



TỜ HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG THUỐC

HELAFAKIN

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

THÀNH PHẦN CÔNG THỨC: Mỗi viên nén phân tán trong miệng chứa:

Thành phần được chất:

Desloratadin5 mg

Thành phần tá dược: Lactose Anhydrous, Microcrystalline Cellulose, Mannitol, Acid citric khan, Crospovidone, Aspartame, Oxit sắt đỏ, Hương dâu, Sodium Stearyl Fumarate, Talc, Colloidal Silicon Dioxide.

DẠNG BẢO CHẾ: viên nén phân tán trong miệng.

Mô tả: Viên nén phân tán hình tròn, màu hồng nhạt, mùi thơm, vị ngọt.

CHỈ ĐỊNH:

Viêm mũi dị ứng: thuốc này được chỉ định để làm giảm các triệu chứng viêm mũi dị ứng trên mũi và ngoài mũi (theo mùa và lâu năm) ở bệnh nhân 12 tuổi trở lên.

Mây đay tự phát mãn tính: thuốc này được chỉ định để làm giảm triệu chứng ngứa, giảm số lượng và kích thước nổi mây đay, ở những bệnh nhân bị mây đay tự phát mãn tính từ 12 tuổi trở lên.

CÁCH DÙNG & LIỀU DÙNG:

Với người lớn và trẻ em từ 12 tuổi trở lên: liều khuyến cáo của thuốc này là 5 mg mỗi ngày. Ở bệnh nhân suy gan hoặc suy thận, liều khởi đầu 5 mg mỗi ngày được khuyến cáo dựa trên được động học.

Đặt viên trên lưỡi. Sự rã của viên xảy ra nhanh chóng. Dùng cùng hoặc không cùng với nước. Dùng thuốc ngay sau khi xé vỏ.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH:

Quá mẫn với desloratadin hoặc loratadin hoặc với bất cứ thành phần nào của thuốc.

CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG KHI DÙNG THUỐC:

Suy thận

Được động học của desloratadin khi dùng liều duy nhất 7,5mg được đánh giá ở bệnh nhân suy thận nhẹ (n=7, thanh thải creatinin 51-69 mL/phút/1,73m²), trung bình (n=6, thanh thải creatinin 34-43 mL/phút/1,73m²), và nặng (n=6, thanh thải creatinin 5-29 mL/phút/1,73m²) hoặc bệnh nhân chạy thận nhân tạo (n=6). Ở bệnh nhân suy thận nhẹ và trung bình, giá trị C_{max} và AUC trung bình tăng lần lượt khoảng 1,2 và 1,9 lần, so với người có chức năng thận bình thường. Ở bệnh nhân suy thận nặng hoặc cần chạy thận nhân tạo, giá trị C_{max} và AUC tăng lần lượt khoảng 1,7 và 2,5 lần. Thay đổi nhỏ trong nồng độ 3-hydroxydesloratadin được quan sát. Desloratadin và 3-hydroxydesloratadin ít bị loại bỏ bởi thẩm phân máu. Protein huyết tương liên kết với desloratadin và 3-hydroxydesloratadin không thay đổi ở bệnh nhân suy thận. Điều chỉnh liều cho bệnh nhân suy thận được khuyến cáo.

Suy gan

Được động học của desloratadin được đánh giá sau khi dùng liều duy nhất ở bệnh nhân suy gan nhẹ (n=4), trung bình (n=4) và nặng (n=4) được định nghĩa theo phân loại Child-Pugh về chức năng gan và 8 đối tượng có chức năng gan bình thường. Bệnh nhân suy gan, trừ trường hợp nặng, AUC tăng khoảng 2,4 lần so với người bình thường. Độ thanh thải biểu kiến đường uống của desloratadin ở bệnh nhân suy gan nhẹ, trung bình và nặng là 37%, 36% và 28% so với người bình thường. Sự tăng thời gian bán thải trung bình của desloratadin ở bệnh



nhân suy gan đã được quan sát. Với 3-hydroxydesloratadin, giá trị C_{max} và AUC trung bình với bệnh nhân suy gan không khác biệt có ý nghĩa thống kê với người có chức năng gan bình thường. Khuyến cáo điều chỉnh liều với bệnh nhân suy gan.

Chứng tộc

Sau 14 ngày dùng viên nén phân tán trong miệng desloratadin 5 mg, giá trị C_{max} và AUC của desloratadin lần lượt cao hơn 18% và 32% ở người da đen so với người da trắng. Với 3-hydroxydesloratadin, có sự giảm 10% giá trị C_{max} và AUC ở người da đen so với người da trắng. Sự khác nhau này dường như không có ý nghĩa lâm sàng và vì vậy không cần điều chỉnh liều.

Di truyền

Viên thuốc có chứa lactose (khan). Bệnh nhân có các rối loạn di truyền hiếm gặp như rối loạn dung nạp galactose, thiếu hụt lactase hoặc bất thường hấp thu glucose-galactose không nên sử dụng thuốc này.

Người cao tuổi

Các nghiên cứu lâm sàng về desloratadin không có đủ số lượng đối tượng từ 65 tuổi trở lên để xác định liệu họ có đáp ứng khác với các đối tượng trẻ hơn hay không. Các kinh nghiệm lâm sàng được báo cáo khác không xác định được sự khác biệt giữa bệnh nhân cao tuổi và bệnh nhân trẻ tuổi. Nói chung, việc lựa chọn liều cho bệnh nhân cao tuổi nên thận trọng, phản ánh mức độ suy giảm chức năng gan, thận hoặc tim và bệnh đồng thời hoặc điều trị bằng thuốc khác.

Trẻ em

An toàn và hiệu quả của thuốc này ở đối tượng trẻ em dưới 12 tuổi chưa được thiết lập.

Tá dược

Viên nén phân tán trong miệng HELAFKIN có chứa aspartame. Aspartame bị thủy phân tại ống tiêu hóa khi dùng đường uống. Một trong những sản phẩm thủy phân chính là phenylalanine, có thể gây hại trên những người bị phenylketon niệu. Chưa có bằng chứng phi lâm sàng hay lâm sàng đánh giá việc sử dụng aspartame cho trẻ sơ sinh dưới 12 tuần tuổi.

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

Phụ nữ có thai

Phân loại: C

Không có nghiên cứu đầy đủ và có đối chứng ở phụ nữ có thai. Vì các nghiên cứu về sinh sản trên động vật không phải lúc nào cũng dự đoán được phản ứng của con người, nên chỉ dùng desloratadin trong thời kỳ mang thai khi thật cần thiết.

Phụ nữ cho con bú

Desloratadin đi vào sữa mẹ, do đó cần đưa ra quyết định ngừng cho con bú hoặc ngừng desloratadin, xem xét tầm quan trọng của thuốc với mẹ.

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

Chưa có nghiên cứu về ảnh hưởng của thuốc lên khả năng lái xe, vận hành máy móc.

TƯƠNG TÁC, TƯƠNG Kỵ CỦA THUỐC:

Không có tương tác có ý nghĩa lâm sàng được ghi nhận trong các nghiên cứu sử dụng thuốc này đồng thời với erythromycin, azithromycin, ketoconazol, fluoxetin hoặc cimetidin.

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN CỦA THUỐC:

Viêm mũi dị ứng: Trong các thử nghiệm đa liều đối chứng với giả dược, 2834 bệnh nhân dùng viên nén phân tán trong miệng desloratadin 5mg với liều từ 2,5mg đến 20mg mỗi ngày,



trong đó 1655 bệnh nhân nhận liều khuyến cáo hàng ngày là 5mg. Ở những bệnh nhân dùng 5mg mỗi ngày, tỷ lệ các tác dụng ngoại ý là tương tự giữa thuốc này và những bệnh nhân điều trị bằng giả dược. Phần trăm bệnh nhân rút lui sớm do các tác dụng phụ là 2,4% ở nhóm dùng thuốc và 2,6% ở nhóm giả dược. Không có tác dụng phụ nghiêm trọng nào trong các thử nghiệm này ở bệnh nhân dùng desloratadin. Tất cả các tác dụng ngoại ý đã được báo cáo bởi nhiều hơn hoặc bằng 2% số bệnh nhân dùng liều khuyến cáo hàng ngày (5,0mg x 1 lần/ngày), và các tác dụng phụ phổ biến hơn với thuốc này so với giả dược, được liệt kê trong bảng sau:

Phản ứng bất lợi được báo cáo bởi $\geq 2\%$ bệnh nhân viêm mũi dị ứng trong thử nghiệm lâm sàng đa liều, có đối chứng giả dược

Phản ứng bất lợi	Viên nén phân tán trong miệng desloratadin 5mg (n=1.655)	Giả dược (n=1.652)
Viêm họng hạt	4,1%	2,0%
Khô miệng	3,0%	1,9%
Đau cơ	2,1%	1,8%
Mệt mỏi	2,1%	1,2%
Buồn ngủ	2,1%	1,8%
Đau bụng kinh	2,1%	1,6%

Tần suất và mức độ các bất thường trong xét nghiệm và điện tâm đồ tương tự giữa bệnh nhân dùng thuốc này và giả dược. Không có sự khác nhau về biến cố bất lợi giữa các phân nhóm bệnh nhân được xác định theo giới tính, tuổi tác hoặc chủng tộc.

Mày đay tự phát mãn tính: Trong các thử nghiệm lâm sàng có đối chứng giả dược, đa liều với bệnh mày đay tự phát mãn tính, 211 bệnh nhân dùng viên nén phân tán trong miệng desloratadin 5mg và 205 người dùng giả dược. Các biến cố bất lợi báo cáo bởi trên 2% bệnh nhân dùng thuốc này và nhiều hơn so với nhóm giả dược (tỉ lệ lần lượt giữa dùng thuốc, giả dược): đau đầu (14%, 13%), buồn nôn (5%, 2%), mệt mỏi (5%, 1%), chóng mặt (4%, 3%), viêm họng hạt (3%, 2%), khó tiêu (3%, 1%) và đau cơ (3%, 1%).

Các biến cố bất lợi tự phát sau đây đã được báo cáo trong khi hậu mãi: nhịp tim nhanh, và hiếm gặp phản ứng quá mẫn (như phát ban, ngứa, mày đay, phù, khó thở và phản vệ), và tăng enzym gan bao gồm bilirubin.

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:

Thông tin liên quan đến quá liều cấp tính có rất ít từ kinh nghiệm trong các thử nghiệm lâm sàng trong quá trình phát triển sản phẩm. Trong thử nghiệm khoảng liều, ở liều 10mg và 20mg/ngày, buồn ngủ đã được báo cáo.

Trong trường hợp quá liều, cân nhắc các phương pháp tiêu chuẩn để loại bỏ thuốc chưa hấp thu. Điều trị triệu chứng và hỗ trợ được khuyến cáo. Desloratadin và 3-hydroxydesloratadin không được thải trừ bằng thận phân.

ĐẶC TÍNH DƯỢC LỰC HỌC:

Nhóm dược lý: thuốc kháng histamin - chất đối kháng H_1

Mã ATC: R06AX27

Desloratadin là thuốc kháng histamin 3 vòng có hoạt tính kéo dài và cạnh tranh chọn lọc thụ thể histamin H_1 . Dữ liệu liên kết thụ thể cho thấy ở nồng độ 2 - 3 ng/mL (7 nanomol),



desloratadin cho thấy tương tác đáng kể với thụ thể histamin H_1 ở người. Desloratadin ức chế giải phóng histamin từ tế bào mast ở người trên *in vitro*.

Các kết quả nghiên cứu phân bố mô đánh dấu đồng vị ở chuột cống và nghiên cứu liên kết thụ thể có phối tử đồng vị H_1 ở chuột bạch cho thấy desloratadin không đi qua hàng rào máu não.

ĐẶC TÍNH DƯỢC ĐỘNG HỌC:

Hấp thu: Đặc tính dược động học của viên nén phân tán trong miệng desloratadin được đánh giá trong nghiên cứu bất chéo ba chiều trên 24 người tình nguyện trưởng thành. 1 viên nén phân tán trong miệng desloratadin 5 mg tương đương sinh học với 1 viên đối chiếu desloratadin 5 mg đối với cả desloratadin và 3-hydroxydesloratadin. Thức ăn và nước không ảnh hưởng đến sinh khả dụng (AUC và C_{max}) của viên nén phân tán trong miệng desloratadin.

Phân bố: Desloratadin và 3-hydroxydesloratadin liên kết với protein huyết tương lần lượt khoảng 82% - 87% và 85% - 89%. Liên kết với protein của desloratadin và 3-hydroxydesloratadin không bị thay đổi ở bệnh nhân suy giảm chức năng thận.

Chuyển hóa: Desloratadin (chất chuyển hóa chính của loratadin) được chuyển hóa mạnh thành chất có hoạt tính 3-hydroxydesloratadin, sau đó được glucuronid hóa. Enzym đảm nhiệm tạo thành 3-hydroxydesloratadin chưa được xác định. Dữ liệu từ các thử nghiệm lâm sàng cho thấy một nhóm nhỏ bệnh nhân có sự giảm khả năng tạo thành 3-hydroxydesloratadin, là những người chuyển hóa kém desloratadin. Trong các nghiên cứu dược động học ($n=3748$), có khoảng 6% đối tượng chuyển hóa kém desloratadin (được định nghĩa là người có tỉ lệ AUC của 3-hydroxydesloratadin/desloratadin nhỏ hơn 0,1 hoặc có thời gian bán thải desloratadin vượt quá 50 giờ). Các nghiên cứu dược động học này bao gồm đối tượng từ 2 đến 70 tuổi, trong đó 977 đối tượng từ 2 đến 5 tuổi, 1.575 đối tượng từ 6 đến 11 tuổi và 1.196 đối tượng từ 12 đến 70 tuổi. Không có sự khác biệt về tỷ lệ chuyển hóa kém giữa các nhóm tuổi. Tần suất chuyển hóa kém ở nhóm người da đen (17%, $n=988$) cao hơn so với người da trắng (2%, $n=1.462$) và người gốc Tây Ban Nha/Mỹ Latin (2%, $n=1.063$). Mức phơi nhiễm trung bình (AUC) với desloratadin ở những người chuyển hóa kém cao hơn khoảng 6 lần so với những người chuyển hóa bình thường. Đối tượng chuyển hóa kém không thể xác định trước và sẽ phơi nhiễm với nồng độ desloratadin cao hơn sau khi dùng liều khuyến cáo. Trong các nghiên cứu lâm sàng về an toàn khi dùng đa liều, 94 người chuyển hóa kém và 123 người chuyển hóa bình thường được ghi danh và điều trị bằng dung dịch uống desloratadin trong 15 - 35 ngày, không quan sát thấy sự khác biệt tổng thể về độ an toàn giữa người chuyển hóa kém và người chuyển hóa bình thường. Mặc dù vậy, không thể loại trừ nguy cơ gia tăng các biến cố bất lợi liên quan đến liều dùng những bệnh nhân chuyển hóa kém.

Thải trừ: Thời gian bán thải trung bình của desloratadin là 27 giờ. C_{max} và AUC tăng tỷ lệ với liều dùng sau khi uống một liều đơn từ 5 đến 20mg. Mức độ tích lũy sau 14 ngày dùng thuốc phù hợp với thời gian bán thải và tần suất dùng thuốc. Một nghiên cứu về cân bằng khối trên người đã ghi nhận thu hồi được khoảng 87% liều ^{14}C -desloratadin, được phân bố bằng nhau trong nước tiểu và phân dưới dạng các sản phẩm chuyển hóa. Phân tích 3-hydroxydesloratadin trong huyết tương cho thấy T_{max} và thời gian bán thải tương tự so với desloratadin.

QUY CÁCH ĐÓNG GÓI: Hộp 1 vỉ, 3 vỉ x 10 viên.

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



HẠN DÙNG: 24 tháng kể từ ngày sản xuất.

TIÊU CHUẨN CHẤT LƯỢNG: TCCS.

Sản xuất tại:

CÔNG TY CỔ PHẦN DƯỢC PHẨM CÔNG NGHỆ CAO ABIPHA

Địa chỉ: Lô đất CN-2, Khu công nghiệp Phú Nghĩa, Xã Phú Nghĩa,
Huyện Chương Mỹ, Thành phố Hà Nội, Việt Nam.

Website: www.abipha.com.vn

Điện thoại: 024.6262 7788