https://trungtamthuoc.com/

Rx – Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc

UNOGABA 600

M.S.D.N: 0311467407 - C.T.T.N.H.H
CÔNG TY TNHH MỘT THÀNH VIÊN ÂN PHÁT
Q. BÌNH THẠNH - T.P HỒ CHÍ MINH

Để xa tầm tay trẻ em

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng

THÀNH PHẦN CÔNG THỨC THUỐC

Mỗi viên nén bao phim chứa:

Thành phần dược chất: Gabapentin .....600 mg

Thành phần tá dược: Tinh bột bắp, mannitol, crospovidon XL, copovidon, talc, colloidal silicon dioxid, magnesi stearat, opadry trắng YS-1-18111 (talc, hydroxypropyl cellulose) .....vừa đủ 1 viên

DẠNG BÀO CHẾ

Viên nén bao phim.

Viên nén bao phim hình elip, màu trắng đến trắng ngà, có khắc rãnh bẻ viên ở cả hai mặt. Một mặt in chữ SG và số 1 ở hai phía của rãnh bẻ viên, mặt kia nhẵn.

CHỈ ĐỊNH

Động kinh

- Gabapentin được chỉ định để điều trị hỗ trợ các cơn động kinh cục bộ, có hoặc không có các cơn toàn thể thứ phát ở người lớn và trẻ em từ 6 tuổi trở lên.
- Gabapentin được dùng đơn trị liệu để điều trị các cơn động kinh cục bộ, có hoặc không có các cơn toàn thể thứ phát ở người lớn và thanh thiếu niên từ 12 tuổi trở lên.

Đau thần kinh ngoại biên

Gabapentin được chỉ định để điều trị đau thần kinh ngoại biên ở người lớn như đau thần kinh do bệnh thần kinh đái tháo đường, đau dây thần kinh sau herpes.

CÁCH DÙNG, LIỀU DÙNG

Thuốc được dùng đường uống, có thể uống cùng hoặc không cùng thức ăn. Nên uống nguyên viên với một cốc nước.

Thuốc gabapentin có trên thị trường ở các dạng viên nang 100 mg, 300 mg, 400 mg; viên nén 600 mg, 800 mg. Phác đồ liều dưới đây hướng dẫn chung cho tất cả các dạng bào chế và hàm lượng; bác sĩ điều trị cần chủ động chỉ định thuốc cho bệnh nhân phù hợp trên lâm sàng.

Phác đồ điều chỉnh liều khi bắt đầu điều trị đối với tất cả các chỉ định cho người lớn và thanh thiếu niên từ 12 tuổi trở lên:

BẢNG 1		
Bảng liều: Chuẩn liều ban đầu		
Ngày 1	Ngày 2	Ngày 3
300 mg x 1 lần/ngày	300 mg x 2 lần/ngày	300 mg x 3 lần/ngày

Khi ngừng gabapentin:

Trên các thực hành lâm sàng hiện nay, nếu cần phải ngừng dùng gabapentin thì phải ngừng thuốc một cách từ từ trong thời gian tối thiểu 1 tuần đối với tất cả các chỉ định.

Động kinh

Bệnh động kinh thường phải điều trị dài ngày. Liều dùng sẽ được chỉ định bởi bác sĩ điều trị dựa theo khả năng dung nạp của từng bệnh nhân và hiệu quả của thuốc.

https://trungtamthuoc.com/

Người lớn và thanh thiếu niên:

Các thử nghiệm lâm sàng cho thấy khoảng liều có hiệu quả của gabapentin là từ 900 - 3600 mg/ngày. Có thể bắt đầu điều trị với mức liều hiệu chuẩn được mô tả trong Bảng 1 hoặc dùng mức liều 300 mg x 3 lần/ngày ở ngày thứ nhất. Sau đó, tùy theo đáp ứng và khả năng dung nạp của từng bệnh nhân, mà liều có thể tăng thêm 300 mg/ngày, tăng dần mỗi 2 - 3 ngày đến khi đạt liều tối đa 3600 mg/ngày. Kéo dài khoảng thời gian điều chỉnh liều có thể thích hợp với từng bệnh nhân. Thời gian tối thiểu để đạt mức liều 1800 mg/ngày là 1 tuần, đạt mức liều 2400 mg/ngày trong tổng cộng là 2 tuần và để đạt mức liều 3600 mg/ngày trong tổng cộng là 3 tuần. Liều dùng lên đến 4800 mg/ngày đã được dung nạp tốt trong các nghiên cứu lâm sàng nhãn mở và dài hạn. Tổng liều hàng ngày nên được chia thành 3 liều nhỏ, khoảng thời gian tối đa giữa 2 liều dùng không nên vượt quá 12 giờ để tránh bùng phát các cơn co giật.

Trẻ em từ 6 tuổi trở lên:

Liều khởi đầu nên nằm trong khoảng 10 - 15 mg/kg/ngày và chỉnh liều tăng dần trong khoảng thời gian khoảng 3 ngày để đạt đến mức liều có hiệu quả. Liều có hiệu quả của gabapentin ở trẻ em từ 6 tuổi trở lên là 25 - 35 mg/kg/ngày. Liều lên đến 50 mg/kg/ngày đã được dung nạp tốt trong một nghiên cứu lâm sàng dài hạn. Tổng liều hàng ngày nên được chia thành 3 liều nhỏ, khoảng thời gian tối đa giữa 2 liều dùng không nên vượt quá 12 giờ.

Không cần phải theo dõi nồng độ gabapentin trong huyết tương để tối ưu hóa liệu pháp điều trị với gabapentin. Ngoài ra, gabapentin có thể được sử dụng kết hợp với các thuốc chống động kinh khác mà không cần quan tâm đến sự thay đổi nồng độ gabapentin trong huyết tương hoặc nồng độ của các thuốc chống động kinh khác trong huyết thanh.

Đau thần kinh ngoại biên

Người lớn:

Có thể bắt đầu điều trị với mức liều hiệu chuẩn được mô tả trong Bảng 1 hoặc dùng mức liều khởi đầu là 900 mg/ngày và chia thành 3 liều nhỏ. Sau đó, tùy theo đáp ứng và khả năng dung nạp của từng bệnh nhân, mà liều có thể tăng thêm 300 mg/ngày, tăng dần mỗi 2 - 3 ngày đến khi đạt mức liều tối đa 3600 mg/ngày. Kéo dài khoảng thời gian điều chỉnh liều có thể thích hợp với từng bệnh nhân. Thời gian tối thiểu để đạt mức liều 1800 mg/ngày là 1 tuần, đạt mức liều 2400 mg/ngày trong tổng cộng là 2 tuần và để đạt mức liều 3600 mg/ngày trong tổng cộng là 3 tuần.

Trong điều trị các cơn đau thần kinh ngoại biên như đau thần kinh do bệnh thần kinh đái tháo đường và đau dây thần kinh sau herpes, hiệu quả và an toàn vẫn chưa được kiểm chứng trong các nghiên cứu lâm sàng cho thời gian điều trị dài hơn 5 tháng. Nếu bệnh nhân yêu cầu dùng thuốc lâu hơn 5 tháng để điều trị các cơn đau thần kinh ngoại biên, bác sĩ điều trị nên đánh giá tình trạng lâm sàng của bệnh nhân và quyết định có cần thiết tăng thời gian điều trị hay không.

Hướng dẫn cho tất cả các chỉ định

Ở những bệnh nhân có sức khỏe tổng quát không tốt như cân nặng cơ thể thấp, sau phẫu thuật ghép tạng..., liều dùng nên được điều chỉnh chậm hơn, bằng cách dùng liều thấp hơn hay kéo dài khoảng thời gian giữa các đợt tăng liều điều trị.

Người cao tuổi (trên 65 tuổi):

Có thể cần phải điều chỉnh liều dùng ở người cao tuổi do suy giảm chức năng thận (xem Bảng 2). Ngủ gà, phù ngoại biên và suy nhược có thể gặp phải thường xuyên hơn ở người cao tuổi.

Suy thận:

Nên điều chỉnh liều ở các bệnh nhân bị suy giảm chức năng thận theo Bảng 2 và/hoặc những bệnh nhân đang được thẩm phân máu. Gabapentin có thể được dùng tuân theo các khuyến nghị về liều dùng cho bệnh nhân suy thận.

https://trungtamthuoc.com/

BẢNG 2	
Liều gabapentin ở người lớn dựa trên chức năng thận	
Độ thanh thải creatinin (ml/phút)	Tổng liều dùng hàng ngày[a] (mg/ngày)
≥ 80	900 - 3600
50 - 79	600 - 1800
30 - 49	300 - 900
15 - 29	150[b] - 600
< 15[c]	150[b] - 300

[a] Tổng liều hàng ngày nên được chia thành 3 lần/ngày. Nên giảm liều ở bệnh nhân suy thận có độ thanh thải < 79 ml/ phút.

[b] Liều 150 mg hàng ngày có thể được dùng thành liều 300 mg cách ngày.

[c] Đối với bệnh nhân có độ thanh thải creatinin < 15 ml/phút, nên giảm liều dùng hàng ngày tương ứng với độ thanh thải creatinin (ví dụ: bệnh nhân có độ thanh thải creatinin là 7,5 ml/ phút thì nên dùng ½ liều dùng hàng ngày của bệnh nhân có độ thanh thải 15 ml/phút).

Bệnh nhân đang thẩm phân máu:

Đối với các bệnh nhân đang được thẩm phân máu mà chưa từng dùng gabapentin, nên dùng liều khởi đầu 300 - 400 mg và sau đó dùng liều 200 - 300 mg gabapentin sau mỗi đợt lọc máu kéo dài 4 giờ. Không nên điều trị với gabapentin vào những ngày không lọc máu.

Đối với bệnh nhân suy thận phải thẩm phân máu, liều duy trì của gabapentin nên dựa trên mức liều dùng khuyến cáo được thể hiện ở Bảng 2. Ngoài mức liều duy trì, thì nên dùng thêm một liều 200 - 300 mg sau mỗi đợt lọc máu kéo dài 4 giờ.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

Mẫn cảm với gabapentin hoặc bất cứ thành phần nào của thuốc.

CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG KHI DÙNG THUỐC

Các phản ứng bất lợi ở da nghiêm trọng (SCAR)

Các phản ứng bất lợi ở da nghiêm trọng, có thể đe dọa tính mạng bao gồm hội chứng Stevens-Johnson (SJS), hoại tử thượng bì nhiễm độc (TEN) và phát ban do thuốc kèm theo tăng bạch cầu ái toan và các triệu chứng toàn thân (DRESS) đã được báo cáo ở những bệnh nhân dùng gabapentin. Khi kê đơn thuốc cần thông báo cho bệnh nhân biết về các dấu hiệu, triệu chứng và theo dõi chặt chẽ các phản ứng trên da. Nếu xuất hiện các dấu hiệu và triệu chứng gợi ý những phản ứng này, nên ngừng sử dụng gabapentin ngay lập tức và xem xét phương pháp điều trị thay thế (nếu thích hợp).

Nếu đã xuất hiện phản ứng nghiêm trọng như SJS, TEN hoặc DRESS khi sử dụng gabapentin, không được bắt đầu lại điều trị bằng gabapentin ở các bệnh nhân này bất cứ lúc nào.

Sốc phản vệ

Gabapentin có thể gây sốc phản vệ. Các dấu hiệu và triệu chứng trong các trường hợp đã được báo cáo bao gồm khó thở, sưng môi, cổ họng, lưỡi và hạ huyết áp cần điều trị khẩn cấp. Bệnh nhân cần được hướng dẫn ngừng dùng gabapentin và cần được chăm sóc y tế ngay nếu có các dấu hiệu hoặc triệu chứng sốc phản vệ.

Ý tưởng và hành vi tự sát

Ý tưởng và hành vi tự sát đã được báo cáo ở những bệnh nhân được điều trị bằng thuốc chống động kinh trong một số chỉ định. Phân tích meta các thử nghiệm đối chứng giả dược ngẫu nhiên đối với các thuốc chống động kinh cũng cho thấy nguy cơ tự sát và hành vi tự sát tăng lên. Cơ chế của nguy cơ này chưa được biết. Các trường hợp có ý tưởng và hành vi tự sát đã được quan sát thấy ở những bệnh nhân được điều trị bằng gabapentin sau khi đưa thuốc ra thị trường.

https://trungtamthuoc.com/

Bệnh nhân (và người chăm sóc bệnh nhân) cần được tư vấn về việc phải tìm lời khuyên y tế khi xuất hiện dấu hiệu của ý tưởng hoặc hành vi tự sát. Bệnh nhân cần được theo dõi các dấu hiệu về ý tưởng và hành vi tự sát và cần cân nhắc phương pháp điều trị thích hợp.

Nên cân nhắc việc ngừng điều trị bằng gabapentin trong trường hợp có ý tưởng và hành vi tự sát.

Viêm tụy cấp

Nếu bệnh nhân bị viêm tụy cấp khi điều trị bằng gabapentin, nên ngưng dùng gabapentin.

Động kinh

Mặc dù chưa có các bằng chứng về các cơn động kinh bùng phát với gabapentin, nhưng việc ngừng đột ngột các thuốc chống co giật ở các bệnh nhân động kinh có thể làm xuất hiện trạng thái động kinh ở bệnh nhân.

Giống như các thuốc chống động kinh khác, một số bệnh nhân có thể bị tăng tần suất động kinh hoặc xuất hiện cơn co giật mới khởi phát khi dùng gabapentin.

Gabapentin không được coi là có hiệu quả đối với cơn động kinh toàn thể nguyên phát như động kinh vắng ý thức và có thể làm trầm trọng thêm cơn động kinh ở một số bệnh nhân. Do đó, nên thận trọng khi sử dụng gabapentin ở những bệnh nhân bị động kinh hỗn hợp bao gồm động kinh vắng ý thức.

Điều trị bằng gabapentin có liên quan đến chứng chóng mặt và ngủ gà, điều này có thể làm tăng nguy cơ chấn thương do tai nạn (té ngã). Cũng có báo cáo sau khi thuốc lưu hành về chứng lú lẫn, mất ý thức và sa sút tinh thần. Vì vậy, cần khuyến nghị bệnh nhân sử dụng thuốc thận trọng cho đến khi quen thuộc với các ảnh hưởng có thể có của thuốc.

Sử dụng đồng thời với opioid và các thuốc ức chế thần kinh trung ương khác

Những bệnh nhân cần được điều trị đồng thời với các thuốc ức chế thần kinh trung ương, bao gồm thuốc nhóm opioid cần được theo dõi cẩn thận về các dấu hiệu ức chế hệ thần kinh trung ương (CNS) như ngủ gà, giảm tỉnh táo và ức chế hô hấp. Bệnh nhân sử dụng đồng thời gabapentin với morphin có thể dẫn đến tăng nồng độ gabapentin. Nên giảm liều gabapentin hoặc điều trị đồng thời với thuốc ức chế thần kinh trung ương bao gồm cả opioid một cách thích hợp.

Cần thận trọng khi kê đơn gabapentin đồng thời với opioid do nguy cơ ức chế thần kinh trung ương. Trong một nghiên cứu bệnh chứng, quan sát, dựa trên quần thể đối với những người sử dụng opioid, kê đơn đồng thời opioid và gabapentin có liên quan đến việc tăng nguy cơ tử vong liên quan đến opioid so với việc chỉ sử dụng opioid (tỷ lệ chênh lệch được điều chỉnh [aOR], 1,49 [95% CI, 1,18 đến 1,88, $p < 0,001$]).

Suy hô hấp

Gabapentin có liên quan đến suy hô hấp nặng. Bệnh nhân có chức năng hô hấp bị suy giảm, có bệnh hô hấp hay thần kinh, suy thận, dùng đồng thời với các thuốc ức chế hệ thần kinh trung ương và ở người cao tuổi có nguy cơ cao gặp phải tác dụng không mong muốn này. Cần điều chỉnh liều ở những bệnh nhân này.

Người cao tuổi (trên 65 tuổi)

Không có nghiên cứu có hệ thống nào được tiến hành với gabapentin ở bệnh nhân từ 65 tuổi trở lên. Trong một nghiên cứu mù đôi, tỷ lệ phần trăm bệnh nhân bị đau thần kinh, ngủ gà, phù ngoại biên và suy nhược xảy ra ở bệnh nhân từ 65 tuổi trở lên cao hơn so với ở bệnh nhân trẻ hơn. Ngoài những phát hiện này, các nghiên cứu lâm sàng ở nhóm tuổi này không cho thấy thông tin về tác dụng không mong muốn khác với những gì được quan sát thấy ở những bệnh nhân trẻ hơn.

Nhóm bệnh nhi

Ảnh hưởng của liệu pháp điều trị kéo dài với gabapentin (trên 36 tuần) đối với học tập, trí tuệ và sự phát triển ở trẻ em và thanh thiếu niên chưa được nghiên cứu đầy đủ. Cần cân nhắc giữa lợi ích của việc sử dụng liệu pháp điều trị kéo dài so với những nguy cơ có thể xảy ra của liệu pháp này.

https://trungtamthuoc.com/

Lạm dụng và lệ thuộc thuốc

Gabapentin có thể gây lệ thuộc thuốc, có thể xảy ra ở liều điều trị. Các trường hợp dùng sai hay lạm dụng thuốc đã được báo cáo. Bệnh nhân có tiền sử lạm dụng chất kích thích có thể có nguy cơ lạm dụng và lệ thuộc gabapentin cao hơn và gabapentin nên được sử dụng thận trọng ở những bệnh nhân này. Trước khi kê đơn gabapentin, cần đánh giá cẩn thận nguy cơ sử dụng sai, lạm dụng hoặc lệ thuộc của bệnh nhân. Bệnh nhân được điều trị bằng gabapentin nên được theo dõi các triệu chứng của tình trạng lạm dụng hoặc lệ thuộc gabapentin, chẳng hạn như tăng dung nạp, tăng liều và hành vi tìm kiếm thuốc.

Các triệu chứng cai thuốc

Sau khi ngừng điều trị ngắn hạn và dài hạn với gabapentin, đã quan sát thấy các triệu chứng cai thuốc. Các triệu chứng cai thuốc có thể xảy ra ngay sau khi ngừng thuốc, thường là trong vòng 48 giờ. Các triệu chứng được báo cáo thường xuyên nhất bao gồm lo lắng, mất ngủ, buồn nôn, đau, đổ mồ hôi, run, đau đầu, trầm cảm, cảm thấy bất thường, chóng mặt và khó chịu. Sự xuất hiện các triệu chứng cai thuốc sau khi ngừng dùng gabapentin cho thấy nguy cơ về lệ thuộc thuốc. Bệnh nhân cần được thông báo về nguy cơ này khi bắt đầu điều trị. Nếu cần ngưng dùng gabapentin, nên thực hiện giảm từ từ trong tối thiểu 1 tuần bất kể chỉ định.

Xét nghiệm

Kết quả dương tính giả đã được báo cáo ở các xét nghiệm bán định lượng xác định protein niệu bằng việc sử dụng que nhúng. Vì vậy, khuyến nghị xác minh kết quả xét nghiệm dương tính như vậy bằng các phương pháp dựa trên nguyên tắc phân tích khác như phương pháp Biuret, phương pháp đo độ đục hoặc phương pháp liên kết thuốc nhuộm hoặc sử dụng những phương pháp thay thế này ngay từ đầu.

Cảnh báo tá dược

Thuốc này có chứa dưới 1 mmol (23 mg) natri trong mỗi viên, về cơ bản được xem như "không chứa natri".

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

Phụ nữ có thai

Nguy cơ liên quan đến bệnh động kinh và các thuốc chống động kinh nói chung:

Nguy cơ dị tật bẩm sinh tăng lên gấp 2 - 3 lần ở con của những bà mẹ được điều trị với thuốc chống động kinh. Các báo cáo thường gặp nhất là sứt môi, dị tật tim mạch và dị tật ống thần kinh. Điều trị bằng nhiều loại thuốc chống động kinh có thể có nguy cơ dị tật bẩm sinh cao hơn so với đơn trị liệu, do đó quan trọng là phải thực hiện đơn trị liệu bất cứ khi nào có thể. Cần đưa ra khuyến cáo cho những phụ nữ dự định có thai hoặc có khả năng mang thai và cần xem xét nhu cầu điều trị chống động kinh khi phụ nữ dự định có thai. Không nên ngừng thuốc chống động kinh đột ngột vì có thể dẫn đến khởi phát các cơn động kinh, có thể gây hậu quả nghiêm trọng cho cả mẹ và con. Hiếm khi quan sát thấy sự chậm phát triển ở trẻ có mẹ bị động kinh. Không thể xác nhận được sự chậm phát triển là do di truyền, yếu tố xã hội, bệnh động kinh của mẹ hay do liệu pháp chống động kinh.

Nguy cơ liên quan của gabapentin:

Gabapentin đi qua nhau thai người.

Không có hoặc có rất ít dữ liệu về việc sử dụng gabapentin ở phụ nữ mang thai.

Các nghiên cứu trên động vật đã cho thấy độc tính sinh sản. Những nguy cơ tiềm ẩn cho con người là không xác định. Không nên sử dụng gabapentin trong thời kỳ mang thai trừ khi lợi ích mang lại cho người mẹ vượt trội nguy cơ tiềm ẩn đối với thai nhi.

Không có kết luận chắc chắn nào được đưa ra về liệu gabapentin có liên quan đến việc tăng nguy cơ dị tật bẩm sinh khi dùng trong thời kỳ mang thai hay không, vì bản thân bệnh động kinh và sự hiện diện đồng thời của các thuốc chống động kinh trong mỗi lần mang thai đều được báo cáo.

https://trungtamthuoc.com/

Hội chứng cai thuốc ở trẻ sơ sinh đã được báo cáo ở những trẻ sơ sinh phơi nhiễm với gabapentin trong tử cung. Tiếp xúc đồng thời với gabapentin và các opioid khi mang thai có thể làm tăng nguy cơ mắc hội chứng cai thuốc ở trẻ sơ sinh. Trẻ sơ sinh cần được theo dõi cẩn thận.

Phụ nữ cho con bú

Gabapentin được bài tiết vào sữa mẹ. Vì tác dụng trên trẻ bú sữa mẹ chưa được biết rõ nên cần thận trọng khi dùng gabapentin cho người mẹ đang cho con bú. Chỉ dùng gabapentin cho phụ nữ đang cho con bú khi thật cần thiết và đã cân nhắc kỹ lợi ích cao hơn nguy cơ rủi ro.

Khả năng sinh sản

Không có ảnh hưởng đến khả năng sinh sản trong các nghiên cứu trên động vật.

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

Gabapentin ít ảnh hưởng hoặc ảnh hưởng vừa phải đến khả năng lái xe và vận hành máy móc. Gabapentin tác động đến hệ thần kinh trung ương và có thể gây buồn ngủ, chóng mặt hoặc các triệu chứng liên quan khác. Cho dù các tác dụng không mong muốn chỉ ở mức độ nhẹ hoặc trung bình, cũng có thể gây nguy hiểm cho bệnh nhân khi lái xe hoặc vận hành máy móc, đặc biệt khi bắt đầu điều trị và sau khi tăng liều.

TƯƠNG TÁC, TƯƠNG KỴ CỦA THUỐC

Tương tác thuốc

Đã có các báo cáo tự phát và báo cáo trong y văn về sự ức chế hô hấp, giảm tỉnh táo và tử vong liên quan đến gabapentin khi dùng chung với các thuốc ức chế thần kinh trung ương, bao gồm cả opioid. Trong một vài báo cáo, các tác giả cho rằng cần quan tâm đặc biệt đến hiện tượng này khi dùng kết hợp gabapentin và opioid, đặc biệt ở bệnh nhân thể trạng yếu, người cao tuổi, bệnh nhân mắc bệnh hô hấp nghiêm trọng, sử dụng nhiều thuốc và những người bị rối loạn lạm dụng chất kích thích.

Trong một nghiên cứu trên những người tình nguyện khỏe mạnh (N=12), khi sử dụng viên nang morphin 60 mg giải phóng có kiểm soát 2 giờ trước khi dùng viên nang gabapentin 600 mg, diện tích dưới đường cong (AUC) của gabapentin tăng 44% so với khi dùng gabapentin không có morphin. Vì vậy, những bệnh nhân phải điều trị đồng thời với gabapentin và opioid cần được theo dõi cẩn thận khi có dấu hiệu ức chế thần kinh trung ương như ngủ gà, giảm tỉnh táo và ức chế hô hấp và phải giảm liều gabapentin hoặc opioid một cách hợp lý.

Không quan sát thấy có sự tương tác nào giữa gabapentin và phenobarbital, phenytoin, acid valproic hay carbamazepin.

Các đặc tính dược động học của gabapentin ở trạng thái nồng độ hằng định trong huyết tương là tương tự giữa các đối tượng khỏe mạnh và các bệnh nhân động kinh đang điều trị bằng các thuốc chống động kinh này.

Dùng đồng thời gabapentin và các thuốc tránh thai chứa norethindron và/hoặc ethinyl estradiol không làm ảnh hưởng đến các đặc tính dược động học ở trạng thái nồng độ hằng định trong huyết tương của cả hai thuốc.

Dùng đồng thời gabapentin với các thuốc kháng acid chứa muối nhôm và muối magnesi làm giảm sinh khả dụng của gabapentin khoảng 24%, do đó nên dùng gabapentin khoảng 2 giờ sau khi uống các thuốc kháng acid.

Sự bài tiết của gabapentin qua thận không bị ảnh hưởng bởi probenecid.

Sự bài tiết của gabapentin qua thận bị giảm nhẹ khi dùng phối hợp với cimetidin, nhưng điều này không có ý nghĩa lâm sàng.

Tương kỵ

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

https://trungtamthuoc.com/

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN CỦA THUỐC

Các tác dụng không mong muốn được quan sát thấy trong các nghiên cứu lâm sàng trên bệnh động kinh (liệu pháp hỗ trợ và đơn trị liệu) và đau do bệnh lý thần kinh được trình bày theo tần suất và hệ cơ quan: 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). Trong trường hợp một tác dụng không mong muốn được quan sát thấy ở các tần suất khác nhau trong các nghiên cứu lâm sàng thì sẽ được trình bày theo tần suất cao nhất.

Các phản ứng bổ sung được báo cáo từ kinh nghiệm hậu mãi được liệt kê dưới dạng "Không rõ tần suất" (không thể ước tính từ dữ liệu có sẵn) trong danh sách bên dưới.

Trong mỗi nhóm tần suất, các tác dụng không mong muốn được trình bày theo trình tự mức độ nghiêm trọng giảm dần.

Hệ cơ quan	**Tác dụng không mong muốn**
Nhiễm khuẩn và nhiễm ký sinh trùng	
Rất thường gặp	Nhiễm virus
Thường gặp	Viêm phổi, nhiễm khuẩn đường hô hấp, nhiễm khuẩn đường tiết niệu, nhiễm khuẩn, viêm tai giữa
Rối loạn máu và hệ bạch huyết	
Thường gặp	Giảm bạch cầu
Không rõ tần suất	Giảm tiểu cầu
Rối loạn hệ miễn dịch	
Ít gặp	Các phản ứng dị ứng (ví dụ nổi mề đay)
Không rõ tần suất	Hội chứng quá mẫn (một phản ứng toàn thân với biểu hiện đa dạng bao gồm sốt, phát ban, viêm gan, bệnh hạch bạch huyết, tăng bạch cầu ái toan và một số dấu hiệu và triệu chứng khác), phản ứng sốc phản vệ
Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng	
Thường gặp	Chán ăn, tăng cảm giác thèm ăn
Ít gặp	Tăng đường huyết (thường thấy ở bệnh nhân đái tháo đường)
Hiếm gặp	Hạ đường huyết (thường thấy ở bệnh nhân đái tháo đường)
Không rõ tần suất	Hạ natri huyết
Rối loạn tâm thần	
Thường gặp	Thái độ chống đối, lú lẫn và dễ xúc động, trầm cảm, lo lắng, căng thẳng, suy nghĩ bất thường
Ít gặp	Kích động
Không rõ tần suất	Ý tưởng tự sát, ảo giác, lệ thuộc thuốc
Rối loạn hệ thần kinh	
Rất thường gặp	Ngủ gà, chóng mặt, mất điều hòa
Thường gặp	Co giật, tăng động, rối loạn ngôn ngữ, chứng hay quên, rùng mình, mất ngủ, đau đầu, dị cảm, giảm cảm giác, bất thường trong phối hợp, rung giật nhãn cầu, tăng, giảm hoặc mất phản xạ
Ít gặp	Giảm chức năng vận động, sa sút tinh thần
Hiếm gặp	Mất ý thức
Không rõ tần suất	Các rối loạn vận động khác (ví dụ: chứng múa vờn, rối loạn vận động, rối loạn trương lực cơ)
Rối loạn mắt	
Thường gặp	Rối loạn thị giác như giảm thị lực, nhìn đôi

https://trungtamthuoc.com/

Hệ cơ quan	Tác dụng không mong muốn
Rối loạn tai và mê đạo	
Thường gặp	Chóng mặt
Không rõ tần suất	Ù tai
Rối loạn tim	
Ít gặp	Đánh trống ngực
Rối loạn mạch máu	
Thường gặp	Tăng huyết áp, giãn mạch
Rối loạn hô hấp, lồng ngực và trung thất	
Thường gặp	Khó thở, viêm phế quản, viêm họng, ho, viêm mũi
Hiếm gặp	Suy hô hấp
Rối loạn tiêu hóa	
Thường gặp	Buồn nôn, nôn, bất thường về răng miệng, viêm nướu, tiêu chảy, đau bụng, khó tiêu, táo bón, khô miệng hoặc cổ họng, đầy hơi
Ít gặp	Chứng khó nuốt
Không rõ tần suất	Viêm tụy
Rối loạn gan-mật	
Không rõ tần suất	Viêm gan, vàng da
Rối loạn da và mô dưới da	
Thường gặp	Phù mặt, ban xuất huyết thường được mô tả là những vết bầm tím do chấn thương thể chất, phát ban, ngứa và nổi mụn
Không rõ tần suất	Hội chứng Stevens-Johnson, hoại tử thượng bì nhiễm độc, phù mạch, hồng ban đa dạng, rụng tóc, phát ban do thuốc kèm theo tăng bạch cầu ái toan và các triệu chứng toàn thân
Rối loạn cơ xương và mô liên kết	
Thường gặp	Đau khớp, đau cơ, đau lưng, co cơ
Không rõ tần suất	Tiêu cơ vân, rung giật cơ
Rối loạn thận và tiết niệu	
Không rõ tần suất	Suy thận cấp, tiểu không tự chủ
Rối loạn hệ thống sinh sản và vú	
Thường gặp	Liệt dương
Không rõ tần suất	Phì đại vú, vú to ở nam giới, rối loạn khả năng tình dục (bao gồm cả những thay đổi về ham muốn tình dục, rối loạn xuất tinh và không đạt được cảm giác cực khoái)
Rối loạn chung và tại nơi dùng thuốc	
Rất thường gặp	Mệt mỏi, sốt
Thường gặp	Phù ngoại vi, dáng đi bất thường, suy nhược, đau, khó chịu, hội chứng cúm
Ít gặp	Phù toàn thân
Không rõ tần suất	Các triệu chứng cai thuốc* Những cái chết đột ngột không rõ nguyên nhân đã được báo cáo có mối quan hệ nhân quả với việc điều trị với gabapentin chưa được thiết lập
Xét nghiệm	
Thường gặp	Số lượng bạch cầu giảm, tăng cân

https://trungtamthuoc.com/

Hệ cơ quan	Tác dụng không mong muốn
Ít gặp	Xét nghiệm chức năng gan tăng SGOT (AST), SGPT (ALT) và bilirubin
Không rõ tần suất	Tăng creatin phosphokinase huyết
Chấn thương, ngộ độc và các biến chứng phẫu thuật	
Thường gặp	Chấn thương do tai nạn, gãy xương, trầy da
Ít gặp	Ngã

* Sau khi ngừng điều trị ngắn hạn và dài hạn với gabapentin, đã quan sát thấy các triệu chứng cai thuốc. Các triệu chứng cai thuốc có thể xảy ra ngay sau khi ngừng thuốc, thường là trong vòng 48 giờ. Các triệu chứng được báo cáo thường xuyên nhất bao gồm lo lắng, mất ngủ, buồn nôn, đau, đổ mồ hôi, run, đau đầu, trầm cảm, cảm thấy bất thường, chóng mặt và khó chịu. Sự xuất hiện các triệu chứng cai thuốc sau khi ngừng dùng gabapentin cho thấy nguy cơ về lệ thuộc thuốc. Bệnh nhân cần được thông báo về nguy cơ này khi bắt đầu điều trị. Nếu cần ngưng dùng gabapentin, nên thực hiện giảm từ từ trong tối thiểu 1 tuần bất kể chỉ định.

Các trường hợp viêm tụy cấp đã được báo cáo khi điều trị bằng gabapentin. Mối quan hệ nhân quả với gabapentin là chưa rõ ràng.

Ở những bệnh nhân đang thẩm phân do suy thận giai đoạn cuối, bệnh viêm cơ với nồng độ creatin kinase tăng cao đã được báo cáo.

Nhiễm khuẩn đường hô hấp, viêm tai giữa, co giật và viêm phế quản chỉ được báo cáo trong các nghiên cứu lâm sàng ở trẻ em. Ngoài ra, trong các nghiên cứu lâm sàng ở trẻ em, hành vi hung hăng và tăng động đã được báo cáo thường gặp.

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

Ngộ độc cấp, đe dọa tính mạng chưa được quan sát với các liều gabapentin lên đến 49 g. Các triệu chứng của quá liều bao gồm chóng mặt, nhìn đôi, nói líu lưỡi, buồn ngủ, mất ý thức và tiêu chảy nhẹ. Tất cả các bệnh nhân này đều hồi phục hoàn toàn sau khi được điều trị hỗ trợ. Giảm hấp thu gabapentin ở liều cao hơn có thể làm hạn chế sự hấp thu của thuốc tại thời điểm bệnh nhân bị quá liều và do đó, làm giảm thiểu mức độ ngộ độc do dùng quá liều.

Dùng quá liều gabapentin, đặc biệt khi kết hợp với các thuốc ức chế thần kinh trung ương khác, có thể dẫn đến hôn mê.

Mặc dù gabapentin có thể được loại khỏi cơ thể bằng thẩm phân máu, nhưng dựa theo những kinh nghiệm đã có, thì thường không cần đến phương pháp này. Tuy nhiên, với những bệnh nhân suy thận nặng, thẩm phân máu có thể được chỉ định.

Không xác định được liều gây chết của gabapentin đường uống ở chuột nhắt và chuột cống với liều cao đến 8000 mg/kg. Các triệu chứng của ngộ độc cấp ở động vật bao gồm mất điều hòa vận động, khó thở, sa mí mắt, giảm hoạt động hoặc dễ bị kích động.

ĐẶC TÍNH DƯỢC LỰC HỌC

Nhóm dược lý: Các thuốc chống động kinh khác.

Mã ATC: N02BF01

Gabapentin dễ dàng đi vào não và ngăn ngừa cơn động kinh ở một số mô hình động kinh ở động vật. Gabapentin không có ái lực với thụ thể GABAA hoặc GABAB cũng như không làm thay đổi quá trình chuyển hóa của GABA. Gabapentin không liên kết với các thụ thể dẫn truyền thần kinh khác của não và không tương tác với các kênh natri. Gabapentin có liên kết ái lực cao với tiểu đơn vị α2δ (alpha-2-delta) của kênh calci phụ thuộc điện thế và có thể việc liên kết với tiểu đơn vị α2δ liên quan đến tác dụng chống co giật của gabapentin ở động vật. Sàng lọc mở rộng không gợi ý bất kỳ mục tiêu thuốc nào khác ngoài α2δ.

https://trungtamthuoc.com/

Bằng chứng từ một số mô hình tiền lâm sàng cho thấy hoạt động dược lý của gabapentin có thể được điều hòa thông qua liên kết với α2δ qua việc giảm giải phóng các chất dẫn truyền thần kinh kích thích ở các vùng của hệ thần kinh trung ương. Cách thức như vậy có thể là nền tảng cho hoạt động chống động kinh của gabapentin. Sự liên quan của những hoạt động này với tác dụng chống co giật của gabapentin ở người vẫn chưa được xác định.

Gabapentin cũng cho thấy hiệu quả trong một số mô hình gây đau ở động vật tiền lâm sàng. Sự liên kết đặc hiệu của gabapentin với tiểu đơn vị α2δ được cho là dẫn đến một số tác động có thể gây ra tác dụng giảm đau ở mô hình động vật. Tác động giảm đau của gabapentin có thể xảy ra ở tủy sống cũng như mạnh hơn ở trung tâm não thông qua tương tác với các con đường ức chế đau. Sự liên quan của các đặc tính tiền lâm sàng này với tác dụng lâm sàng ở người vẫn chưa được biết rõ.

Tính an toàn và hiệu quả lâm sàng:

Một thử nghiệm lâm sàng về điều trị bổ trợ các cơn động kinh cục bộ ở đối tượng bệnh nhi, trong độ tuổi từ 3 đến 12 tuổi, cho thấy sự khác biệt về số lượng nhưng không có ý nghĩa thống kê về tỷ lệ đáp ứng 50% nghiêng về nhóm gabapentin so với nhóm giả dược.

Các phân tích hậu kiểm bổ sung về tỷ lệ đáp ứng theo độ tuổi không cho thấy tác động có ý nghĩa thống kê của tuổi tác, dù là biến liên tục hay biến nhị phân (nhóm tuổi 3 - 5 và 6 - 12 tuổi).

Dữ liệu từ các phân tích hậu kiểm bổ sung được tóm tắt trong bảng dưới đây:

Đáp ứng (cải thiện ≥ 50%) theo trị liệu và độ tuổi MITT*			
Nhóm tuổi	Giả dược	Gabapentin	Giá trị P
< 6 tuổi	4/21 (19,0%)	4/17 (23,5%)	0,7362
6 - 12 tuổi	17/99 (17,2%)	20/96 (20,8%)	0,5144

* Mục đích điều trị được điều chỉnh theo dân số (MITT) được xác định là tất cả các bệnh nhân được chọn ngẫu nhiên để nghiên cứu thuốc đều có sẵn nhật ký cơn động kinh trong 28 ngày có thể đánh giá được trong cả giai đoạn cơ bản và giai đoạn mù đôi.

ĐẶC TÍNH DƯỢC ĐỘNG HỌC

Hấp thu

Sau khi uống, nồng độ đỉnh của gabapentin trong huyết tương đạt được trong vòng 2 đến 3 giờ.

Sinh khả dụng của gabapentin (tỷ lệ liều hấp thụ) có xu hướng giảm khi tăng liều. Sinh khả dụng tuyệt đối của viên nang 300 mg là khoảng 60%.

Thức ăn, kể cả chế độ ăn nhiều chất béo, không có tác dụng đáng kể về mặt lâm sàng đối với dược động học của gabapentin.

Dược động học của gabapentin không bị ảnh hưởng khi dùng liều lặp lại. Dù nồng độ gabapentin trong huyết tương nhìn chung nằm trong khoảng từ 2 µg/ml đến 20 µg/ml trong các nghiên cứu lâm sàng, nhưng nồng độ như vậy không mang tính dự đoán về tính an toàn hoặc hiệu quả.

Phân bố

Gabapentin không liên kết với protein huyết tương và có thể tích phân bố là 57,7 lít. Ở bệnh nhân động kinh, nồng độ gabapentin trong dịch não tủy (CFS) là khoảng 20% so với nồng độ thuốc trong huyết tương ở trạng thái ổn định. Gabapentin được bài tiết vào sữa mẹ.

Chuyển hóa

Không có bằng chứng về sự chuyển hóa gabapentin trong cơ thể. Gabapentin không gây cảm ứng các enzym oxidase có chức năng hỗn hợp ở gan chịu trách nhiệm chuyển hóa thuốc.

Thải trừ

Gabapentin chỉ được thải trừ qua thận dưới dạng không đổi. Thời gian bán thải của gabapentin trong huyết tương không phụ thuộc liều và trung bình khoảng 5 - 7 giờ.

https://trungtamthuoc.com/

Ở bệnh nhân cao tuổi và người suy thận, độ thanh thải gabapentin huyết tương bị giảm. Hệ số đào thải, độ thanh thải huyết tương, độ thanh thải của gabapentin ở thận tỷ lệ thuận trực tiếp với độ thanh thải creatinin.

Gabapentin có thể bị loại khỏi huyết tương bằng thẩm phân máu, vì vậy cần điều chỉnh liều đối với những bệnh nhân này.

Các đặc tính dược động học của gabapentin ở trẻ em đã được xác định trên 50 đối tượng khỏe mạnh từ 1 tháng tuổi đến 12 tuổi. Nhìn chung, nồng độ của gabapentin trong huyết tương ở trẻ em > 5 tuổi tương tự như người lớn khi tính liều theo mg/kg.

Trong một nghiên cứu dược động học trên 24 trẻ em khỏe mạnh có tuổi từ 1 - 48 tháng tuổi cho thấy AUC thấp hơn khoảng 30%, C_{max} thấp hơn và độ thanh thải cao hơn trên mỗi trọng lượng cơ thể so với các dữ liệu được báo cáo ở trẻ em trên 5 tuổi.

Tính tuyến tính/phi tuyến tính:

Sinh khả dụng của gabapentin (tỷ lệ liều hấp thụ) giảm khi tăng liều, điều này tạo ra tính phi tuyến tính đối với các thông số dược động học bao gồm thông số sinh khả dụng (F) ví dụ: Ae%, CL/F, Vd/F. Dược động học đào thải (các thông số dược động học không bao gồm F như CLr và T1/2) được mô tả tốt nhất bằng dược động học tuyến tính. Nồng độ gabapentin trong huyết tương ở trạng thái ổn định có thể dự đoán được từ dữ liệu về liều đơn.

QUY CÁCH ĐÓNG GÓI

Hộp 3 vỉ x 10 viên.

ĐIỀU KIỆN BẢO QUẢN

Bảo quản ở nhiệt độ dưới 30°C.

HẠN DÙNG

24 tháng kể từ ngày sản xuất.

TIÊU CHUẨN CHẤT LƯỢNG CỦA THUỐC

BP 2022

CƠ SỞ SẢN XUẤT

Steril-Gene Life Sciences (P) Ltd.

No. 45, Mangalam Main Road, Mangalam Village, Villianur Commune, Puducherry, 605 110, Ấn Độ.