8. Thuốc nên ghi đúng theo đơn thuốc

CREAO Inj.

(Methylprednisolon natri succinat 53,12 mg
tương đương với 40 mg methylprednisolon)

"Để xa tầm tay trẻ em

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng"

THÀNH PHẦN CÔNG THỨC: 1 lọ/ 1 cc chứa

Thành phần hoạt chất:

Methylprednisolon natri succinat 53,12 mg tương đương với 40 mg methylprednisolon.

Thành phần tá dược: Natri dihydro phosphat khan, disodi hydrophosphat khan, nước cất pha tiêm (bay hơi hết trong thành phẩm).

DẠNG BÀO CHẾ: Bột đông khô pha tiêm

Mô tả : Bột đông khô màu trắng chân trong lọ thủy tinh.

CHỈ ĐỊNH:

Methylprednisolon natri succinate được chỉ định trong các trường hợp sau:

Rối loạn nội tiết :

Suy vỏ thượng thận nguyên phát hoặc thứ phát : có thể kết hợp với mineralcorticoid khi cần thiết

Suy vỏ thượng thận cấp tính : (có thể cần phải bổ sung mineralcorticoid)

Sốc thứ phát do suy vỏ thượng thận hoặc sốc không đáp ứng với liệu pháp điều trị quy ước ở những bệnh nhân đang có suy vỏ thượng thận (khi hoạt tính mineralcorticoid không rõ như mong đợi)

Dùng trước, phẫu thuật, hoặc kho có chấn thương nghiêm trọng hoặc bệnh nặng, ở bệnh nhân đã biết có suy vỏ thượng thận hoặc khi nghi ngờ thiếu hụt dự trữ hormon vỏ thượng thận

Tăng sản tuyến thượng thận bẩm sinh

Viêm tuyến giáp không sinh mủ

Tăng canxi máu liên quan đến ung thư

Rối loạn thấp khớp (điều trị bổ trợ ngắn hạn để kiểm soát giai đoạn cấp tính hoặc đợt kịch phát):

Viêm xương khớp sau chấn thương, Viêm màng hoạt dịch trong viêm xương khớp, Viêm khớp dạng thấp, kể cả viêm khớp dạng thấp ở thiếu niên, Viêm bao hoạt dịch cấp và bán cấp,

Viêm mỏm lồi cầu xương,Viêm bao gân cấp không đặc hiệu,Viêm khớp cấp tính do gout,Viêm khớp vảy nến,Viêm cột sống dính khớp.

Bệnh hệ thống tạo keo và bệnh phức hợp miễn dịch (trong đợt kịch phát hoặc điều trị duy trì trong các trường hợp chọn lọc)

Lupus ban đỏ hệ thống (và viêm thận lupus), Viêm tim cấp do thấp, Viêm da cơ toàn thân (viêm da cơ), Viêm da động mạch nhỏ, Hội chứng Goodpasture.

Bệnh về da :

Bệnh Pemphigus (bệnh bọng nước tự miễn trên da và niêm mạc), Hồng ban đa dạng thể nặng (hội chứng Stevens-Johnson), Viêm da tróc vảy, Vảy nến thể nặng, Viêm da bọng nước dạng Herpes, Viêm da tăng tiết bã nhờn thể nặng, Ủ sẩn dạng nấm.

Tình trạng dị ứng (dùng để kiểm soát các tình trạng dị ứng nặng hoặc khó chữa khi đã thất bại với các cách điều trị thông thường).

Hen phế quản, Viêm da tiếp xúc, Viêm da dị ứng, Bệnh huyết thanh,Viêm mũi dị ứng theo mùa hoặc quanh năm. Các phản ứng quá mẫn với thuốc, Phản ứng máy đay khi truyền thuốc, Phù thanh quản cấp không nhiễm khuẩn.

Các bệnh về mắt (các quá trình viêm và dị ứng mạn tính và cấp tính nghiêm trọng ở mắt)

Nhiễm trùng giác mạc do Herpes zoster, Viêm mống mắt, viêm mống mắt- thể mi, Viêm màng mạch- võng mạc, Viêm màng mạch nhọ khuếch tán phía sau và viêm màng mạch, Viêm thần kinh thị giác, Nhãn viêm giao cảm, Viêm tiền phòng, Viêm kết mạc dị ứng, Viêm loét kết mạc do dị ứng, Viêm giác mạc

Bệnh tiêu hóa (giúp đưa bệnh nhân qua khỏi cơn nguy kịch của bệnh)

Viêm loét đại tràng, Viêm đoạn ruột non.

Bệnh hô hấp

Bệnh sarcoid có triệu chứng, Ngộ độc beryli, Trong lao phổi lan tỏa hoặc bàng phát cấp tính (khi dùng đồng thời hoạt tị liệu kháng lao thích hợp), Hội chứng Loeffler không thể kiểm soát được bằng các phương pháp khác, Viêm phổi hít, Viêm phổi tổ trung bình tới nghiêm trọng do *Pneumocystis Jiroveci* ở bệnh nhân AIDS (như điều trị bổ trợ khi dùng trong 72 giờ đầu tiên của liệu pháp khởi đầu chống *Pneumocystis*). Các đợt kịch phát của bệnh phổi tắc nghẽn mãn tính (COPD).

Rối loạn về máu

Thiểu máu tan máu mắc phải (tự miễn), Xuất huyết giảm tiểu cầu vô căn ở người lớn (chỉ tiêm tĩnh mạch, chống chỉ định tiêm bắp), Giảm tiểu cầu thứ phát ở người lớn, Chứng giảm nguyên hồng cầu (thiểu máu hồng cầu), Thiểu máu giảm sản bẩm sinh (dòng hồng cầu)

Các bệnh ung thư (điều trị tạm thời)

Bệnh bạch cầu và u lymphô ở người lớn, Bệnh bạch cầu cấp ở trẻ em, Để cải thiện chất lượng sống cho bệnh nhân ung thư giai đoạn cuối

Tình trạng phù :

Để giúp bài niệu hoặc giảm protein niệu trong hội chứng thận hư mà không kèm theo nở-huyết thuộc tuyp tự phát hoặc do lupus ban đỏ.

Hỗ chẩn lâm

Phù não tiếp khi u nguyên phát hoặc di căn, hoặc do phẫu thuật hoặc xạ trị, Đợt kịch phát cấp tính của bệnh đa xơ cứng.

Chấn thương tủy sống cấp tính. Cần bắt đầu điều trị trong vòng 8 giờ tiếp khi bắt đầu tổn thương.

Các chỉ định khác :

Lao màng não có tắc nghẽn khoang dưới nhện hoặc đọa tắc khi dùng đồng thời hóa trị liệu kháng lao thích hợp, Bệnh giun xoắn liên quan đến thần kinh, hoặc cơ tim.

Cấy ghép nội tạng, Ngăn ngừa buồn nôn và nôn khi dùng hóa trị liệu chống ung thư.

CÁCH DÙNG, LIỀU DÙNG:

Liều dùng:

Methylprednisolon natri succinat có thể tiêm hoặc truyền tĩnh mạch hoặc tiêm bắp. Phương pháp được ưu tiên lựa chọn cho cấp cứu ban đầu là tiêm tĩnh mạch. Xem bảng 1 về liều lượng khuyến cáo. Có thể giảm liều cho trẻ sơ sinh và trẻ em, nhưng cần chọn lựa chọn dựa vào mức độ nghiêm trọng của bệnh và đáp ứng của bệnh nhân hơn là dựa vào tuổi và thể trọng của bệnh nhân. Liều lượng cho trẻ em không nên thấp hơn 0,5mg/kg mỗi 24 giờ.

Bảng 1 . Liều khuyến cáo đối với Methylprednisolon natri succinat

Chỉ định	Liều dùng
Điều trị bổ trợ cho các trường hợp đe dọa tính mạng	Tiêm tĩnh mạch 30mg/kg trong thời gian ít nhất 30 phút. Có thể nhắc lại liều này 4-6 giờ mỗi lần cho đến 48 giờ
Rối loạn thấp khớp : không đáp ứng với phác đồ điều trị chuẩn (hoặc trong giai đoạn kịch phát)	Tiêm tĩnh mạch trong ít nhất 30 phút. Có thể lặp lại chế độ liều này nếu không có cải thiện sau 1 tuần điều trị, hoặc do tình trạng của bệnh nhân yêu cầu : 1g/1 ngày , trong 1-4 ngày hoặc 1g/ 1 tháng, trong 6 tháng
Lupus ban đỏ hệ thống không áp ứng với phác đồ điều trị chuẩn (hoặc trong giai đoạn kịch phát)	Tiêm tĩnh mạch 1g/ ngày trong 3 ngày , trong ít nhất 30 phút. Có thể lặp lại chế độ liều này nếu không có cải thiện sau 1 tuần điều trị, hoặc do tình trạng của bệnh nhân yêu cầu
Đa xơ cứng không đáp ứng với phác đồ điều trị chuẩn (hoặc trong giai đoạn kịch phát)	Tiêm tĩnh mạch 1g/ ngày, trong 3 hoặc 5 ngày trong thời gian ít nhất 30 phút. Có thể lặp lại chế độ liều này nếu không có cải thiện sau 1 tuần điều trị, hoặc do tình trạng của bệnh nhân yêu cầu
Trang thái phù như viêm cầu thận hoặc viêm thận do lupus không đáp ứng với phác đồ điều trị chuẩn (hoặc trong giai đoạn kịch phát)	Tiêm tĩnh mạch trong thời gian ít nhất 30 phút. Có thể lặp lại chế độ liều này nếu không có cải thiện sau 1 tuần điều trị, hoặc do tình trạng bệnh nhân yêu cầu 30mg/kg cách ngày, dùng trong 4 ngày hoặc 1g/ ngày trong 3,5 hoặc 7 ngày
Ung thư giai đoạn cuối (để cải thiện chất lượng cuộc sống)	Tiêm tĩnh mạch 125mg/ngày trong tối đa 8 tuần.
Ngăn ngừa nôn và buồn nôn do hóa trị liệu về ung thư	***Hóa trị liệu gây nôn nhẹ và trung bình*** Tiêm tĩnh mạch 250mg trong ít nhất 5 phút vào 1 giờ trước khi hóa trị. Nhắc lại liều khi bắt đầu hóa trị và vào lúc ngừng dùng hóa trị. Cũng có thể phối hợp với dẫn xuất clo của phenothiazin khi dùng liều đầu tiên của methylprednisolon để tăng hiệu lực chống nôn ***Hóa trị liệu gây nôn nghiêm trọng*** Tiêm tĩnh mạch 250mg trong ít nhất 5 phút, phối hợp với liều thích hợp metoclopramid hoặc 1-butyrophenon 1 giờ trước hóa trị , sau đó nhắc lại liều methylprednisolon lúc khởi đầu hóa trị và vào lúc ngừng hóa trị.
Tổn thương tủy sống cấp tính	***Điều trị nên bắt đầu trong vòng 8 giờ sau khi tổn thương*** Với bệnh nhân bắt đầu điều trị trong vòng 3 giờ sau khi tổn thương: Tiêm tĩnh mạch 30mg/kg trong thời gian 15 phút rồi nghỉ 45 phút, sau đó truyền tĩnh mạch liên tục với liều 5,4mg/kg/giờ trong 23 giờ Với bệnh nhân khởi đầu điều trị trong vòng 3-8 giờ sau khi tổn thương : tiêm tĩnh mạch 30mg/kg trong thời gian 15 phút rồi nghỉ 45 phút, sau đó truyền tĩnh mạch liên tục với liều 5,4mg/kg/giờ trong 47 giờ Cần dành riêng một đường tĩnh mạch để bơm truyền
Viêm phổi do *Pneumocystis jiroveci* ở bệnh nhân AIDS	***Liệu trình điều trị nên bắt đầu trong vòng 72 giờ trong điều trị khởi đầu chống Pneumocystis*** Một chế độ có thể thực hiện là tiêm tĩnh mạch 40mg , 6-12 giờ mỗi lần cho đến tối đa là 21 ngày hoặc cho đến khi kết thúc quá trình điều trị *Pneumocystis*. Do có tăng tốc độ hoạt hóa lại bệnh lao ở bệnh nhân AIDS, cần suy xét nên sử dụng các thuốc chống lao mỗi khi dùng corticosteroid cho các đối tượng có nguy cơ cao này. Cũng cần theo dõi bệnh nhân về kha năng mắc các nhiễm khuẩn tiềm tàng khác.
Các đợt kịch phát của bệnh phổi tắc nghẽn mãn tính (COPD)	Đã nghiên cứu 2 chế độ liều : Tiêm tĩnh mạch 0,5mg/kg 6 giờ mỗi lần, dùng trong 72 giờ hoặc Tiêm tĩnh mạch 125mg 6 giờ mỗi lần, dùng trong 72 giờ, rồi chuyển sang dạng corticosteroid uống và với liều giảm dần. Tổng thời gian điều trị nên ít nhất là 2 tuần.
Điều trị bổ trợ cho các chỉ định khác	Liều khởi đầu có thể thay đổi từ 10mg đến 500mg tiêm tĩnh mạch, tùy thuộc vào điều kiện lâm sàng. Có thể cần đến liều cao hơn để điều trị ngăn ngừa các trường hợp cấp tính và nghiêm trọng. Các liều khởi đầu lớn tới 250mg cần tiêm tĩnh mạch trong thời gian ít nhất 5 phút, còn nếu dùng liều cao hơn thì tiêm trong thời gian ít nhất là 30 phút. Các liều tiếp theo có thể tiêm bắp hoặc tiêm tĩnh mạch theo các khoảng cách tùy theo đáp ứng của bệnh nhân và theo tình trạng lâm sàng.

Để tránh các vấn đề khi phối hợp thuốc và bảo đảm độ ổn định của thuốc , nên tiêm ở những vị trí riêng biệt với vị trí tiêm các thuốc khác nếu được.

Cách sử dụng:

Natri methylprednisolon succinat dùng để tiêm bắp hoặc tiêm tĩnh mạch.

Thuốc được hòa tan trong 1ml nước cất vô khuẩn, lắc đều cho tan hoàn toàn, dùng để tiêm bắp hay tiêm tĩnh mạch. Tiêm tĩnh mạch chậm trong thời gian từ 1 đến 5 phút.

Chuẩn bị dung dịch truyền tĩnh mạch. Pha loãng dung dịch pha tiêm với dung dịch dextrose 5%, dung dịch natri clorid 0,9%, dung dịch dextrose 5% trong natri clorid 0,9% pha tiêm. Dung dịch sau khi pha nên dùng ngay.

Thuốc này chỉ dùng khi có đơn của bác sỹ

CHỐNG CHỈ ĐỊNH:

Chống chỉ định Methylprednisolon natri succinat trong những trường hợp sau:

- Bệnh nhân có nhiễm nấm toàn thân.
- Bệnh nhân quá mẫn với methylprednisolon natri succinat và các thành phần khác trong chế phẩm.
- Đang theo đường nội tuỷ.
- Đang theo đường ngoài màng cứng.
- Chống chỉ định đứng vắc-xin sống hoặc vắc-xin sống- giảm động lực ở những bệnh nhân đang dùng các liều corticosteroid ức chế miễn dịch.

CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG KHI DÙNG THUỐC

Tác dụng ức chế miễn dịch/ tăng nguy cơ nhiễm khuẩn

Corticosteroid có thể làm tăng nguy cơ nhiễm khuẩn, che lấp một số dấu hiệu nhiễm khuẩn và một số nhiễm khuẩn mới có thể xảy ra khi đang dùng corticosteroid. Có thể có hiện tượng giảm sức đề kháng và mất khả năng khu trú nhiễm khuẩn tại chỗ khi sử dụng corticosteroid. Nhiễm vi sinh vật gây bệnh bao gồm nhiễm virus, vi khuẩn, nấm, đơn bào hoặc giun sán ở bất kỳ vị trí nào của cơ thể có liên quan tới việc sử dụng corticosteroid đứng riêng rẽ hoặc phối hợp với các thuốc ức chế miễn dịch khác mà có tác động tới miễn dịch tế bào hoặc miễn dịch thể dịch hoặc tới chức năng của bạch cầu trung tính. Những nhiễm khuẩn này có thể nhẹ, nhưng cũng có thể nghiêm trọng và có khi gây tử vong. Khi tăng liều corticosteroid, tỷ lệ mắc các biến chứng nhiễm khuẩn cũng tăng lên.

Bệnh nhân đang sử dụng thuốc ức chế miễn dịch dễ bị nhiễm khuẩn hơn những người khỏe mạnh khác. Vì dụ ở trẻ em hay người lớn chưa có miễn dịch đang dùng corticosteroid khi mắc thủy đậu và nếu có thể bị nặng hơn và thậm chí tử vong.

Chống chỉ định đứng vắc-xin sống hoặc vắc-xin sống đã giảm động lực ở bệnh nhân đang dùng các liều corticosteroid ức chế miễn dịch. Có thể dùng vắc-xin chết hoặc vắc-xin bất hoạt cho bệnh nhân đang dùng liều corticosteroid ức chế miễn dịch; tuy nhiên, đáp ứng của bệnh nhân với loại vắc-xin này có thể giảm đi. Có thể chỉ định tiêm chủng cho bệnh nhân đang dùng các liều corticosteroid không gây ức chế miễn dịch.

Sử dụng corticosteroid trong bệnh lao hoạt động cần giới hạn chỉ trong các trường hợp lao phổi lan tỏa hoặc thể bùng phát cấp tính mà trong đó corticosteroid được dùng để kiểm soát bệnh phối hợp với phác đồ kháng lao thích hợp.

Nếu corticosteroid được chỉ định ở người bệnh lao tiềm tàng hoặc phản ứng tuberculin, cần theo dõi chặt chẽ vì bệnh có thể tái phát. Nếu dùng corticosteroid dài ngày, bệnh nhân cần được điều trị dự phòng bằng các thuốc kháng lao.

U Sarcom Kaposi (Kaposi's sarcoma) đã được báo cáo ở những bệnh nhân điều trị bằng corticosteroid. Ngừng sử dụng corticosteroid có thể sẽ thuyên giảm triệu chứng trên lâm sàng.

Vai trò của các corticosteroid trong sốc nhiễm khuẩn vẫn còn đang được tranh luận, các nghiên cứu gần đây cho thấy có cả tác dụng có lợi cũng như các ảnh hưởng bất lợi. Gần đây, việc dùng corticosteroid bổ sung đã cho thấy là có lợi cho bệnh nhân được xác định là sốc nhiễm khuẩn và có suy giảm chức năng tuyến thượng thận. Tuy nhiên, không nên sử dụng thường xuyên liệu pháp này trong sốc nhiễm khuẩn. Một tổng quan hệ thống đã kết luận rằng điều trị các corticosteroid liều cao trong thời gian ngắn không mang lại tác dụng. Tuy nhiên, các phân tích gộp và một tổng quan đã cho thấy sử dụng corticosteroid liều thấp trong khoảng thời gian dài hơn (5-11 ngày) có thể làm giảm tỉ lệ tử vong, nhất là ở bệnh nhân bị sốc nhiễm khuẩn phải dùng thuốc co mạch.

Tác dụng trên hệ miễn dịch

Có thể xảy ra phản ứng dị ứng. Vì một số hiếm các trường hợp dị ứng trên da và phản ứng phản vệ đã xảy ra ở bệnh nhân dùng corticosteroid, nên cần có những biện pháp phòng ngừa thích hợp trước khi dùng corticosteroid, đặc biệt khi bệnh nhân có tiền sử dị ứng với bất kỳ loại thuốc nào.

Tác dụng trên nội tiết

Bệnh nhân đang sử dụng corticosteroid mà phải chịu những căng thẳng bất thường, cần chỉ định dùng corticosteroid tác dụng nhanh với liều cao hơn trước, trong và sau khi bị stress.

Sử dụng corticosteroid ở liều có tác dụng dược lý trong thời gian kéo dài có thể dẫn tới ức chế trục dưới đồi-tuyến yên-thượng thận (HPA) (Suy vỏ thượng thận thứ phát). Mức độ và thời gian suy vỏ thượng thận thứ phát khác nhau giữa các bệnh nhân và phụ thuộc vào liều, tần suất, thời điểm dùng thuốc và khoảng thời gian điều trị bằng glucocorticoid. Có thể giảm liều tác dụng này bằng liệu pháp điều trị cách nhật.

Ngoài ra, suy vỏ thượng thận cấp còn dẫn đến tử vong nếu dùng glucocorticoid đột ngột.

Do đó, có thể giảm liều nguy cơ suy vỏ thượng thận thứ phát do thuốc bằng cách giảm liều từ từ. Kiểu suy vỏ thượng thận này có thể tồn tại nhiều tháng sau khi ngưng điều trị, do đó trong thời gian này, nếu xảy ra bất kỳ trường hợp tress nào, nên bắt đầu sử dụng lại liệu pháp hormon.

"Hội chứng cai thuốc" steroid, không liên quan đến tình trạng suy vỏ thượng thận, có thể gặp sau khi ngừng đột ngột glucocorticoid. Hội chứng này gồm các triệu chứng như: chán ăn, buồn nôn, nôn, bồn mệt, đau đầu, sốt, đau khớp, bong da, đau cơ, giảm cân và/hoặc hạ huyết áp. Những ảnh hưởng này được cho là do thay đổi đột ngột nồng độ glucocorticoid hơn là do nồng độ corticosteroid thấp.

Vì glucocorticoid có thể gây ra hoặc làm nặng thêm hội chứng Cushing, nên tránh sử dụng glucocorticoid trên những bệnh nhân Cushing.

- Tác dụng của corticosteroid tăng lên trên những bệnh nhân thiểu năng tuyến giáp.

Tác dụng trên chuyển hóa và dinh dưỡng

Các corticosteroid, bao gồm methylprednisolon, có thể làm tăng đường huyết, làm nặng hơn tình trạng tiểu đường sẵn có, và có thể dẫn đến tiểu đường trên những đối tượng sử dụng corticosteroid kéo dài.

Tác dụng trên tâm thần

Các xáo trộn về tâm thần có thể xuất hiện khi dùng corticosteroid, từ sáng khoái, mất ngủ, thay đổi tâm trạng, tính khí thất thường và trầm cảm nặng cho đến những biểu hiện tâm thần thật sự. Ngoài ra, sự bất ổn cảm xúc hoặc khuynh hướng tâm thần có thể nặng hơn do corticosteroid.

Khả năng gặp các tác dụng không mong muốn nghiêm trọng về tâm thần có thể xảy ra khi dùng steroid theo đường toàn thân. Các triệu chứng thường xuất hiện trong một vài ngày hoặc vài tuần từ khi bắt đầu điều trị. Hầu hết các triệu chứng mất đi sau khi giảm hoặc ngừng corticosteroid, mặc dù có thể cần phải điều trị đặc biệt. Các tác dụng về tâm thần đã được báo cáo khi ngừng corticosteroid, tuy nhiên chưa biết tần suất. Bệnh nhân/ người chăm sóc nên lưu ý nếu các triệu chứng tâm thần tiền triển ở bệnh nhân, đặc biệt nếu nghi ngờ bệnh nhân bị trầm cảm hay có ý định tự tử. Bệnh nhân/ người chăm sóc nên được cảnh báo về những rối loạn tâm thần có thể xuất hiện trong khi điều trị hoặc ngay sau khi giảm liều/ ngừng dùng steroid toàn thân.

Tác dụng trên hệ thần kinh

Nên thận trọng khi dùng corticosteroid trên những bệnh nhân động kinh.

Nên thận trọng khi dùng corticosteroid trên những bệnh nhân nhược cơ nặng (xem thêm về bệnh cơ trong phần **Tác dụng trên hệ cơ xương**).

Mặc dù các thử nghiệm lâm sàng có đối chứng đã cho thấy corticosteroid có tác dụng giảm nhanh mức độ trầm trọng cấp tính trong đợt cấp của bệnh đa xơ cứng, nhưng những thử nghiệm đó không chứng tỏ được rằng corticosteroid có ảnh hưởng sau đến kết quả điều trị cuối cùng hoặc diễn biến tự nhiên của bệnh. Các nghiên cứu cho thấy rằng cấu đăng liều corticosteroid tương đối cao mới có tác dụng đáng kể.

Các biến cố y khoa nghiêm trọng đã được báo cáo có liên quan đến đường dùng bột tiêm ngoài màng cứng (xem phần 4.8 Tác dụng không mong muốn).

Đã có báo cáo về hiện tượng tích mỡ ngoài màng cứng ở những bệnh nhân dùng corticosteroid, điển hình là khi sử dụng liều cao kéo dài.

Tác dụng trên mắt

Cần cẩn thận trọng corticosteroid ở bệnh nhân nhiễm Herpes simplex ở mắt vì có thể gây thủng giác mạc.

Dùng corticosteroid kéo dài có thể làm đục thủy tinh thể dưới bao sau và đục thủy tinh thể ở trung tâm (đặc biệt ở trẻ em), lồi mắt hoặc tăng áp lực nội nhãn, có thể dẫn đến bệnh tăng nhãn áp đi kèm tổn thương thần kinh thị giác. Có thể tăng nguy cơ nhiễm nấm và virus thứ phát trên mắt ở bệnh nhân dùng glucocorticoid.

Liệu pháp corticosteroid đã từng được xác định có liên quan đến bệnh bác võng mạc trung tâm thanh dịch, một chứng bệnh có thể dẫn đến bong võng mạc.

Tác dụng trên tim

Tác dụng không mong muốn của glucocorticoid trên hệ tim mạch, như rối loạn lipid máu và tăng huyết áp, có thể khiến các bệnh nhân đã có sẵn nguy cơ về tim mạch phải chịu thêm các ảnh hưởng tim mạch khác, nếu dùng liều cao và kéo dài. Vì vậy, corticosteroid nên được dùng thận trọng ở những bệnh nhân này, cần theo dõi sự thay đổi của các yếu tố nguy cơ và theo dõi chức năng tim thêm nếu cần thiết. Các biến chứng trong điều trị bằng corticosteroid có thể giảm khi sử dụng liệu pháp điều trị cách nhật và dùng liều thấp.

Sau khi tiêm nhanh các liều cao methylprednisolon natri succinat (hơn 0,5gam trong thời gian dưới 10 phút), đã có báo cáo về rối loạn nhịp tim và/ hoặc trụy mạch và/ hoặc ngừng tim. Chậm nhịp tim đã được báo cáo trong hoặc sau khi dùng liều cao methylprednisolon natri succinat, và có thể không liên quan tới tốc độ và thời gian tiêm truyền.

- Nên thận trọng khi dùng các corticosteroid toàn thân, và chỉ dùng khi thực sự cần thiết, trong trường hợp suy tim sung huyết.

Tác dụng trên mạch

- Huyết khối, bao gồm thuyên tắc huyết khối tĩnh mạch, đã được báo cáo xảy ra khi dùng corticosteroid. Do đó, corticosteroid cần được sử dụng thận trọng ở bệnh nhân đang bị hoặc có thể có nguy cơ bị các rối loạn về huyết khối.
- Cần dùng thận trọng corticosteroid ở những bệnh nhân cao huyết áp.

Tác dụng lên ống tiêu hóa

- Liều cao corticosteroid có thể gây viêm tụy cấp.
- Không có quan điểm thống nhất nào về việc chỉnh corticosteroid gây nên tình trạng loét đường tiêu hóa trong quá trình điều trị hay không. Tuy nhiên, dùng glucocorticoid có thể che lấp những triệu chứng của loét đường tiêu hóa, gây nên tình trạng thủng hoặc xuất huyết tiêu hóa mà không kèm đau đớn rõ rệt. Nguy cơ bị loét đường tiêu hóa tăng lên khi kết hợp với các thuốc chống viêm không steroid (NSAID).

Thận trọng khi dùng corticosteroid trong viêm loét đại tràng không đặc hiệu nếu dọa thủng, áp xe hay nhiễm khuẩn sinh mủ khác, viêm túi thừa, có chỗ nối ruột non mới, đang bị hay có tiền sử bị loét đường tiêu hóa.

Tác dụng lên gan mật

Tổn thương gan do thuốc, như viêm gan cấp tính, có thể xảy do truyền methylprednisolon qua đường tĩnh mạch theo chu kỳ (thường với liều 1g/ ngày). Thời gian phát bệnh viêm gan cấp tính có thể là nhiều tuần hoặc lâu hơn. Đã quan sát thấy các biến cố này biến mất sau khi ngưng điều trị.

Tác dụng trên hệ cơ xương

Đã có báo cáo về bệnh cơ cấp tính khi sử dụng corticosteroid liều cao, thường xảy ra ở bệnh nhân bị các rối loạn dẫn truyền thần kinh cơ (ví dụ nhược cơ nặng) hay trên bệnh nhân đang dùng các thuốc kháng cholinergic như thuốc ức chế thần kinh cơ (ví dụ pancuronium). Bệnh cơ cấp tính này lan rộng, có thể liên quan đến các cơ mắt, cơ hô hấp và có thể dẫn tới liệt chi. Tình trạng tăng creatinin kinase có thể xảy ra. Để có tiên triển về mặt lâm sàng hay hồi phục, cần dừng thuốc trong vòng vài tuần đến vài năm.

Loãng xương là tác dụng không mong muốn phổ biến, nhưng ít được phát hiện khi dùng glucocorticoid liều cao và kéo dài.

Rối loạn hệ tiết niệu

- Nên thận trọng khi dùng corticosteroid trên những bệnh nhân suy thận.
- Nghiên cứu
- Liều trung bình hoặc cao của hydrocortison hoặc cortison có thể gây tăng huyết áp, giữ muối và nước tăng thải trừ kali. Những tác dụng này ít gặp hơn với các dẫn xuất tổng hợp tới khi dùng liều cao. Chế độ ăn hạn chế muối và bổ sung kali có thể cần thiết. Tất cả các corticosteroid đều làm tăng thải trừ calci.

Chấn thương, ngộ độc và các biến chứng phẫu thuật

- Corticosteroid dùng toàn thân không được chỉ định, và do đó không nên dùng để điều trị chấn thương sọ não. Một nghiên cứu đa trung tâm cho thấy tăng tỷ lệ tử vong tại thời điểm 2 tuần và 6 tháng sau chấn thương ở những bệnh nhân dùng methylprednisolon natri succinat so với bệnh nhân dùng giả dược. Mối quan hệ nhân quả với việc điều trị bằng methylprednisolon natri succinat chưa được thiết lập.

Cảnh báo khác

- Do các biến chứng khi dùng glucocorticoid phụ thuộc vào liều lượng và thời gian điều trị, cần cân nhắc lợi ích/ nguy cơ trên từng bệnh nhân về liều lượng và thời gian điều trị theo liều hàng ngày hay dùng cách nhật.
- Nên dùng liều thấp nhất có hiệu quả của corticosteroid để kiểm soát tình hình điều trị và khi có thể giảm liều nên giảm từ từ.
- Cần thận trọng khi sử dụng aspirin và các thuốc chống viêm không steroid phối hợp với corticosteroid.
- Bệnh u tế bào ưa crôm có thể gây tử vong đã được báo cáo sau khi sử dụng corticosteroid toàn thân. Với bệnh nhân nghi ngờ hoặc đã xác định là mắc bệnh u tế bào ưa crôm, chỉ nên sử dụng corticosteroid sau khi đã tiến hành đánh giá lợi ích/ nguy cơ phù hợp.

Dùng ở trẻ em

Cần theo dõi chặt chẽ sự tăng trưởng và phát triển của trẻ sơ sinh và trẻ em sử dụng corticosteroid kéo dài. Chậm tăng trưởng có thể gặp trên trẻ em sử dụng glucocorticoid kéo dài, hàng ngày, với liều chia nhỏ và việc sử dụng liệu pháp này nên hạn chế. Chỉ nên dùng với các chỉ định khẩn cấp nhất. Liệu pháp glucocorticoid dùng cách nhật có thể tránh và giảm thiểu tác dụng không mong muốn này.

Trẻ sơ sinh và trẻ em sử dụng corticosteroid kéo dài có nguy cơ đặc biệt về tăng áp lực nội sọ.

Liều cao corticosteroid có thể gây viêm tụy ở trẻ em.

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

- Thời kỳ mang thai: Dùng kéo dài corticosteroid toàn thân cho người mẹ đang mang thai có thể dẫn đến giảm nhẹ thể trọng của trẻ sơ sinh, có thể gây đục thủy tinh thể ở trẻ sơ sinh. Nói chung, sử dụng corticosteroid ở người mang thai chưa được nghiên cứu đầy đủ, nên đã hỏi phải cân nhắc lợi ích có thể đạt được so với những rủi ro có thể xảy ra với mẹ và con khi dùng thuốc.
- Thời kỳ cho con bú: Corticosteroid bài tiết được qua sữa mẹ nên có thể gây ức chế tăng trưởng và ảnh hưởng đến việc sản xuất glucocorticoid nội sinh ở trẻ sơ sinh bú mẹ. Nên cân nhắc lợi ích có thể đạt được so với những rủi ro có thể xảy ra với mẹ và con khi sử dụng.

ẢNH HƯỞNG CỦA THUỐC ĐẾN KHẢ NĂNG LÁI XE VÀ VẬN HÀNH MÁY MÓC: Một số tác dụng không mong muốn liên thần kinh trung ương (như chóng mặt, nhức đầu, ảo giác, thần kinh dễ bị kích động) có thể làm giảm sự tập trung và khả năng phản ứng, do đó không nên lái xe hoặc vận hành máy móc khi đang dùng thuốc.

TƯƠNG TÁC, TƯƠNG KỴ CỦA THUỐC:

Methylprednisolon là cơ chất của enzym cytochrom P450 (CYP) và chủ yếu được chuyển hóa bởi enzym CYP3A4. CYP3A4 là enzym chính của hầu hết các phản ứng CYP trong gan của người trưởng thành. Nó xúc tác cho quá trình 6β - hydroxyl hóa steroid, giai đoạn 1 thiết yếu trong quá trình chuyển hóa cho cả corticosteroid nội sinh và tổng hợp. Cũng có rất nhiều chất khác cũng là cơ chất của CYP3A4, một số chất này (cũng như các thuốc khác) làm thay đổi sự chuyển hóa glucocorticoid bằng cách gây cảm ứng (điều hòa tăng) hoặc ức chế enzym CYP3A4.

Các chất ức chế CYP3A4 - Những thuốc ức chế hoạt tính CYP3A4 nhìn chung làm giảm độ thanh thải của gan và tăng nồng độ của các thuốc là cơ chất của CYP3A4 như methylprednisolon trong huyết tương. Nếu có các chất ức chế CYP3A4, nên chuẩn liều methylprednisolon để tránh bị ngộ độc steroid.

Các chất cảm ứng CYP3A4 - Những thuốc gây cảm ứng CYP3A4 nhìn chung làm tăng độ thanh thải của gan, dẫn tới làm giảm nồng độ các thuốc là cơ chất của CYP3A4. Có thể cần phải tăng liều methylprednisolon khi dùng các thuốc này để đạt được kết quả điều trị như mong muốn.

Các chất là cơ chất của CYP3A4 - Khi có mặt một cơ chất khác CYP3A4, quá trình thanh thải qua gan của methylprednisolon có thể bị ảnh hưởng, do đó cần điều chỉnh liều tương ứng liều dùng của methylprednisolon. Có thể các tác dụng không mong muốn khi dùng riêng mỗi thuốc sẽ dễ xảy ra với methylprednisolon được trình bày trong bảng 2.

Bảng 2: Những tương tác/ ảnh hưởng quan trọng của các thuốc hoặc hoạt chất với methylprednisolon.

Phân loại thuốc – Thuốc hoặc hoạt chất	Tương tác/ Ảnh hưởng
Kháng sinh -ISONIAZID	Chất ức chế CYP3A4. Ngoài ra, methylprednisolon có khả năng tốc độ acetyl hóa và độ thanh thải của isoniazid
Kháng sinh, Thuốc kháng lao -RIFAMPIN	Chất cảm ứng CYP3A4
Thuốc chống đông (dạng uống)	Tác dụng của methylprednisolon trên thuốc chống đông đường uống có thể thay đổi tùy trường hợp. Đã có nhiều bản báo về việc tăng cũng như giảm tác dụng của thuốc chống đông khi dùng chung với corticosteroid. Chính vì vậy, phải kiểm tra các chỉ số đông máu để duy trì tác dụng chống đông mong muốn.
Thuốc chống co giật -CARBAMAZEPIN	Chất cảm ứng CYP3A4 (và là cơ chất)
Thuốc chống co giật - PHENOBARBITAL - PHENYTOIN	Chất cảm ứng CYP3A4
Thuốc kháng cholinergic - CHẸN THẦN KINH CƠ	Các corticosteroid có thể làm ảnh hưởng đến tác dụng của các thuốc kháng cholinergic. 1. Đã có báo cáo về bệnh cơ cấp tính khi sử dụng liều cao các corticosteroid đồng thời với các thuốc kháng cholinergic, như là các thuốc chẹn thần kinh cơ (Xem phần **Cảnh báo và thận trọng đặc biệt khi sử dụng**. Hệ cơ xương để có thêm thông tin). 2. Đã có báo cáo về tính đối kháng trên tác dụng ức chế thần kinh cơ của pancuronium và vecuronium trên bệnh nhân dùng corticosteroid. Tương tác này xảy ra với tất cả chất chẹn thần kinh cơ có tính cạnh tranh.
Thuốc kháng cholinesterase	Các steroid có thể làm giảm tác dụng của các thuốc kháng cholinesterase dùng trong điều trị bệnh nhược cơ.
Thuốc điều trị tiểu đường	Vì corticosteroid có thể làm giảm nồng độ glucose máu nên có thể phải điều chỉnh liều dùng của thuốc điều trị tiểu đường
Thuốc chống nôn - APREPITATANT - FOSAPREPITANT	Chất ức chế CYP3A4 (và là cơ chất)
Thuốc kháng nấm - ITRACONAZOL - KETOCONAZOL	Chất ức chế CYP3A4 (và là cơ chất)
Thuốc kháng virus - Các thuốc ức chế HIV Protease	Chất ức chế CYP3A4 (và là cơ chất) 1. Các chất ức chế protease như Indinavir và ritonavir có thể làm tăng nồng độ corticosteroid trong huyết tương. 2. Corticosteroid có thể cảm ứng quá trình chuyển hóa của các thuốc ức chế HIV protease dẫn đến giảm nồng độ của các thuốc này trong huyết tương.
Thuốc ức chế Aromatase - AMINOGLUTETHIMID	Aminoglutethimid gây ức chế tuyến thượng thận, có thể làm trầm trọng thêm các thay đổi về nội tiết do dùng glucocorticoid kéo dài.
Thuốc chẹn kênh Calci - DILTIAZEM	Chất ức chế CYP3A4 (và là cơ chất)
Thuốc tránh thai (dạng uống) - ETHINYLESTRADIOL/ NORETHINDRON	Chất ức chế CYP3A4 (và là cơ chất)
Nước ép bưởi	Chất ức chế CYP3A4
Thuốc ức chế miễn dịch - CYCLOSPORIN	Chất ức chế CYP3A4 (và là cơ chất) 1. Khi dùng đồng thời Cyclosporin với methylprednisolon thì xuất hiện sự ức chế chuyển hóa lẫn nhau, và có thể làm tăng nồng độ trong huyết tương của 1 trong 2 thuốc hoặc cả 2 thuốc; vì vậy, các tác dụng không mong muốn khi dùng riêng mỗi thuốc có thể sẽ dễ xảy ra hơn khi dùng đồng thời. 2. Đã có báo cáo về hiện tượng co giật khi dùng đồng thời methylprednisolon và cyclosporin.
Thuốc kháng sinh họ macrolid - TROLEANDOMYCIN	Chất ức chế CYP3A4
NSAID (Thuốc chống viêm không steroid) - ASPIRIN (acid acetylsalicylic) liều cao	1. Tỷ lệ xuất huyết và loét đường tiêu hóa có thể tăng khi dùng methylprednisolon cùng với các thuốc NSAID. 2. Methylprednisolon có thể làm tăng độ thanh thải của aspirin liều cao, có thể dẫn đến giảm nồng độ salicylat trong huyết thanh. Dừng điều trị bằng methylprednisolon có thể dẫn đến tăng lượng salicylat trong huyết thanh, điều này có thể dẫn đến tăng nguy cơ ngộ độc salycilat
Các thuốc làm tăng thải kali	Khi dùng corticosteroid cùng với các thuốc làm tăng thải kali (ví dụ thuốc lợi tiểu), nên theo dõi chặt chẽ hiện tượng hạ kali máu ở bệnh nhân. Việc dùng chung corticosteroid với amphotericin B, các xanthinin hay thuốc chẹn beta 2 cũng làm tăng nguy cơ hạ kali máu

Tương kỵ

Để tránh vấn đề khi phối hợp thuốc và bảo đảm tính ổn định của thuốc, methylprednisolon natri succinat được khuyến cáo nên dùng đường tĩnh mạch riêng rẽ với các thuốc hoặc các chất khác dùng đường tĩnh mạch. Các thuốc không tương hợp về mặt vật lý với methylprednisolon natri succinat trong dung dịch bao gồm, nhưng không giới hạn ở: allopurinol natri, doxapram hydrochlorid, tigecyclin, diltiazem hydrochlorid, calci gluconat, vecuronium bromide, rocuronium bromid, cisatracurium besylat, glycopyrrolat, profofol.

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN CỦA THUỐC:

Tác dụng không mong muốn và tần số được liệt kê trong mỗi hệ cơ quan

Phân loại theo hệ cơ quan	Tác dụng không mong muốn	Tần suất (%)
Nhiễm trùng và nhiễm ký sinh trùng	Nhiễm trùng, nhiễm trùng cơ hội, Viêm phúc mạc	Không rõ
Rối loạn máu và hệ bạch huyết	Tăng bạch cầu	Không rõ
Rối loạn hệ miễn dịch	Phản ứng quá mẫn với thuốc, sốc phản vệ, phản ứng dạng phản vệ	Không rõ
Rối loạn nội tiết tố	Hội chứng dạng Cushing, suy tuyến yên, hội chứng ngừng thuốc steroid	Không rõ
Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng	Nhiễm toan chuyển hóa, Ứ natri, Ứ dịch, Giảm kiềm chuyển hóa do hạ kali máu, giảm dung nạp glucose, tăng nhu cầu insulin (hoặc các thuốc hạ đường huyết đường uống ở bệnh nhân đái tháo đường), chứng tích mỡ, tăng cảm giác thèm ăn (có thể dẫn đến tăng cân)	Không rõ
Rối loạn tâm thần	- Rối loạn cảm xúc (tâm trạng trầm uất, phấn khích, cảm xúc không ổn định phụ thuộc thuốc, ảo ý định tự tử) - Rối loạn tâm thần (bao gồm hưng cảm, hoang tưởng, ảo giác, và tâm thần phân liệt) - Thay đổi tính cách, lũ lẫn, lo âu, tính khí thất thường, hành vi thất thường, mất ngủ, khó chịu	Không rõ
Rối loạn hệ thần kinh	Tích mỡ ngoài màng cứng, tăng áp lực nội sọ (kèm phù gai), động kinh, hay quên, rối loạn nhận thức, chóng mặt , đau đầu	Không rõ
Rối loạn ở mắt	Hắc võng mạc, đục thủy tinh thể, tăng nhãn áp, lồi mắt	Không rõ
Rối loạn ở tai	Chóng mặt	Không rõ
Rối loạn tim	Suy tim sung huyết , loạn nhịp tim	Không rõ
Rối loạn mạch	Huyết khối, Cao huyết áp, hạ huyết áp	Không rõ
Rối loạn hô hấp, ngực và trung thất	Thuyên tắc phổi, nấc cụt	Không rõ
Rối loạn tiêu hóa	Loét đường tiêu hóa (có thể dẫn đến xuất huyết hoặc thủng đường tiêu hóa), viêm tụy, viêm thực quản gây loét, chướng bụng, đau bụng, tiêu chảy, khó tiêu, buồn nôn	Không rõ
Rối loạn gan mật	Viêm gan	Không rõ
Rối loạn da và các mô dưới da	Phù mạch, rậm lông, đốm xuất huyết, bầm máu, teo da, sung huyết, tăng tiết mồ hôi, da nổi vân, phát ban, ngứa, mày đay, mụn, giảm sắc tố da	Không rõ
Rối loạn cơ xương và các mô liên kết	Yếu cơ, đau cơ, teo cơ, loãng xương, hoại tử xương , gãy xương bệnh lý, bệnh khớp do thần kinh, đau khớp, chậm tăng trưởng	Không rõ
Rối loạn hệ sinh sản và vú	Kinh nguyệt không đều	Không rõ
Rối loạn chung và rối loạn tại chỗ dùng thuốc	Chậm lành vết thương, phù ngoại biên, mệt mỏi, khó chịu, phản ứng tại chỗ tiêm	Không rõ
Các chỉ số xét nghiệm	Tăng nhãn áp, giảm dung nạp carbohydrat, giảm kali máu, tăng canxi trong nước tiểu, tăng alanine aminotransferase, Tăng aspartate aminotransferase, tăng phosphatase kiềm trong máu, tăng urê máu, giảm phản ứng với các xét nghiệm trên da,	Không rõ
Các biến chứng do thủ thuật, chấn thương và ngộ độc	Gãy xương cột sống do chèn ép, đứt gân	Không rõ

Các tác dụng không mong muốn được đây đã được báo cáo với các đường dùng bị chống chỉ định sau : nội tủy ngoài màng cứng - Viêm màng nhện, rối loạn chức năng đường tiêu hóa, rối loạn chức năng bàng quang, đau đầu, viêm màng não, liệt nhẹ hay chi dưới, liệt hai chân, động kinh, rối loạn cảm giác. Không rõ tần suất xuất hiện các các tác dụng này.

Thông báo cho bác sĩ những tác dụng không mong muốn gặp phải khi sử dụng thuốc.

QUÁ LIỀU & CÁCH XỬ TRÍ:

Những triệu chứng quá liều gồm biểu hiện hội chứng Cushing (toàn thân), yếu cơ (toàn thân), và loãng xương (toàn thân), tất cả chỉ xảy ra khi sử dụng glucocorticoid dài hạn.

Khi sử dụng liều quá cao trong thời gian dài, tăng năng vỏ tuyến thượng thận và ức chế tuyến thượng thận có thể xảy ra. Trong những trường hợp này cần cân nhắc để có quyết định đúng đắn tạm ngừng hoặc ngừng hẳn việc dùng glucocorticoid.

Trong trường hợp quá liều, không có thuốc giải độc đặc hiệu mà chỉ điều trị hỗ trợ và điều trị triệu chứng. Methylprednisolon có thể thẩm tách được.

DẠC TÍNH DƯỢC LỰC HỌC:

Nhóm dược lý: Glucocorticoids, mã ATC H02AB04

Methylprednisolon là một glucocorticoid, dẫn xuất 6 - alpha - methyl của prednisolon, có tác dụng chống viêm, chống dị ứng và ức chế miễn dịch rõ rệt. Do methyl hóa prednisolon, tác dụng corticoid chuyển hóa muối đã được loại trừ, vì vậy có rất ít nguy cơ giữ Na+, và gây phù. Tác dụng chống viêm của methylprednisolon tăng 20% so với tác dụng của prednisolon, 4 mg methylprednisolon có hiệu lực bằng 20 mg hydrocortison.

Chống viêm, bất kỳ thuốc bệnh căn nào đều được đặc trưng bởi sự thoát mạch và thâm nhiễm các bạch cầu vô mô (vị tuỷ) bị viêm. Các glucocorticoid ức chế các hiện tượng này. Glucocorticoid cũng đường toàn thân làm tăng số lượng các bạch cầu trung tính và giảm số lượng các tế bào lympho, bạch cầu ưa eosin, bạch cầu đơn nhân trong máu ngoại biên. Bạch cầu trung tính bằng là (và ở) tăng hay động các bạch cầu trung tính bị dự trữ ở tủy xương ra, do làm đổi của chúng trong máu lưu thông được kéo dài và do sự thoát mạch và thâm nhiễm vào vị trí viêm bị giảm đi. Cơ lẽ nguyên nhân cuối cùng này là một trong những cơ chế định yếu tác dụng chống viêm của glucocorticoid.

Glucocorticoid còn ức chế chức năng của các tế bào lympho và của các đại thực bào của mô. Khả năng đáp ứng của chúng với các không nguyên và các chất gây giản phóng bị giảm. Tác dụng của glucocorticoid lớn các đại thực bào đặc biệt rõ rệt, làm hạn chế khả năng thực bào của chúng, hạn chế khả năng diệt vi sinh vật và hạn chế việc sản sinh interferon - gamma, interleukin - 1, chất gây sốt, các enzym collagenase và elastase, yếu tố gây hoại tử chỗ sưng và chất hoạt hóa plasminogen. Glucocorticoid tác dụng lên tế bào lympho làm giảm sản sinh interleukin - 2.

Ngoài tác dụng trên chức năng của bạch cầu, glucocorticoid còn tác động đến phản ứng viêm bằng cách làm giảm tổng hợp prostaglandin do hoạt hóa phospholipase A2. Glucocorticoid làm tăng nồng độ một số phospholipid màng có tác dụng ức chế sự tổng hợp prostaglandin. Corticosteroid cũng làm tăng nồng độ lipocortin, là protein gây giảm tính khả dụng của phospholipid, có chất của phospholipase A2. Cuối cùng, glucocorticoid làm giảm sự xuất hiện cyclooxygenase ở những tế bào viêm, do đó làm giảm lượng enzym để sản sinh prostaglandin.

Glucocorticoid làm giảm tính thấm mao mạch do ức chế hoạt tính của kinin và các nội độc tố vi khuẩn và do làm giảm lượng histamin giải phóng bởi bạch cầu ưa base.

Natri methylprednisolon succinat chuyển hóa và tác dụng chống viêm giống methylprednisolon. Có tác dụng chống viêm mạnh hơn prednisolon, ít tác dụng phụ về giữ muối, nước hơn.

DẠC TÍNH DƯỢC ĐỘNG HỌC

Hấp thu

Thuốc dùng qua đường tiêm bắp thu nhanh. Sau khi tiêm bắp 40 mg methylprednisolon natri succinat cho 14 nam giới trưởng thành tình nguyện khỏe mạnh, nồng độ đỉnh trung bình 454 nanogam/mL đạt được sau 1 giờ. Đến giờ thứ 12, thấy nồng độ methylprednisolon trong huyết tương giảm xuống 31,9 nanogam/mL. Sau khi tiêm 18 giờ, không còn tìm thấy methylprednisolon. Dựa vào AUC, chỉ thị của tổng lượng thuốc được hấp thu, thì tiêm bắp methylprednisolon natri succinat tương đương với cũng liều tiêm tĩnh mạch.

Những kết quả của nghiên cứu đã chứng minh rằng natri succinat ester của methylprednisolon đã chuyển nhanh và mạnh sang phần methylprednisolon có hoạt tính sau khi dùng theo mọi đường dùng. Mức độ hấp thu của phần methylprednisolon tự do sau khi tiêm tĩnh mạch và tiêm bắp là tương đương và lớn hơn rõ rệt so với mức độ hấp thu sau khi uống dung dịch và uống viên nén methylprednisolon. Vì rằng lượng methylprednisolon được hấp thu sau khi tiêm bắp và tiêm tĩnh mạch là tương đương, mặc dù có lượng lớn hơn của ester hemisuccinat đã vào được tuần hoàn chung sau khi tiêm tĩnh mạch, có thể rằng ester đã được chuyển trong mô sau khi tiêm bắp với sự hấp thu sau đó dưới dạng methylprednisolon tự do.

Phân bố

Methylprednisolon được phân bố rộng khắp các mô, qua hàng rào máu não, và bài tiết qua sữa mẹ. Thể tích phân bố biểu kiến khoảng 1,4 L/kg. Khả năng gắn protein huyết tương của methylprednisolon ở người khoảng 77%.

Chuyển hóa

Methylprednisolon liên kết với protein huyết tương, chủ yếu là globulin, mặt ít với albumin, chỉ corticosteroid không liên kết có tác dụng được lý hoặc được chuyển hóa. Quá trình chuyển hóa chủ yếu ở gan bởi CYP3A4 và ít hơn ở thận. Ở người, methylprednisolon được chuyển hóa ở gan thành các chất chuyển hóa không hoạt động, chủ yếu thành 20α-hydroxymethylprednisolon và 20β-hydroxymethylprednisolon.

Methylprednisolon, cũng như nhiều cơ chất của CYP3A4, cũng có thể là một cơ chất của protein p-glycoprotein vận chuyển hình hộp gắn ATP, ảnh hưởng đến sự phân bố ở mô và tương tác với các thuốc khác.

Thải trừ

Các chất chuyển hóa được bài tiết trong nước tiểu.

Thời gian bán thải xấp xỉ 3 giờ. Độ thanh thải khoảng 5-6 ml / phút / kg.

Không cần hiệu chỉnh liều là ở người suy thận. Methylprednisolon có thể thẩm tách lọc máu được.

Quy cách đóng gói: Hộp 10 lọ.

Điều kiện bảo quản: Bảo quản trong bao bì kín, tránh ánh sáng và ẩm, nhiệt độ dưới 30°C

Hạn dùng: 36 tháng kể từ ngày sản xuất. Dung dịch sau khi pha nên dùng ngay.

Tiêu chuẩn chất lượng: USP

Số giấy đăng kí lưu hành: VN- 21439-18

Tên, địa chỉ cơ sở sản xuất:

BCWORLD PHARM CO., LTD.

872-23, Yeojusam-ro, Gunam-eup, Yeoju-si, Gyeonggi-do, Hàn Quốc