldose reductase gây ra quá trình tích lũy sorbitol và tăng tính thấm tế bào, gây thiếu myo-inositol, từ đó làm giảm hoạt tính Na^+/K^+ adenosin triphosphatase 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 saccharid hóa. Sự hoạt hóa protein kinase C gia tăng biểu hiện bề mặt của các phân tử gắn kết nội mạc, dẫn đến gắn kết bạch cầu-tế bào nội mạc, từ đó có thể gia tăng quá trình xơ vữa động mạch.

Việc ức chế enzym aldose reductase có thể khắc phục các rối loạn chuyển hóa liên quan đến tiến trình polyol và các biến chứng do đái tháo đường.

ĐẶC TÍNH DƯỢC ĐỘNG HỌC:

Epalrestat đạt nồng độ đỉnh trong huyết tương là 3,9 $\mu\text{g/ml}$ khoảng 1 giờ sau khi uống liều 50 mg ở người khỏe mạnh trước khi ăn, diện tích đường cong nồng độ theo thời gian ($\text{AUC}_{0-\infty}$) là 6,4 $\mu\text{g.giờ/ml}$. Chuyển hóa của epalrestat 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 hai sản phẩm chuyển hóa là các hợp chất dạng monohydroxy- và dihydroxy-. Các enzym 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 hợp với acid glucuronic và sulfat. Epalrestat nguyên trạng không chuyển hóa được bài tiết vào nước tiểu cùng với dạng liên hợp sulfat của 2 sản phẩm chuyển hóa. Epalrestat có tỷ lệ liên kết protein cao (90,1%).

Chưa có nghiên cứu về dược động học của epalrestat trên bệnh nhân suy gan hoặc suy thận, trên bệnh nhân đái tháo đường hoặc bệnh nhân cao tuổi. Chưa có tương tác thuốc nào với epalrestat được báo cáo.

QUY CÁCH ĐÓNG GÓI: Hộp 3 vỉ, 6 vỉ, 10 vỉ x 10 viên.

ĐIỀU KIỆN BẢO QUẢN: Nơi khô, nhiệt độ dưới 30°C, tránh ánh sáng.

HẠN DÙNG: 36 tháng kể từ ngày sản xuất.

TIÊU CHUẨN CHẤT LƯỢNG: TCCS.

Sản xuất tại:

Công ty Cổ phần Dược phẩm Công nghệ cao Abipha
Địa chỉ: Lô đất CN-2, Khu công nghiệp Phú Nghĩa, Xã Phú Nghĩa,
Huyện Chương Mỹ, Thành phố Hà Nội, Việt Nam.
Website: www.abipha.com.vn

Điện thoại: 024.33520098 Fax: 024.63253888

Phân phối bởi:

Công ty Cổ phần Dược phẩm Quốc tế - UK Pharma
Địa chỉ: A5/1 ngõ 8 đường Quang Trung, tổ dân phố 6, Phường La Khê,
Quận Hà Đông, Thành phố Hà Nội, Việt Nam.