

ข้อมูลยาสำหรับบุคลากรทางการแพทย์
ยาเบทาเมทาโซนวาเลอเรต ความแรงร้อยละ 0.1
ชนิดยาทาขี้ผึ้ง

1. ชื่อผลิตภัณฑ์ (Name of the Medicinal Product)

กรณีเอกสารกำกับยาภาษาไทย

<ชื่อการค้าภาษาไทย> ความแรงร้อยละ 0.1 ชนิดยาทาขี้ผึ้ง

กรณีเอกสารกำกับยาภาษาอังกฤษ

<ชื่อการค้าภาษาอังกฤษ> 0.1% topical ointment

2. ส่วนประกอบและปริมาณตัวยาสําคัญ (Qualitative and Quantitative Composition)

ยาเบทาเมทาโซนวาเลอเรต ชนิดยาทาขี้ผึ้ง ความแรงร้อยละ 0.1 หมายถึง ในยา 100 กรัม ประกอบด้วย ยาเบทาเมทาโซนวาเลอเรต 0.1 กรัม

3. ลักษณะและรูปแบบยาทางเภสัชกรรม (Pharmaceutical Form)

<รูปแบบยา> <ลักษณะภายนอกที่เห็นได้ด้วยตาเปล่า> <ข้อมูลบริษัทยา>

4. ข้อบ่งใช้ทางคลินิก (Clinical Particulars)

4.1 ข้อบ่งใช้ (Therapeutic Indication)

ข้อบ่งใช้มาตรฐานของยาเบทาเมทาโซนวาเลอเรตชนิดขี้ผึ้ง

ใช้ในการรักษาโรคผิวหนังอักเสบและอาการคันระดับปานกลางถึงรุนแรงหลายชนิดโดยมีตัวอย่างของข้อบ่งใช้หลักดังนี้

- ผิวหนังอักเสบ (eczema) ซึ่งรวมถึง ผิวหนังอักเสบเหตุภูมิแพ้ (atopic eczema)
- Seborrheic dermatitis
- ผิวหนังอักเสบจากการสัมผัส (contact dermatitis)
- อาการผมร่วงเป็นหย่อม (alopecia areata)
- แผลเป็น แผลนูน คีลอยด์ (keloids)
- ไลเคนแพลนัส (lichen planus), lichen simplex chronicus
- Discoid lupus erythematosus แบบกึ่งเฉียบพลันและแบบเรื้อรัง
- โรคสะเก็ดเงิน (psoriasis)
- อาการไหม้แดด (sunburn)

4.2 ขนาดยาและวิธีการใช้ยา (Posology and method of administration)

4.2.1 ขนาดยาที่แนะนำ (Recommended dose)

ยาทาซี้ผึ้งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตความแรงร้อยละ 0.05 จัดเป็นยาทาสเตอรอยด์ที่มีความแรงปานกลาง

ผู้ใหญ่:

ทายาซี้ผึ้งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตบาง ๆ บริเวณผิวหนังที่มีรอยโรค วันละ 1 – 2 ครั้ง ไม่ควรใช้ยานานกว่า 2 สัปดาห์ เพื่อลดผลข้างเคียงเฉพาะที่หรือผลข้างเคียงทั่วร่างกาย หากอาการดีขึ้นสามารถลดขนาดยาเป็นทาว์นละ 1 ครั้งได้

เด็ก:

เด็กอายุตั้งแต่ 12 ปีขึ้นไป: ทายาซี้ผึ้งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตด้วยปริมาณที่น้อยที่สุดที่ให้ผลในการรักษา โดยทาบาง ๆ บริเวณผิวหนังที่มีรอยโรค วันละ 1 – 2 ครั้ง ไม่ควรใช้ยานานกว่า 2 สัปดาห์ และหลีกเลี่ยงการใช้ยาบริเวณใบหน้า ข้อพับ และขาหนีบ

เด็กอายุมากกว่า 1 ปี : ห้ามใช้ในเด็กอายุน้อยกว่า 1 ปี สำหรับเด็กอายุมากกว่า 1 ปี สามารถใช้ได้ แต่ต้องระมัดระวัง โดยทายาในปริมาณน้อยที่สุดที่ให้ผลการรักษา

ขนาดยาในผู้ป่วยกลุ่มพิเศษ

ผู้สูงอายุ (มากกว่า 65 ปี):

ใช้ยาทาซี้ผึ้งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตด้วยปริมาณที่น้อยที่สุดที่ให้ผลในการรักษา

ผู้ที่มีการทำงานของตับหรือไตบกพร่อง

ไม่มีข้อมูลการปรับขนาดยาทาซี้ผึ้งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตในผู้ป่วยกลุ่มนี้ ควรทายาด้วยปริมาณน้อยที่สุด และระยะเวลาการรักษาสั้นที่สุดที่ให้ผลในการรักษา

4.2.2 วิธีการบริหารยา (Mode of administration)

ทายาซี้ผึ้งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตบาง ๆ บริเวณผิวหนังที่มีรอยโรค หลีกเลี่ยงการทายาบริเวณใบหน้า ข้อพับ และขาหนีบ และไม่ควรรู้อานานกว่า 2 สัปดาห์

ไม่ใช้วัสดุใด ๆ ปิดทับบริเวณที่ทายา ยกเว้น กรณีรักษาโรคสะเก็ดเงิน หรือภาวะที่รักษายาก (recalcitrant condition) อาจใช้วัสดุตกแต่งแผลชนิดกันอากาศและน้ำระเหย (occlusive dressing) ปิดทับได้

4.3 ข้อห้ามใช้ (Contraindications)

- ห้ามใช้ในผู้ที่มีประวัติแพ้ยาเบทาเมทาโซนวาเลอเรต หรือยาสเตอรอยด์อื่น ๆ และส่วนประกอบอื่นในยาซี้ผึ้ง
- ห้ามใช้ในผู้ที่มีผื่นชนิดโรซาเซีย (rosacea) และ สิว (acne vulgaris) เพราะอาจกระตุ้นให้โรคกำเริบได้
- ห้ามใช้กับผื่นผิวหนังอักเสบหรือผื่นคันบริเวณรอบปาก รอบทวารหนัก และอวัยวะสืบพันธุ์

- ห้ามใช้กับผิวหนังที่ติดเชื้อ ที่ยังไม่ได้รับการรักษา เช่น ไวรัส, แบททีเรีย เชื้อรา เชื้อวัณโรค เนื่องจาก ยาสเตอรอยด์กดภูมิคุ้มกันเฉพาะที่ จึงเสี่ยงต่อการติดเชื้อมากขึ้น
- ห้ามใช้กับดวงตา เนื่องจากมีรายงานว่ายาใส่ยาเบทาเมทาโซนเข้าไปในตาทำให้เกิดความผิดปกติในการมองเห็น ความดันในตาสูงและหากเป็นต่อกระจกอยู่จะทำให้อาการของต่อกระจกรุนแรงขึ้น และหากผู้ป่วยเป็นโรคต้อหินอยู่และทายาเบทาเมทาโซนบริเวณรอบเปลือกตา (periorbital area) ก็อาจทำให้อาการต้อหินรุนแรงขึ้น

4.4 คำเตือนพิเศษและข้อควรระวังในการใช้ยา (Special warnings and precautions for use)

- หลีกเลี่ยงการทายาขี้ผึ้งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตติดต่อกันเป็นระยะเวลานาน โดยเฉพาะในเด็ก ผู้สูงอายุ เนื่องจากอาจมีผลลดการทำงานของต่อมหมวกไต ทำให้ผิวหนังฝ่อลีบ และกดการเจริญเติบโตในเด็ก
- ระวังการทายาขี้ผึ้งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตในโรคสะเก็ดเงิน เพราะอาจกระตุ้นการกำเริบของโรคในระหว่างการใช้ยาหรือหลังจากหยุดยา
- ระวังการทายาขี้ผึ้งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตในผู้ที่ระบบไหลเวียนเลือดผิดปกติ เพราะอาจทำให้ผิวหนังเกิดแผลง่ายขึ้น
- ระวังการทายาขี้ผึ้งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตในผู้ป่วยเบาหวาน เพราะอาจทำให้แผลที่ผิวหนังหายช้าหรือเกิดภาวะแทรกซ้อนบริเวณผิวหนัง
- ระวังการทายาขี้ผึ้งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตในผู้ที่มีความบกพร่องในการทำงานของทีเซลล์ (T cell) หรือผู้ที่ได้รับยากดภูมิคุ้มกันร่วมด้วย เนื่องจากอาจกระตุ้นให้เกิดการติดเชื้อขึ้น
- ระวังการทายาขี้ผึ้งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตในสตรีมีครรภ์ ไม่ควรใช้ในปริมาณมาก ไม่ควรทายาเป็นพื้นที่กว้าง หรือใช้ติดต่อกันเป็นระยะเวลานาน เพื่อป้องกันผลต่อทารกในครรภ์
- ระวังการทายาขี้ผึ้งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตในสตรีที่ให้นมบุตร โดยใช้เมื่อประโยชน์ที่ได้รับคุ้มค้ำกับความเสี่ยงที่อาจเกิดขึ้นต่อทารก
- ควรระวังการทายาขี้ผึ้งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตรอบดวงตา ไม่ควรใส่ยาเข้าไปในดวงตา เพราะทำให้เกิดต้อหิน ต้อกระจก หรือเพิ่มความดันในลูกตา
- ไม่ควรใช้วัสดุตกแต่งแผ่นชนิดกันอากาศและน้ำระเหย ปิดทับบริเวณที่ทายาขี้ผึ้งเบทาเมทาโซนวาเลอเรต เพราะเป็นการเพิ่มปริมาณยาที่จะดูดซึมเข้าสู่ร่างกายและเพิ่มความเสี่ยงต่อการติดเชื้อ ยกเว้นในกรณีที่มีวัตถุประสงค์ให้ยาดูดซึมเข้าสู่ผิวหนังมาก
- การทายาขี้ผึ้งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตในผู้ป่วยที่มีความเสี่ยงต่อการดูดซึมยาเข้าสู่กระแสเลือดควรติดตามภาวะการทำงานของ hypothalamic-pituitary adrenal (HPA) axis โดยการตรวจระดับ

คอร์ติซอลในปัสสาวะหรือในเลือด หากพบว่ามีภาวะดังกล่าวควรค่อย ๆ หยุดยา หรือใช้ยาที่มีความแรงต่ำลง หรือลดความถี่ในการบริหารยา

4.5 อันตรกิริยากับยาอื่น ๆ หรืออันตรกิริยาอื่น ๆ (Interaction with other medicinal products and other forms of interaction)

ยังไม่มีข้อมูลชัดเจนเกี่ยวกับการเกิดอันตรกิริยาของยาซีมีงเบตามาเททาโซนวาเลอเลตกับยาอื่น

4.6 การใช้ในสตรีมีครรภ์และสตรีระหว่างให้นมบุตร (Pregnancy and lactation)

4.6.1 การใช้ยาในสตรีมีครรภ์

ก) การเกิดทารกวิรูป (Teratogenic effects)

มีข้อมูลจำกัดเกี่ยวกับการเกิดอันตรกิริยาของยาซีมีงเบตามาเททาโซนวาเลอเลตในสตรีมีครรภ์ โดย US Pregnancy Category จัดยาเบตามาเททาโซนวาเลอเลตโดยไม่ระบุรูปแบบของยา ให้อยู่ใน Category C ในทุกไตรมาส ซึ่งหมายถึง กรณีใดกรณีหนึ่งดังต่อไปนี้ การศึกษาในสัตว์ทดลองพบอันตรายบางประการ ได้แก่ กำเนิดทารกวิรูป (teratogenic) ตัวอ่อนตาย (embryocidal) หรืออื่น ๆ และไม่มีการศึกษาชนิดควบคุมการวิจัยในสตรีมีครรภ์ หรือ ไม่มีการศึกษาทั้งในสตรีมีครรภ์และสัตว์ทดลอง ยาในกลุ่มนี้จึงควรใช้เฉพาะเมื่อประโยชน์ที่ได้รับคุ้มค้ำกับความเสี่ยงที่อาจเกิดขึ้นต่อทารกในครรภ์

ยาทาเบตามาเททาโซนสามารถถูกดูดซึมเข้าสู่ร่างกาย โดยยาสามารถผ่านรกได้ ซึ่งจากรายงานกรณีศึกษาในมนุษย์พบว่า การใช้ยาคอร์ติโคสเตอรอยด์ในรูปแบบรับประทานหรือฉีด ในช่วงไตรมาสแรกของการตั้งครรภ์มีความสัมพันธ์กับปากแหว่ง (oral cleft) ในทารก ดังนั้นการใช้ยาทาสเตอรอยด์ในสตรีมีครรภ์ไม่ควรใช้ปริมาณมาก ทาในพื้นที่กว้าง หรือใช้ติดต่อกันเป็นระยะเวลานาน เพื่อป้องกันผลต่อทารกในครรภ์

ข) ผลที่ไม่ใช่ทารกวิรูป (Nonteratogenic effects)

ยาทาเบตามาเททาโซนสามารถถูกดูดซึมผ่านเข้าสู่ร่างกาย และผ่านรกได้ ารายงานกรณีศึกษาของการใช้ยาคอร์ติโคสเตอรอยด์ขนาดสูงในรูปแบบรับประทานหรือฉีดในสตรีตั้งครรภ์พบว่า ยาสามารถกดการทำงานของ HPA axis ทั้งในแม่และในทารก และทำให้เกิดอาการต่าง ๆ ในทารกเช่น กลุ่มอาการคุชชิง (Cushing's syndrome) ระดับน้ำตาลในเลือดสูง มีน้ำตาลในปัสสาวะ

4.6.2 การใช้ยาในสตรีระหว่างคลอดบุตร

ไม่มีข้อมูล

4.6.3 การใช้ยาในสตรีระหว่างให้นมบุตร

ไม่มีข้อมูลที่ชัดเจนว่ายยาเบตามาเททาโซนวาเลอเลตที่ถูกดูดซึมเข้าสู่ร่างกายมีระดับยามากเพียงพอที่จะสามารถขับออกทางน้ำนม แต่เนื่องด้วยมียาหลายชนิดที่สามารถขับทางน้ำนมได้ ดังนั้นจึงควรใช้ยาทาเบตามาเททาโซนอย่างระมัดระวังในหญิงที่ให้นมบุตร โดยใช้เมื่อประโยชน์ที่อาจได้รับคุ้มค้ำกับความเสี่ยงที่อาจเกิดขึ้นต่อทารก

หากเป็นไปได้ในควรเลือกใช้ยาทาสเตอรอยด์ที่มีความแรงน้อยกว่า เช่น hydrocortisone หรือ triamcinolone เป็นอันดับแรก และไม่ควรรักษาด้วยยาทาสเตอรอยด์บริเวณใบหน้า หรือหัวนมระหว่างให้นมบุตร เพื่อป้องกันผลต่อทารก

4.7 ผลต่อความสามารถในการขับขี่และทำงานกับเครื่องจักร (Effects on ability to drive and use machine)

ไม่มีข้อมูลเกี่ยวกับผลของยาทาซิงเบตาเมทาโซนวาเลอเรตต่อการขับขี่ยานยนต์หรือการใช้เครื่องจักร

4.8 อาการไม่พึงประสงค์ (Undesirable effects)

ในกรณีใช้ยาซิงเบตาเมทาโซนวาเลอเรตอย่างเหมาะสม ข้อมูลการเกิดผลข้างเคียงมีเพียงอาการเฉพาะที่ในบริเวณผิวหนังที่ทายา และผลข้างเคียงทางผิวหนังดีขึ้นหลังจากหยุดยา

4.8.1 อาการไม่พึงประสงค์ทางผิวหนังที่พบน้อย มีดังนี้

• ปุ่มรากขน อักเสบ (folliculitis) • มีฝีที่ปุ่มรากขนและรอบปุ่มรากขน (furunculosis) • ตุ่มหนองขนาดเล็กหรือตุ่มน้ำ • ผิวหนังไวต่อความรู้สึก (hyperesthesia) • เพอร์พิวรา (purpura) • ผิวหนังแตกลาย • ผิวหนังสีจาง • ผด (miliaria rubra) • ผิวหนังฉีกขาด (laceration of skin) • แผลหายช้า

4.8.2. อาการไม่พึงประสงค์ทางผิวหนังที่สามารถพบได้ แต่ไม่สามารถระบุความถี่ของการเกิดอาการไม่พึงประสงค์แต่ละชนิดได้ เนื่องจากขึ้นกับขนาดยาและระยะเวลาในการรักษา มีดังนี้

• ผิวหนังแห้ง • คัน • ผิวหนังแสบร้อน (burning) • ผิวหนังแดง • ผิวหนังบาง • ผิวหนังระคายเคือง • หลอดเลือดฝอยพอง (telangiectasis) • ผิวหนังแตกลาย (striae) • ผิวหนังฝ่อลีบ • ภาวะขนดก (hypertrichosis) • ผิวหนังเปลี่ยนสี • ผิวหนังอักเสบแบบแพ้จากการสัมผัส (allergic contact dermatitis) • สิวจากสเตอรอยด์โดยสิวจากสเตอรอยด์นี้เกิดหลังจากใช้ยานานเป็นสัปดาห์หรือเป็นเดือน และพบที่หน้าอก หลัง หรือไหล่ • เลือดออกใต้ผิวหนัง (ecchymosis) ซึ่งเป็นอาการที่พบบ่อยในผู้สูงอายุ ที่เกิดจากการทำลายคอลลาเจนที่หลอดเลือดขนาดเล็ก จึงมีเลือดออกมาในเนื้อเยื่อรอบ ๆ

4.8.3 อาการไม่พึงประสงค์ที่เกิดกับระบบอื่นนอกเหนือจากผิวหนังเนื่องจากยาทาถูกดูดซึมเข้าสู่ร่างกาย

การใช้ยาซิงเบตาเมทาโซนวาเลอเรตในปริมาณมาก หรือระยะเวลาานาน หรือใช้วัสดุตกแต่งแผลชนิดกันอากาศ และน้ำระเหยปิดทับบริเวณที่ทายาอาจทำให้ยาถูกดูดซึมเข้าสู่กระแสเลือดจนเกิดผลข้างเคียงทั่วร่างกาย (systemic) ได้ ดังนี้

ระบบต่อมไร้ท่อ • กดการทำงานของ HPA axis โดยยับยั้งการทำงานของต่อมใต้สมอง (pituitary gland) ในการหลั่ง adrenocorticotropin hormone (ACTH) หรืออาจเรียกว่า corticotrophin ทำให้ร่างกายขาด ACTH และลดการหลั่งคอร์ติโคสเตอรอยด์ที่ร่างกายผลิตโดยธรรมชาติ (endogenous corticosteroids) และแอนโดรเจน (androgens) เมื่อหยุดยากระทันหันจึงทำให้ร่างกายขาด ACTH หรือเรียกภาวะนี้ว่า ภาวะคอร์ติ

ซอลต่ำแบบทุติยภูมิ (secondary hypocortisolism) และเกิดอาการนอนยา ดังนี้ •กลุ่มอาการคุชชิง เช่น หน้าบวมอ้วนที่กลางลำตัว (central obesity) •กดการเจริญเติบโตในเด็กที่ใช้ยา•ระดับน้ำตาลในเลือดสูง • ความดันโลหิตสูง•น้ำหนักเพิ่ม

ระบบตา •ต้อหิน •ต้อกระจก •ความดันในตาสูง

ระบบภูมิคุ้มกัน ยาทาเบตาเมทาโซนวาเลอเรตบดบังอาการติดเชื้อ

ระบบอื่น ๆ มีรายงานการใช้ยาทาเบตาเมทาโซนวาเลอเรตในเด็กอายุต่ำกว่า 1 ปี แล้วเกิดภาวะ benign intracranial hypertensionโดยบางรายมีอาการหลังจากหยุดใช้ยาแล้วประมาณ 1 สัปดาห์ ตัวอย่างอาการที่พบคือ •ง่วงซึม (drowsiness) •หงุดหงิด (irritability) •อาเจียน •การโป่งของกระดูกส่วนหน้า (bulging anterior fontanelle) •bilateral abducens nerve paralysis•มือกระตุก

4.9 การได้รับยาเกินขนาด (Overdose)

4.9.1 ขนาดยาสูงสุดต่อวันที่ผู้ป่วยแต่ละกลุ่มอายุควรได้รับ

ขนาดยาสูงสุดต่อวันของยาทาซี้ฝิ่งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตที่ผู้ป่วยแต่ละกลุ่มอายุควรได้รับ ยังไม่เป็นที่ทราบแน่ชัด โดยการใช้ยาทาในเด็กอาจเกิดผลข้างเคียงเฉพาะที่หรือผลข้างเคียงทั่วร่างกายได้ง่ายกว่าผู้ใหญ่ เนื่องจากเด็กมีอัตราส่วนพื้นที่ผิวต่อน้ำหนักตัวมากกว่าผู้ใหญ่ ทำให้มีการดูดซึมยาทางผิวหนังเข้าสู่กระแสเลือดปริมาณสูงกว่า

4.9.2 ขนาดยาที่อาจเกิดพิษ

ขนาดยาซี้ฝิ่งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตที่อาจเกิดพิษยังไม่เป็นที่ทราบแน่ชัด แต่การทายาเป็นบริเวณกว้าง เป็นเวลานาน หรือใช้วัสดุตกแต่งแผลชนิดกันอากาศและน้ำระเหยปิดทับบริเวณที่ทายา เป็นการเพิ่มปริมาณยาที่ถูกดูดซึมเข้าสู่ร่างกาย จึงอาจเพิ่มความเสี่ยงต่อการเกิดผลข้างเคียงทั่วร่างกายได้ มีข้อมูลการทายาครีมเบทาเมทาโซนความเข้มข้นร้อยละ 0.1 วันละ 3 ครั้งที่ใช้หน้าเป็นเวลา 10 ปีทำให้เกิดความดันในตาสูงได้ แต่ไม่มีข้อมูลของยาซี้ฝิ่งเบทาเมทาโซนวาเลอเรต

4.9.3 อาการและอาการแสดงของการได้รับยาเกินขนาดชนิดเฉียบพลัน

ไม่มีข้อมูลเกี่ยวกับอาการและอาการแสดงของการได้รับยาซี้ฝิ่งเบทาเมทาโซนวาเลอเรตเกินขนาดชนิดเฉียบพลัน

4.9.4 วิธีรักษากรณีเกิดพิษแบบเฉียบพลัน

ไม่มีข้อมูลเกี่ยวกับการรักษาอาการและอาการแสดงของการได้รับยาครีมเบทาเมทาโซนวาเลอเรตเกินขนาดชนิดเฉียบพลัน

4.9.5 อาการและอาการแสดงของการได้รับยาเกินขนาดชนิดเรื้อรัง

อาการพิษของยาทาเบทาเมทาโซนวาเลอเรตที่ใช้เป็นระยะเวลานาน ทำให้เกิดทั้งอาการเฉพาะที่และอาการทั่วร่างกาย ได้แก่ เลือดออกใต้ผิวหนัง แผลหายช้า เลือดออกในทางเดินอาหาร กล้ามเนื้ออ่อนแรง

เนื่องจากฤทธิ์ต้านกลูโคคอร์ติโคสเตอรอยด์และมิเนอราโลคอร์ติคอยด์ที่มีมากเกินไป จะกีดการทำงานของ HPA axis และทำให้เกิดกลุ่มอาการคุชชิง เช่น ความดันโลหิตสูง บวม และเสี่ยงต่อกระดูกหัก

4.9.6 วิธีรักษากรณีเกิดพิษแบบเรื้อรัง

ไม่มียาแก้พิษ (antidote) ที่จำเพาะในการรักษาอาการพิษ ของยาทาเบทาเมทาโซนวาเลอเรต ควรค่อย ๆ ลดขนาดยาช้า ๆ

5. คุณสมบัติทางเภสัชวิทยา (Pharmacological Properties)

5.1 คุณสมบัติทางเภสัชพลศาสตร์ (Pharmacodynamic properties)

5.1.1 กลไกการออกฤทธิ์ของยา

ยาทาซีฟีนเบทาเมทาโซนวาเลอเรต เป็นกลูโคคอร์ติคอยด์สังเคราะห์ ที่มีฤทธิ์เด่นด้านกลูโคคอร์ติคอยด์ แต่ก็ยังมีฤทธิ์ด้านมิเนอราโลคอร์ติคอยด์อยู่เล็กน้อย โดยมีฤทธิ์หลักทางเภสัชวิทยาที่ใช้สำหรับโรคต่าง ๆ คือ ฤทธิ์ต้านอักเสบ ลดอาการคัน และทำให้หลอดเลือดหดตัว กลไกต้านการอักเสบของยาทาเบทาเมทาโซนวาเลอเรตยังไม่ทราบแน่ชัด แต่อาจเกิดจากหลายกลไกประกอบกัน เช่น ยับยั้งการเกาะของเม็ดเลือดขาวที่เซลล์ผนังหลอดเลือดฝอยตรงบริเวณอักเสบ ยับยั้งการสะสมของแมคโครฟาจในบริเวณอักเสบ ทำให้เมมเบรนของไลโซโซมของเม็ดเลือดขาว (leukocyte lysosomal membrane) แข็งแรงขึ้น ป้องกันการปล่อยเอนไซม์ destructive acid hydrolases จากเม็ดเลือดขาวลดการผ่านเข้าออกของสารต่าง ๆ ผ่านผนังหลอดเลือดฝอย จึงลดอาการบวมต้านฤทธิ์ฮีสตามีน และลดการปล่อยไคนิน (kinin) จากซับสเตรต (substrates) เหนียวนำโปรตีน lipocortins ซึ่งมีฤทธิ์ยับยั้งฤทธิ์ของ phospholipase A2 ทำให้ลดการสร้างโพสตาแกลนดินส์ (prostaglandins), ลิวโคทรอินส์ (leukotrienes) และสารประกอบอื่นที่เกี่ยวข้องลดการเจริญของไฟโบรบลาสต์ (fibroblast) ลดการสะสมคอลลาเจน รวมทั้งลดการสร้างแผลเป็น ผลลัพธ์โดยรวมทำให้ลดการอักเสบ

โดยสรุป ฤทธิ์ต้านการอักเสบในช่วงแรกของยาทาสเตอรอยด์เกิดจากการยับยั้งการเคลื่อนย้ายเม็ดเลือดขาวและแมคโครฟาจไม่ให้เข้าไปสู่บริเวณที่อักเสบ และลดการผ่านเข้าออกของสารต่าง ๆ ผ่านผนังหลอดเลือดฝอย ส่วนช่วงหลัง ยามีฤทธิ์ต้านการอักเสบโดยยับยั้งลดการสะสมคอลลาเจนและลดการสร้างแผลเป็น

5.1.2 ความสัมพันธ์ของขนาดยา ความเข้มข้น หรือเวลา กับการตอบสนองทางเภสัชพลศาสตร์ของยา

การตอบสนองทางเภสัชพลศาสตร์ต่อขนาดยาทาเบทาเมทาโซนวาเลอเรตของแต่ละบุคคลมีความหลากหลาย ขึ้นอยู่กับความรุนแรงของโรค พื้นผิวบริเวณที่ทายา และระยะเวลาการใช้ยา

5.1.3 กลไกการเกิดพิษของยา

การใช้ยาทาในบริเวณกว้าง ระยะเวลาานาน หรือใช้วัสดุตกแต่งแผลชนิดกันอากาศและน้ำระเหยปิดทับบริเวณที่ทายา เป็นการเพิ่มปริมาณยาที่จะดูดซึมเข้าสู่ร่างกาย จึงเพิ่มความเสี่ยงต่อการเกิดผลข้างเคียงทั่วร่างกายได้ ทำให้เกิดกลุ่มอาการคุชชิง เลือดออกใต้ผิวหนัง แผลหายช้า เลือดออกในทางเดินอาหาร

กล้ามเนื้ออ่อนแรง เนื่องจากยามีฤทธิ์ต้านกลูโคคอร์ติโคสเตอรอยด์และมิเนอราโลคอร์ติคอยด์ จึงอาจลดการทำงานของ HPA axis ได้

5.2 คุณสมบัติทางเภสัชจลนศาสตร์ (Pharmacokinetic properties)

การดูดซึมยา

การใช้ยาทาเบทาเมทาโซนวาเลอเรตบริเวณผิวหนังสามารถถูกดูดซึมเข้าสู่กระแสเลือดประมาณร้อยละ 12 - 14 โดยปริมาณการดูดซึมยาจากผิวหนังขึ้นกับหลายปัจจัย เช่น ส่วนประกอบในผลิตภัณฑ์ ความเข้มข้นของยา ลักษณะผิวหนัง ตำแหน่งของผิวหนัง โดยผิวหนังบริเวณเปลือกตา ใบหน้า รักแร้ หนังศีรษะ ผิวหนังที่มีการอักเสบ การใช้วัสดุตกแต่งแผลชนิดกันอากาศและน้ำระเหย ปิดทับบริเวณที่ทายาการสูญเสียเคอราทินที่ผิวหนัง จะเพิ่มการดูดซึมยาเข้าสู่ร่างกาย ซึ่งการดูดซึมยาจากการทานั้นมากเพียงพอที่จะทำให้เกิดผลของยาทั่วร่างกายได้ เมื่อยาถูกดูดซึมเข้าสู่กระแสเลือดจะมีคุณสมบัติทางเภสัชจลนศาสตร์เหมือนกับการให้ยาในรูปแบบรับประทานหรือฉีด

การเปลี่ยนแปลงยา

เมื่อยาเข้าสู่ร่างกายจะถูกทำลายที่ตับเป็นหลักได้เป็นสารที่ไม่มีฤทธิ์ในการรักษา

การกระจายยา

- ยาเบทาเมทาโซนจับกับโปรตีนในพลาสมาได้อย่างอ่อน (weakly bind) ยาที่อยู่ในรูปที่ไม่จับกับโปรตีนเป็นยาที่ออกฤทธิ์
- ค่าการกระจายตัวของยาเบทาเมทาโซนวาเลอเรตประมาณ 75 - 90 ลิตร
- ยาเบทาเมทาโซนวาเลอเรต เมื่อดูดซึมเข้าสู่กระแสเลือดสามารถกระจายไปยังส่วนต่าง ๆ ได้ดี เช่น ไต ลำไส้ ผิวหนัง ตับ และกล้ามเนื้อ

การกำจัดยา

- ยาถูกกำจัดออกทางไตเป็นหลักซึ่งพบตัวยาเบทาเมทาโซนในปัสสาวะประมาณร้อยละ 4 ที่เหลือเป็นสารเมแทบอลิต์ และยากำจัดออกทางน้ำดีเล็กน้อย
- อัตราการกำจัดยาทางไตประมาณ 9.5 มิลลิตร/นาที
- ค่าครึ่งชีวิตในการออกฤทธิ์ทางชีวภาพ (biological half-life) ประมาณ 35 - 54 ชั่วโมง
- ค่าครึ่งชีวิตในเลือดประมาณ 5.6 - 6.5 ชั่วโมง

5.3 ข้อมูลความปลอดภัยจากการศึกษาพรีคลินิก (Preclinical safety data)

จากการศึกษาในสัตว์พบว่าการศึกษาเบตาเมทาโซนวาเลอเรตเข้าทางใต้ผิวหนังในขนาดสูงกว่า 0.1 มิลลิกรัม/กิโลกรัม/วันในหนู หรือมากกว่า 12 ไมโครกรัม/กิโลกรัม/วันในกระต่ายที่ตั้งครรภ์ มีผลทำให้เกิดตัวอ่อนวิรูป เช่น เพดานโหว่ (cleft palate) แต่ไม่มีข้อมูลการศึกษาในสัตว์เกี่ยวกับการก่อให้เกิดมะเร็งหรือผลต่อการสืบพันธุ์

6. รายละเอียดทางเภสัชกรรม (Pharmaceutical Particulars)

6.1 รายการตัวยาไม่สำคัญ (List of excipients)

<ข้อมูลของบริษัทยา>

6.2 ความไม่เข้ากันของยา (Incompatibilities)

<ข้อมูลของบริษัทยา>

6.3 อายุของยา (Shelf life)

<ข้อมูลของบริษัทยา>

6.4 ข้อควรระวังพิเศษในการเก็บยา (Special precautions for storage)

<ข้อมูลของบริษัทยา>

6.5 ลักษณะและส่วนประกอบของภาชนะบรรจุ (Nature and contents of container)

<ข้อมูลของบริษัทยา>

7. ชื่อผู้รับอนุญาตผลิตหรือนำหรือสั่งยาแผนปัจจุบันเข้ามาในราชอาณาจักร (Marketing Authorization Holder)

<ข้อมูลของบริษัทยา>

8. เลขทะเบียนตำรับยา (Marketing Authorization Numbers)

<ข้อมูลของบริษัทยา>

9. วันที่ได้รับอนุมัติทะเบียนตำรับยา (Date of authorization)

<ข้อมูลของบริษัทยา>

10. วันที่มีการแก้ไขปรับปรุงเอกสาร (Date of revision of the text)

วันที่ 26 เดือนพฤษภาคม พ.ศ.2559