



LIÊN LƯU NÀY CHỈ DÙNG THEO ĐƠN THUỐC

BILANTIHIS 10 DT

ĐỀ XA TAY TRẺ EM.

ĐỌC VÀY HƯỜNG DẪN SỬ DỤNG TRƯỚC KHI DÙNG.

THÀNH PHẦN: Mỗi viên nén phân tán trong miệng chứa

- Thành phần dược chất: Bilastine10,00 mg.
- Thành phần tá dược: microcrystallin cellulose 102, sodium lauryl sulfate, sodium starch glycolate, Crospovidone CL-M, Crospovidone XL-10, sucralose, mùi cam bột, colloidal silicon dioxyd, magnesium stearate.

DẠNG BÀO CHẾ: Viên nén phân tán trong miệng (Viên nén tròn màu trắng đến trắng ngà, vị ngọt, thơm mùi cam)

CHỈ ĐỊNH:

Điều trị triệu chứng trong trường hợp viêm mũi dị ứng (quanh năm hoặc theo mùa) và mày đay cho trẻ em từ 6-11 tuổi có cân nặng từ 20 kg trở lên.

LIỀU DÙNG VÀ CÁCH DÙNG:

Liều dùng:

Sử dụng cho trẻ em từ 6-11 tuổi có cân nặng từ 20 kg trở lên:

Liều dùng 10 mg (1 viên) một lần/ngày.

Cần uống thuốc vào thời điểm 1 giờ trước hoặc 2 giờ sau ăn hoặc uống nước trái cây. (Xem mục Tương tác, tương kỵ của thuốc).

Trẻ em dưới 6 tuổi và có cân nặng dưới 20 kg:

Thông tin về độ an toàn và hiệu quả của bilastine trên trẻ em dưới 6 tuổi vẫn chưa được nghiên cứu đầy đủ. Do đó không khuyến cáo sử dụng BILANTIHIS 10 DT cho đối tượng này.

Đối với người lớn và trẻ em trên 12 tuổi: Khuyến cáo nên sử dụng bilastine 20 mg (tương đương 2 viên BILANTIHIS 10 DT).

Thời gian điều trị

Đối với viêm mũi dị ứng, việc điều trị nên được giới hạn trong thời gian tiếp xúc với các dị nguyên. Đối với điều trị viêm mũi dị ứng theo mùa, việc điều trị có thể được ngừng sau khi các triệu chứng đã được giải quyết và tái điều trị cho đến khi các triệu chứng xuất hiện trở lại. Trong viêm mũi dị ứng lâu năm điều trị có thể được đề xuất cho bệnh nhân trong thời gian tiếp xúc với dị nguyên. Đối với nổi mày đay thời gian điều trị phụ thuộc vào dạng mày đay, thời gian và diễn biến của triệu chứng.

Đối tượng bệnh nhân đặc biệt

Bệnh nhân suy thận:

Tính an toàn và hiệu quả của bilastine trên bệnh nhân trẻ em suy thận chưa được nghiên cứu đầy đủ. Các nghiên cứu thực hiện trên người trưởng thành trong nhóm nguy cơ đặc biệt (bệnh nhân suy thận) cho thấy không cần chỉnh liều trên bệnh nhân là người trưởng thành suy thận. (Xem mục đặc tính dược động học).

Bệnh nhân suy gan:

Tính an toàn và hiệu quả của bilastine trên bệnh nhân trẻ em suy gan chưa được nghiên cứu đầy đủ. Chưa có dữ liệu lâm sàng về việc dùng thuốc trên bệnh nhân suy gan ở cả đối tượng người trưởng thành và trẻ em. Tuy nhiên, do bilastine không chuyển hóa qua gan mà chủ yếu thải trừ dưới dạng không biến đổi qua nước tiểu và phân, tình trạng suy gan có thể không làm nồng độ thuốc trong máu vượt quá giới hạn an toàn. Do đó, không cần chỉnh liều trên bệnh nhân là người trưởng thành bị suy gan. (Xem mục đặc tính dược động học).

Cách dùng:

Thuốc dùng đường uống.

Thuốc dùng dạng viên nén phân tán trong miệng nên khi được ngậm ở trong miệng sẽ tan nhanh trong nước bọt, do đó sẽ rất dễ nuốt.

Ngoài ra, viên nén phân tán trong miệng có thể được hòa tan vào nước trước khi uống. Không nên dùng nước bưởi chùm hoặc bất cứ nước trái cây nào khác để hòa tan viên thuốc. (Xem mục Tương tác, tương kỵ của thuốc).

CHỐNG CHỈ ĐỊNH:

Chống chỉ định cho các bệnh nhân quá mẫn với bilastine hoặc bất kỳ thành phần tá dược nào của thuốc.

CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG KHI SỬ DỤNG:

- Trẻ em: Thông tin về hiệu quả và độ an toàn của bilastine trên trẻ em dưới 2 tuổi vẫn chưa được nghiên cứu đầy đủ và có ít kinh nghiệm lâm sàng về việc dùng thuốc cho trẻ từ 2 đến 5 tuổi do đó không nên dùng bilastine cho nhóm tuổi này.

- Trên bệnh nhân suy thận nặng hoặc trung bình, việc sử dụng đồng thời bilastine với các chất ức chế glycoprotein P như ketoconazol, erythromycin, cyclosporin, ritonavir hoặc diltiazem có thể làm tăng nồng độ bilastine trong huyết tương, do đó làm tăng nguy cơ xảy ra phản ứng bất lợi. Vì vậy, cần tránh sử dụng đồng thời bilastine và các chất ức chế glycoprotein P trên bệnh nhân suy thận nặng hoặc trung bình.

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

Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai:

Không có hoặc có rất ít dữ liệu về việc sử dụng bilastine trên phụ nữ có thai.

Nghiên cứu trên động vật không cho thấy tác động có hại trực tiếp hoặc gián tiếp trên khả năng sinh sản, sự phát triển của bào thai và sau sinh. Tuy nhiên, để đảm bảo an toàn tránh sử dụng bilastine trong giai đoạn mang thai.

Sử dụng thuốc cho phụ nữ cho con bú:

Thông tin về khả năng bài xuất qua sữa mẹ của bilastine vẫn chưa được biết rõ. Dữ liệu về dược động học ở động vật cho thấy có sự bài tiết bilastine vào trong sữa. Trên thực tế, cần quyết định tiếp tục hoặc ngừng cho con bú hay tiếp tục hoặc ngừng sử dụng bilastine dựa trên tương quan giữa lợi ích của việc bú mẹ cho trẻ và lợi ích của mẹ khi sử dụng bilastine.

Khả năng sinh sản:

Chưa có hoặc rất ít bằng chứng lâm sàng. Một nghiên cứu trên chuột cho thấy không có tác động tiêu cực nào trên chức năng sinh sản.

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

Một nghiên cứu được thực hiện ở người lớn để đánh giá tác động của bilastine lên khả năng lái xe đã cho thấy việc sử dụng liều 20 mg không ảnh hưởng đến khả năng lái xe. Tuy nhiên đáp ứng với thuốc ở mỗi bệnh nhân có thể khác nhau và do đó mỗi bệnh nhân được khuyến nên đánh giá đáp ứng của mình khi dùng bilastine trước khi lái xe hoặc vận hành máy móc.

TƯƠNG TÁC, TƯƠNG Kỵ CỦA THUỐC:

Tương tác:

Các nghiên cứu tương tác chỉ được thực hiện ở người lớn và được tóm tắt dưới đây.

Tương tác với thức ăn:

Thức ăn có thể làm giảm sinh khả dụng đường uống của bilastine viên nén khoảng 30% và giảm sinh khả dụng đường uống của bilastine viên nén phân tán trong miệng là khoảng 20%.

Tương tác với nước bưởi chùm và các loại nước trái cây khác:

Uống bilastine 20 mg với nước bưởi chùm làm giảm sinh khả dụng của thuốc 30%. Tương tác này có thể xảy ra với các loại nước trái cây khác. Mức độ giảm sinh khả dụng có thể dao động giữa các chế phẩm và các loại hoa quả khác nhau. Cơ chế của tương tác này là thông qua quá trình ức chế OATP1A2, một chất vận chuyển bilastine từ đường tiêu hóa vào máu. Các thuốc là cơ chất hoặc chất ức chế OATP1A2 như ritonavir hoặc rifampicin có thể làm giảm nồng độ bilastine trong huyết tương.

Tương tác với ketoconazol hoặc erythromycin:

Uống đồng thời với bilastine 20 mg và ketoconazol 400 mg hoặc erythromycin 500 mg có thể làm tăng AUC của bilastine 2 lần và tăng Cmax 2-3 lần. Những thay đổi này có thể được giải thích bằng sự tương tác với các chất vận chuyển đưa thuốc trở lại lòng ống tiêu hóa, vì bilastine là cơ chất của P-gp và không bị chuyển hóa (xem phần phần Đặc tính dược động học). Những thay đổi này có thể không ảnh hưởng đến mức độ an toàn của bilastine và ketoconazol hoặc erythromycin. Các thuốc khác cũng là cơ chất hoặc chất ức chế P-gp, như cyclosporin, cũng có thể có khả năng làm tăng nồng độ của bilastine trong huyết tương.

Tương tác với diltiazem:

Sử dụng đồng thời bilastine 20 mg và diltiazem 60 mg làm tăng nồng độ Cmax của bilastine thêm 50%. Tác dụng này có thể được giải thích bằng sự tương tác với các chất vận chuyển đưa thuốc trở lại lòng ống tiêu hóa và đường như không ảnh hưởng đến sự an toàn của bilastine.

Tương tác với rượu:

Trạng thái tâm thần vận động sau khi uống đồng thời rượu và 20 mg bilastine tương tự như quan sát sau khi uống rượu và giả dược.

Tương tác với lorazepam:

Uống đồng thời bilastine 20 mg và lorazepam 3 mg trong 8 ngày không làm tăng tác dụng trên hệ thần kinh trung ương của lorazepam.

Trẻ em:

Nghiên cứu tương tác chỉ được thực hiện ở người lớn. Vì không có kinh nghiệm lâm sàng nào về sự tương tác của Bilastine với các sản phẩm thuốc, thực phẩm hoặc nước ép trái cây khác ở trẻ em, nên kết quả thu được trong các nghiên cứu tương tác người lớn nên được xem xét khi kê đơn thuốc cho trẻ em. Không có dữ liệu lâm sàng ở trẻ em để cho biết liệu thay đổi AUC hoặc Cmax do tương tác có ảnh hưởng đến sự an toàn của bilastine.

Tương kỵ: 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 (ADR):

Tóm tắt đặc tính an toàn trên đối tượng bệnh nhân trẻ em:

Trong các thử nghiệm lâm sàng, tần suất, chủng loại và mức độ nặng của các tác dụng không mong muốn trên thanh thiếu niên (từ 12 đến 17 tuổi) tương tự như trên người trưởng thành. Thông tin thu nhận được từ các nhóm bệnh nhân này (thanh thiếu niên) trong các nghiên cứu hậu mãi cũng tương tự như ghi nhận được trong các nghiên cứu lâm sàng.

Tỷ lệ trẻ em (2 đến 11 tuổi) có báo cáo tác dụng không mong muốn sau khi điều trị bằng bilastine 10mg trong viêm mũi dị ứng hoặc mày đay tự phát mạn tính trong nghiên cứu lâm sàng 12 tuần có kiểm soát là tương tự so với bệnh nhân dùng giả dược (68,5% so với 67,5%).

Các tác dụng không mong muốn phổ biến nhất được báo cáo trong thử nghiệm lâm sàng trên 291 bệnh nhân trẻ em (2 đến 11 tuổi) (260 trẻ em tham gia nghiên cứu về tính an toàn và 31 trẻ em tham gia nghiên cứu được động học) dùng bilastine (viên nén phân tán trong miệng) là đau đầu, buồn ngủ, chóng mặt và mệt mỏi. Các phản ứng này xuất hiện với tần suất tương tự tần suất ghi nhận được trên 249 bệnh nhân sử dụng giả dược.

Các phản ứng bất lợi ít nhất có thể liên quan đến bilastine và được báo cáo trong hơn 0,1% bệnh nhân trẻ em (từ 2 đến 11 tuổi) dùng bilastine 20mg trong giai đoạn phát triển lâm sàng của thuốc được phân loại dưới đây.

Tần suất ghi nhận như sau:

Rất phổ biến ($ADR \geq 1/10$), phổ biến ($1/100 \leq ADR < 1/10$), không phổ biến ($1/1000 \leq ADR < 1/100$), hiếm gặp ($1/10000 \leq ADR < 1/1000$) và rất hiếm gặp ($ADR < 1/10000$).

Không rõ (không thể ước tính được từ các dữ liệu hiện có).

Các phản ứng hiếm gặp, rất hiếm gặp và không rõ không được ghi vào bảng.

| Hệ cơ quan | | Bilastine 10 mg N = 291 | Giả dược N = 249 |
|---------------------------------|-------------------------|-------------------------------|---------------------|
| Tần suất | Phản ứng bất lợi | | |
| Nhiễm trùng và nhiễm độc | | | |
| Phổ biến | Viêm mũi | 3 (1,0%) | 3 (1,2%) |
| Rối loạn hệ thần kinh | | | |
| Phổ biến | Đau đầu | 6 (2,1%) | 3 (1,2%) |
| Không phổ biến | Chóng mặt | 1 (0,3%) | 0 (0,0%) |
| | Mất ý thức | 1 (0,3%) | 0 (0,0%) |
| Rối loạn thị giác | | | |
| Phổ biến | Viêm kết mạc dị ứng | 4 (1,4%) | 5 (2,0%) |
| Không phổ biến | Kích thích | 1 (0,3%) | 0 (0,0%) |
| Rối loạn đường tiêu hóa | | | |
| Phổ biến | Đau bụng /Đau bụng trên | (1,0%) | 3(1,2%) |
| Không phổ biến | Buồn nôn | 1(0,3%) | 0(0,0%) |
| | Tiêu chảy | 2(0,7%) | 0(0,0%) |
| | Sung môi | 1(0,3%) | 0(0,0%) |
| Rối loạn da và mô mềm | | | |
| Không phổ biến | Eczema | 1(0,3%) | 0(0,0%) |
| | Mày đay | 2(0,7%) | 2(0,8%) |
| Rối loạn toàn thân | | | |
| Không phổ biến | Mệt mỏi | 2(0,7%) | 0(0,0%) |

Mô tả phản ứng bất lợi ở trẻ em:

Đau đầu, đau bụng, viêm kết mạc dị ứng và viêm mũi đã được báo cáo ở cả nhóm trẻ điều trị với bilastine 10mg hoặc với giả dược. Tần suất được báo cáo là 2,1% và 1,2% bị đau đầu; 1% và 1,2% bị đau bụng, 1,4% và 2% bị viêm kết mạc dị ứng, 1% và 1,2% viêm mũi.

Tóm tắt đặc tính an toàn ở bệnh nhân người lớn và thanh thiếu niên:

Trong các thử nghiệm lâm sàng, số lượng tác dụng không mong muốn gặp phải ở bệnh nhân trưởng thành và thanh thiếu niên bị viêm mũi dị ứng hoặc mày đay nguyên phát mãn tính được điều trị bằng bilastine 20 mg tương tự với số lượng ghi nhận trên bệnh nhân sử dụng giả dược (12,7% so với 12,8%).

Các thử nghiệm lâm sàng pha II và pha III được tiến hành trong giai đoạn phát triển lâm sàng trên 2525 bệnh nhân trưởng thành & thanh thiếu niên điều trị với các liều khác nhau của bilastine, trong đó có 1697 bệnh nhân dùng bilastine 20mg. Trong các thử nghiệm này có 1362 bệnh nhân dùng giả dược.

Các phản ứng bất lợi của thuốc (ADRs) thường ghi nhận được trên bệnh nhân sử dụng bilastine 20mg để điều trị viêm mũi dị ứng và mày đay tự phát mạn tính là đau đầu, buồn ngủ, chóng mặt và mệt mỏi. Các phản ứng này xuất hiện với tần suất tương tự tần suất ghi nhận được trên bệnh nhân sử dụng giả dược.

Bảng tóm tắt phản ứng bất lợi của thuốc

Các phản ứng bất lợi ít nhất có thể liên quan đến bilastin và được báo cáo trong hơn 0,1% bệnh nhân dùng bilastin 20 mg trong giai đoạn phát triển lâm sàng của thuốc được phân loại dưới đây.

Tần suất ghi nhận như sau:

Rất phổ biến (ADR ≥ 1/10), phổ biến (1/100 ≤ ADR < 1/10), không phổ biến (1/1000 ≤ ADR < 1/100), hiếm gặp (1/10000 ≤ ADR < 1/1000) và rất hiếm gặp (ADR < 1/10000).

Không rõ (không thể ước tính được từ các dữ liệu hiện có).

Các phản ứng hiếm gặp, rất hiếm gặp và không rõ không được ghi vào bảng.

| Hệ cơ quan | | Bilastin 20mg N=1697 | Tất cả các liều của Bilastin N = 2525 |
|--|------------------------------|----------------------------|---|
| Tần suất | Phản ứng bất lợi | | |
| Nhiễm khuẩn và nhiễm độc | | | |
| <i>Không phổ biến</i> | <i>Herpes miệng</i> | 2 (0,12%) | 2 (0,08%) |
| Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng | | | |
| <i>Không phổ biến</i> | <i>Tăng cảm giác thèm ăn</i> | 10 (0,59%) | 11 (0,44%) |
| Rối loạn tâm lý | | | |
| <i>Không phổ biến</i> | <i>Lo lắng</i> | 6 (0,35%) | 8 (0,32%) |
| | <i>Mất ngủ</i> | 2 (0,12%) | 4 (0,16%) |
| Rối loạn ốc tai, tiền đình | | | |
| <i>Không phổ biến</i> | <i>Ù tai</i> | 2 (0,12%) | 2 (0,08%) |
| | <i>Chóng mặt</i> | 3 (0,18%) | 3(0,12%) |
| Rối loạn hệ thần kinh | | | |
| <i>Phổ biến</i> | <i>Buồn ngủ</i> | 52 (3,06%) | 82 (3,25%) |
| | <i>Đau đầu</i> | 68 (4,01%) | 90 (3,56%) |

| | | | |
|---|---|------------|------------|
| <i>Không phổ biến</i> | <i>Chóng mặt</i> | 14 (0,83%) | 23 (0,91%) |
| Rối loạn nhịp tim | | | |
| <i>Không phổ biến</i> | <i>Blốc nhánh phải</i> | 4 (0,24%) | 5 (0,20%) |
| | <i>Rối loạn nhịp xoang</i> | 5 (0,30%) | 5 (0,20%) |
| | <i>Kéo dài khoảng QT trên điện tâm đồ</i> | 9 (0,53%) | 10 (0,40%) |
| | <i>Bất thường khác trên điện tâm đồ</i> | 7 (0,41%) | 11 (0,44%) |
| Rối loạn hô hấp, lồng ngực và trung thất | | | |
| <i>Không phổ biến</i> | <i>Khó thở</i> | 2 (0,12%) | 2 (0,08%) |
| | <i>Khó chịu ở mũi</i> | 2 (0,12%) | 2 (0,08%) |
| | <i>Khô mũi</i> | 3 (0,18%) | 6 (0,24%) |
| Rối loạn tiêu hóa | | | |
| <i>Không phổ biến</i> | <i>Đau bụng trên</i> | 11 (0,65%) | 14 (0,55%) |
| | <i>Đau bụng</i> | 5 (0,30%) | 5 (0,20%) |
| | <i>Buồn nôn</i> | 7 (0,41%) | 10 (0,40%) |
| | <i>Kích ứng dạ dày</i> | 3 (0,18%) | 4 (0,16%) |
| | <i>Tiêu chảy</i> | 4 (0,24%) | 6 (0,24%) |
| | <i>Khô miệng</i> | 2 (0,12%) | 6 (0,24%) |
| | <i>Khó tiêu</i> | 2 (0,12%) | 4 (0,16%) |
| | <i>Viêm dạ dày</i> | 4 (0,24%) | 4 (0,16%) |
| Rối loạn da và mô mềm | | | |
| <i>Không phổ biến</i> | <i>Mẫn ngứa</i> | 2 (0,12%) | 4 (0,16%) |
| Rối loạn toàn thân | | | |
| <i>Không phổ biến</i> | <i>Mệt mỏi</i> | 14 (0,83%) | 19 (0,75%) |
| | <i>Khát</i> | 3 (0,18%) | 4 (0,16%) |
| | <i>Tăng tình trạng mệt mỏi sẵn có</i> | 2 (0,12%) | 2 (0,08%) |
| | <i>Sốt</i> | 2 (0,12%) | 3 (0,12%) |
| | <i>Suy nhược</i> | 3 (0,18%) | 4 (0,16%) |
| Các chỉ số xét nghiệm | | | |
| <i>Không phổ biến</i> | <i>Tăng gamma-glutamyltransferase</i> | 7 (0,41%) | 8 (0,32%) |
| | <i>Tăng alanin aminotransferase</i> | 5 (0,30%) | 5 (0,20%) |
| | <i>Tăng aspartat aminotransferase</i> | 3 (0,18%) | 3 (0,12%) |
| | <i>Tăng nồng độ creatinin trong máu</i> | 2 (0,12%) | 2 (0,08%) |
| | <i>Tăng nồng độ triglycerid trong máu</i> | 2 (0,12%) | 2 (0,08%) |
| | <i>Tăng cân</i> | 8 (0,47%) | 12 (0,48%) |

Mô tả phản ứng bất lợi ở bệnh nhân trưởng thành và thanh thiếu niên:

Các phản ứng bất lợi như buồn ngủ, đau đầu, hoa mắt chóng mặt và mệt mỏi đã được báo cáo ở cả nhóm điều trị với bilastine 20 mg hoặc với giả dược. Đối với phản ứng buồn ngủ, tần suất khi dùng bilastine là 3,06% trong khi đó giả dược là 2,86%; Đối với phản ứng đau đầu, tần suất khi dùng bilastine là 4,01% trong khi đó giả dược là 3,38%; Đối với phản ứng chóng mặt tần suất khi dùng bilastine là 0,83% trong khi đó giả dược là 0,59%; Đối với phản ứng mệt mỏi, tần suất khi dùng bilastine là 0,83% trong khi đó giả dược là 1,32%.

Các thông tin thu thập được từ dữ liệu hậu mãi đã khẳng định đặc tính an toàn quan sát được trong các nghiên cứu phát triển lâm sàng.

QUÁ LIỀU VÀ CÁCH XỬ TRÍ:

Không có dữ liệu sử dụng thuốc quá liều cho trẻ em.

Thông tin liên quan đến các trường hợp quá liều cấp của bilastine mới chỉ giới hạn trong các kết quả thử nghiệm lâm sàng ở người lớn trong giai đoạn phát triển thuốc và sau khi thuốc ra thị trường. Sau khi dùng bilastine với liều cao gấp 10 đến 11 lần liều điều trị (220 mg (liều đơn); hoặc 200 mg/ngày trong 7 ngày), tần suất xuất hiện các tác dụng không mong muốn trên người tình nguyện cao gấp 2 lần so với giả dược. Tác dụng không mong muốn được ghi nhận nhiều nhất là chóng mặt, nhức đầu và buồn nôn. Không ghi nhận phản ứng bất lợi nghiêm trọng nào cũng như sự kéo dài đáng kể khoảng QT trên diện tâm đồ.

Một nghiên cứu chéo thông qua thông số QT/QT hiệu chỉnh đã được tiến hành trên 30 người tình nguyện khỏe mạnh nhằm đánh giá tác động của bilastine liều lặp lại (100 mg x 4 ngày) lên sự tái phân cực tâm thất. Nghiên cứu đã chỉ ra rằng chế độ dùng nêu trên không làm kéo dài đáng kể giá trị QT hiệu chỉnh.

Trong trường hợp quá liều, cần áp dụng các biện pháp điều trị triệu chứng và điều trị hỗ trợ. Chưa có thuốc đối kháng đặc hiệu cho bilastine.

ĐẶC TÍNH DƯỢC LỰC HỌC:

Nhóm dược lý: Thuốc kháng histamin sử dụng đường toàn thân, các thuốc kháng histamin khác sử dụng đường toàn thân. Mã ATC: R06AX29

Cơ chế tác dụng:

Bilastine là chất đối kháng histamin không gây buồn ngủ, có tác dụng kéo dài, đối kháng chọn lọc trên thụ thể H_1 ngoại vi và không có ái lực với thụ thể muscarinic.

Bilastine ức chế các phản ứng mẫn ngứa, ban đỏ trên da do histamin trong vòng 24 giờ sau khi sử dụng một liều đơn.

Hiệu quả lâm sàng:

Trong các thử nghiệm lâm sàng được thực hiện trên người lớn và trẻ em vị thành niên; theo hướng dẫn, hiệu quả đã được chứng minh ở người lớn và thanh thiếu niên có thể được ngoại suy cho trẻ em, đã chứng minh rằng bilastine 10 mg dùng đường toàn thân cho trẻ em từ 6-11 tuổi với trọng lượng cơ thể nhỏ hơn 20 kg tương đương với liều người lớn bilastine 20 mg. Phép ngoại suy từ dữ liệu người lớn và thanh thiếu niên được coi là thích hợp cho sản phẩm này như là sinh lý bệnh của viêm giác mạc dị ứng và mày đay là giống nhau ở tất cả các nhóm tuổi.

Người lớn và thanh thiếu niên viêm mũi dị ứng (theo mùa hoặc quanh năm) dùng bilastine 20 mg một lần mỗi ngày trong 14-28 ngày, đem lại hiệu quả trong việc làm giảm các triệu chứng như hắt hơi, chảy nước mũi, ngứa mũi, ngạt mũi, chảy nước mắt và đỏ mắt. Bilastine kiểm soát hiệu quả các triệu chứng trong vòng 24 giờ.

Trong hai thử nghiệm lâm sàng được thực hiện trên bệnh nhân mày đay nguyên phát mãn tính, bilastine 20 mg, uống 1 lần/ngày trong 28 ngày chứng minh được hiệu quả làm giảm mức độ ngứa và giảm số lượng, kích thước của các vết sần cũng như cảm giác khó chịu của bệnh nhân do mày đay. Bệnh nhân cải thiện được chất lượng giấc ngủ và do đó, cải thiện chất lượng cuộc sống.

Không có trường hợp nào kéo dài khoảng QT hiệu chỉnh hoặc tác dụng không mong muốn trên tim mạch được ghi nhận trong các thử nghiệm lâm sàng của bilastine, ngay cả với liều 200 mg mỗi ngày (gấp 10 lần liều điều trị) trong vòng 7 ngày trên 9 bệnh nhân, hoặc thậm chí ngay cả khi cùng phối hợp với các thuốc ức chế P-gp, như ketoconazol (24 bệnh nhân) và erythromycin (24 bệnh nhân).

Thêm vào đó, một nghiên cứu theo dõi khoảng QT cũng đã được thực hiện trên 30 người tình nguyện.

Trong các thử nghiệm lâm sàng có kiểm soát, khi sử dụng liều khuyến cáo là 20 mg một lần/ngày, dữ liệu về tính an toàn trên hệ thần kinh trung ương của bilastine tương đương với giả dược và tỉ suất ghi nhận tình trạng buồn ngủ không khác biệt có ý nghĩa thống kê so với giả dược. Các thử nghiệm lâm sàng cho thấy bilastine với liều 40 mg một lần/ngày không ảnh hưởng đến hoạt tính tâm thần vận động cũng như khả năng lái xe được đánh giá qua một bài kiểm tra lái xe quy chuẩn. Người cao tuổi (≥ 65 tuổi) được lựa chọn trong một nghiên cứu pha II và pha III, kết quả cho thấy không có sự khác biệt trong hiệu quả cũng như độ an toàn khi so sánh với nhóm bệnh nhân trẻ tuổi hơn.

Tính an toàn lâm sàng:

Trong một thử nghiệm lâm sàng có kiểm soát kéo dài 12 tuần ở trẻ em từ 2 đến 11 tuổi bao gồm tổng cộng 509 trẻ em, trong đó có 260 trẻ em được điều trị bằng bilastine 10 mg mỗi ngày (gồm 58 trẻ em từ 2 đến dưới 6 tuổi, 105 trẻ em từ 6 đến dưới 9 tuổi và 97 trẻ em từ 9 đến dưới 12 tuổi) và 249 trẻ em dùng giả dược (gồm 58 trẻ em từ 2 đến dưới 6 tuổi, 95 trẻ em từ 6 đến dưới 9 tuổi và 96 trẻ em từ 9 đến dưới 12 tuổi), tác dụng không mong muốn gặp phải ở nhóm trẻ em được điều trị bằng bilastine là 5,8% và ở nhóm trẻ em dùng giả dược là 8,0%. Cả 2 nhóm đều có sự giảm nhẹ tỷ lệ buồn ngủ và an thần trong bảng câu hỏi về giấc ngủ ở trẻ em, không có sự khác biệt có ý nghĩa thống kê giữa 2 nhóm. Không có sự khác biệt đáng kể được quan sát thấy trong khoảng QTc giữa hai nhóm. Bảng câu hỏi về chất lượng cuộc sống ở trẻ em viêm mũi dị ứng hoặc mề đay mãn tính cho thấy có sự gia tăng số điểm trong 12 tuần mà không có sự khác biệt có ý nghĩa thống kê giữa hai nhóm. Trong tổng số 509 trẻ em được nghiên cứu bao gồm 479 trẻ em có viêm mũi dị ứng và 30 trẻ em mề đay mãn tính. Trong số những trẻ em này: 260 trẻ em được điều trị bằng bilastine (bao gồm 252 trẻ em (96,9%) có viêm mũi dị ứng và 8 trẻ em (3,1%) có mề đay mãn tính) và 249 trẻ em dùng giả dược (bao gồm 227 trẻ em (91,2%) có viêm mũi dị ứng và 22 trẻ em (8,8%) có mề đay mãn tính).

ĐẶC TÍNH DƯỢC ĐỘNG HỌC:

Hấp thu:

Bilastine được hấp thu nhanh sau khi uống và đạt nồng độ tối đa trong huyết tương sau khoảng 1,3 giờ. Thuốc không bị tích lũy. Giá trị sinh khả dụng đường uống trung bình của bilastine là 61%.

Phân bố:

Nghiên cứu *invitro* và *invivo* cho thấy bilastine là một cơ chất của P-gp (*Xem mục Tương tác, tương kỵ của thuốc trong phần tương tác với ketoconazol, erythromycin và diltiazem*) và cơ chất của OATP (*Xem mục Tương tác, tương kỵ của thuốc trong phần tương tác với nước bưởi chùm*).

Ở liều điều trị, tỉ lệ gắn với protein huyết tương của thuốc là 84-90%.

Chuyển hóa:

Kết quả các nghiên cứu *invitro* cho thấy bilastine không cảm ứng hoặc ức chế hoạt tính của CYP450.

Thải trừ:

Trong một nghiên cứu cân bằng khối được thực hiện trên người tình nguyện khỏe mạnh, sau khi uống một liều đơn 20 mg 14C-bilastine, gần như 95% liều dùng được tìm thấy trong nước tiểu (28,3%) và phân (66,5%) dưới dạng Bilastine không biến đổi, điều này cho thấy bilastine không được chuyển hóa nhiều trong cơ thể người. Thời gian bán thải trung bình tính trên người tình nguyện khỏe mạnh là 14,5 giờ.

Mức độ tuyến tính:

Bilastine biểu hiện mô hình dược động học tuyến tính trong khoảng liều nghiên cứu (5 đến 220 mg), với độ dao động nhỏ giữa các cá thể.

Suy thận:

Trong một nghiên cứu trên bệnh nhân suy thận, giá trị trung bình (SD) $AUC_{0-\infty}$ tăng từ 737,4 ($\pm 260,8$) ng x giờ/mL trên bệnh nhân có chức năng thận bình thường (độ lọc cầu thận > 80 ml/phút/1,73 m²) lên 967,4 ($\pm 140,2$) ng x giờ/mL trên bệnh nhân bị suy thận nhẹ (độ lọc cầu thận 50-80 ml/phút/1,73 m²), 1384,2 ($\pm 263,23$) ng x giờ/mL trên bệnh nhân suy thận trung bình (độ lọc cầu thận 30 - < 50 ml/phút/1,73 m²) và 1708,5 ($\pm 699,0$) ng x giờ/mL ở những đối tượng bị suy thận nặng (độ lọc cầu thận < 30 ml/ phút/1,73 m²).

Thời gian bán hủy trung bình (SD) của bilastine là 9,3 giờ ($\pm 2,8$) trên các bệnh nhân bình thường, 15,1 giờ ($\pm 7,7$) trên bệnh nhân suy thận nhẹ, 10,5 giờ ($\pm 2,3$) trên bệnh nhân suy thận trung bình và 18,4 giờ ($\pm 11,4$) trên bệnh nhân suy thận nặng. Sự bài tiết nước tiểu của bilastine được hoàn tất sau 48-72 giờ trên tất cả các đối tượng. Những thay đổi dược động học này không cho thấy sự ảnh hưởng rõ rệt trên lâm sàng trên sự an toàn của bilastine, do nồng độ thuốc trong huyết tương trong trường hợp bệnh nhân suy thận vẫn nằm trong khoảng điều trị.

Bệnh nhân suy gan:

Không có dữ liệu về dược động học trên bệnh nhân suy gan. Bilastine không được chuyển hóa ở người. Do các kết quả nghiên cứu trên bệnh nhân suy thận cho thấy đường thải trừ qua thận là đường thải trừ chính, quá trình bài xuất qua mật chỉ đóng góp một phần rất nhỏ vào sự thải trừ của bilastine. Sự thay đổi chức năng gan có thể không làm thay đổi đáng kể dược động học của bilastine trên lâm sàng.

Trẻ em

Dữ liệu dược động học ở trẻ em đã thu được trong một nghiên cứu dược động học pha II trên 31 trẻ từ 4 đến 11 tuổi bị viêm mũi dị ứng hoặc nổi mề đay mãn tính, dùng một lần mỗi ngày với viên bilastine 10 mg. Phân tích dược động học từ dữ liệu nồng độ thuốc trong huyết tương cho thấy rằng liều trẻ em dùng bilastine 10 mg mỗi ngày một lần cho kết quả phơi nhiễm toàn thân tương đương với liều 20 mg ở người lớn và thanh thiếu niên, là giá trị AUC trung bình 1014 ng * x giờ/mL cho trẻ em 6 đến 11 tuổi. Những kết quả này phần lớn nằm dưới ngưỡng an toàn dựa trên dữ liệu từ 80 mg một lần mỗi ngày ở người lớn theo dữ liệu an toàn của thuốc. Những kết quả này đã xác nhận sự lựa chọn của bilastine 10 mg mỗi ngày một lần là liều điều trị thích hợp cho dân số nhi trong độ tuổi từ 6 đến 11 tuổi với trọng lượng cơ thể ít nhất 20 kg.

QUY CÁCH ĐÓNG GÓI: Hộp 1 vi nhôm-nhôm x 10 viên; hộp 3 vi nhôm-nhôm x 10 viên; hộp 10 vi nhôm-nhôm x 10 viên.

ĐIỀU KIỆN BẢO QUẢN: Nhiệt độ không quá 30°C, tránh ẩm.

HẠN DÙNG: 36 tháng kể từ ngày sản xuất.

TIÊU CHUẨN CHẤT LƯỢNG: Tiêu chuẩn cơ sở.

NHÀ SẢN XUẤT:

CÔNG TY TNHH DƯỢC PHẨM BV PHARMA.

Địa chỉ: Số 18 đường Lê Thị Sọc, Ấp 2A, Xã Tân Thạnh Tây, Huyện Củ Chi, Thành Phố Hồ Chí Minh, Việt Nam.