

Rx Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc

RUTADIN

Rupatadin 10 mg

Để thuốc xa tầm tay trẻ em.

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.

Thành phần: Mỗi viên nén chứa:

- Hoạt chất: Rupatadin (Dưới dạng Rupatadin fumarat).....10 mg.
- Tá dược: Tinh bột ngô, Lactose monohydrat, PVP K30, Natri starch glycolat, Magnesi stearat, Sunset yellow dye.

Dạng bào chế: Viên nén.

Chỉ định:

RUTADIN được dùng để điều trị triệu chứng của viêm mũi dị ứng và nổi mề đay ở người lớn và thanh thiếu niên trên 12 tuổi.

Liều lượng và cách dùng:

Người lớn và thanh thiếu niên trên 12 tuổi: Liều dùng khuyến cáo là 10 mg x 1 lần/ngày, dùng kèm hoặc không kèm với đồ ăn.

Người già: Cần thận trọng khi sử dụng rupertadin cho người già.

Trẻ em: Không sử dụng **RUTADIN** cho trẻ em dưới 12 tuổi.

Bệnh nhân suy thận hoặc suy gan: Do không có nghiên cứu lâm sàng được tiến hành trên bệnh nhân suy gan hoặc suy thận nên không nên dùng **RUTADIN** cho những bệnh nhân này.

Chống chỉ định:

RUTADIN chống chỉ định trên bệnh nhân quá mẫn với bất cứ thành phần nào của thuốc.

Cảnh báo và thận trọng khi dùng thuốc:

Không nên sử dụng rupertadin cùng với nước ép bưởi.

Nên tránh sử dụng đồng thời rupertadin cùng với các thuốc ức chế CYP3A4 mạnh và cần thận trọng khi dùng phối hợp với các thuốc ức chế CYP3A4 vừa phải.

Có thể cần phải điều chỉnh liều dùng của các cơ chất nhạy cảm CYP3A4 (ví dụ: Simvastatin, lovastatin) và các cơ chất CYP3A4 có chỉ số điều trị hẹp (ciclosporin, tacrolimus, sirolimus, everolimus, cisaprid) vì rupertadin có thể làm tăng nồng độ các thuốc này trong huyết tương.

Độ an toàn của rupertadin trên tim được đánh giá trong nghiên cứu chi tiết về QT/QTc. Dùng rupertadin với mức liều gấp 10 lần mức liều điều trị không gây ra bất kỳ ảnh hưởng nào lên ECG và không gây ra những sự gia tăng có liên quan tới độ an toàn của tim sau này. Tuy nhiên nên thận trọng khi sử dụng rupertadin cho những bệnh nhân bị kéo dài khoảng QT, bệnh nhân hạ kali máu chưa được điều trị, bệnh nhân đang bị rối loạn nhịp tim như là nhịp tim chậm đáng kể trên lâm sàng, thiếu máu cơ tim cấp tính.

Nên thận trọng khi sử dụng **RUTADIN** cho người già (từ 65 tuổi trở lên). Mặc dù không có sự khác biệt tổng thể về hiệu quả và độ an toàn đã được quan sát trên các thử nghiệm lâm sàng, nhưng không thể loại trừ được một số người già nhạy cảm hơn với thuốc.

Không được sử dụng **RUTADIN** cho trẻ em dưới 12 tuổi hoặc ở bệnh nhân suy thận hoặc suy gan.

Tá dược:

Thuốc có chứa tá dược lactose. Nên những bệnh nhân có vấn đề về di truyền hiếm gặp không dung nạp galactose, thiếu Lapp lactase hoặc kém hấp thu glucose-galactose, không nên sử dụng thuốc này.

Sunset yellow dye có thể gây ra các phản ứng dị ứng.

Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai và cho con bú:

Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai:

Hạn chế dữ liệu về việc sử dụng rupertadin cho phụ nữ có thai. Các nghiên cứu trên động vật không chỉ ra được các tác dụng có hại trực tiếp hoặc gián tiếp tới phụ nữ có thai, sự phát triển của phôi thai/thai nhi, quá trình sinh sản hoặc sự phát triển của trẻ sau khi sinh. Như một biện pháp dự phòng, nên tốt nhất là nên tránh sử dụng rupertadin cho phụ nữ mang thai.

Sử dụng thuốc cho phụ nữ cho con bú:

Rupertadin được bài tiết vào sữa động vật. Không biết liệu rupertadin có được bài tiết vào sữa mẹ hay không. Việc quyết định nên ngừng cho con bú hoặc ngừng/tránh việc điều trị với rupertadin nên được cân nhắc giữa lợi ích của việc cho con bú đối với trẻ và lợi ích của liệu pháp điều trị cho người phụ nữ.

Ảnh hưởng của thuốc lên khả năng lái xe, vận hành máy móc:

Rupertadin không ảnh hưởng tới khả năng lái xe và vận hành máy móc. Tuy nhiên cần thận trọng trước khi lái xe hoặc vận hành máy móc cho đến khi đã xác định đáp ứng của bệnh nhân đối với thuốc.

Tương tác, tương kỵ của thuốc:

Các nghiên cứu tương tác chỉ được thực hiện ở người lớn và thanh thiếu niên trên 12 tuổi.

Ảnh hưởng của các thuốc khác tới rupertadin

Sử dụng đồng thời với các thuốc ức chế CYP3A4 mạnh (ví dụ: Itraconazol, ketoconazol, voriconazol, posaconazol, thuốc ức chế protease HIV, clarithromycin, nefazodon) nên tránh và nên thận trọng khi sử dụng đồng thời với các thuốc ức chế CYP3A4 vừa phải (ví dụ: Erythromycin, fluconazol, diltiazem).

Sử dụng đồng thời 20 mg rupertadin với ketoconazol hoặc erythromycin làm tăng sự tiếp xúc toàn thân với rupertadin gấp 10 lần và 2-3 lần, tương ứng. Sự thay đổi này không liên quan tới tác dụng trên khoảng QT hoặc sự gia tăng tác dụng không mong muốn so với khi sử dụng các thuốc này riêng lẻ.

Tương tác với nước ép bưởi: Sử dụng đồng thời với nước ép bưởi làm tăng sự tiếp xúc toàn thân với rupertadin gấp 3,5 lần. Không nên dùng thuốc đồng thời với nước ép bưởi.

Ảnh hưởng của rupertadin tới các thuốc khác

Cần thận trọng khi dùng rupertadin cùng với các thuốc chuyển hóa khác có phạm vi điều trị hẹp vì còn hạn chế sự hiểu biết về ảnh hưởng của rupertadin tới các thuốc khác.

Tương tác với rượu: Sau khi sử dụng rượu, một liều rupertadin 10 mg sẽ gây các ảnh hưởng tới một số xét nghiệm về tâm thần vận động mặc dù không có sự khác biệt đáng kể ở những bệnh nhân chỉ sử dụng rượu. Mức liều 20 mg làm tăng sự suy yếu do uống rượu gây ra.

Tương tác với thuốc ức chế thần kinh trung ương: Giống với các thuốc kháng histamin khác, không thể loại trừ được sự tương tác với các thuốc ức chế thần kinh trung ương khác.

Tương tác với thuốc statin: Tăng CPK không triệu chứng đã được báo cáo là ít gặp trong các thử nghiệm lâm sàng của rupertadin. Nguy cơ tương tác với thuốc statin, một số thuốc trong đó cũng được chuyển hóa bởi isoenzym cytochrom P450 CYP3A4, chưa được biết. Vì những lý do này, nên thận trọng khi sử dụng rupertadin khi dùng chung với thuốc statin.

Tương kỵ của thuốc:

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):

Thường gặp, 1/10 >ADR ≥ 1/100

Thần kinh: Buồn ngủ, đau đầu, chóng mặt.

Tiêu hóa: Khô miệng.

Toàn thân: Mệt mỏi, suy nhược.

Ít gặp, $1/100 > ADR \geq 1/1000$

Nhiễm trùng và nhiễm ký sinh trùng: Viêm họng, viêm mũi.

Chuyển hóa và dinh dưỡng: Thèm ăn.

Thần kinh: Giảm sự tập trung.

Hô hấp: Chảy máu cam, khô mũi, ho, khô họng, đau hầu họng.

Tiêu hóa: Buồn nôn, đau bụng trên, tiêu chảy, khó tiêu, nôn, đau bụng, táo bón.

Da: Phát ban.

Cơ xương khớp: Đau lưng, đau khớp, đau cơ.

Toàn thân: Khát nước, bất an, sốt, dễ cáu.

Xét nghiệm: Tăng creatin phosphokinase máu, tăng alanin aminotransferase, tăng aspartat aminotransferase, bất thường trong các xét nghiệm đánh giá chức năng gan.

Hiếm gặp, $1/1000 > ADR \geq 1/10000$

Hệ miễn dịch: Phản ứng quá mẫn cảm (bao gồm phản ứng phản vệ, phù mạch và nổi mề đay).

Tim: Nhịp tim nhanh và đánh trống ngực.

Quá liều và cách xử trí:

Chưa có trường hợp quá liều nào được báo cáo. Trong một nghiên cứu lâm sàng sử dụng rupatadin ở mức liều 100 mg/ngày trong 6 ngày được dung nạp tốt. Tác dụng không mong muốn thường gặp nhất là buồn ngủ. Nếu vô tình uống thuốc quá liều thì nên tiến hành điều trị triệu chứng kết hợp với điều trị hỗ trợ.

Đặc tính dược lực học:

Nhóm dược lý: Thuốc kháng histamin, mã ATC: *R06A X28*.

Rupatadin là thuốc kháng histamin thế hệ 2, đối kháng histamin tác dụng kéo dài cùng với tác dụng đối kháng chọn lọc trên thụ thể H_1 ngoại biên. Một số chất chuyển hóa (desloratadin và các chất chuyển hóa hydroxyl vẫn còn hoạt tính kháng histamin và có thể sẽ góp phần vào tác dụng toàn phần của thuốc).

Trong các nghiên cứu *in vitro*, rupatadin ở nồng độ cao ức chế sự kết tập của tế bào mast gây ra bởi các kích thích miễn dịch và không miễn dịch, cũng như gây giải phóng cytokin, đặc biệt là $TNF\alpha$ trong các tế bào mast và các monocyte. Phát hiện lâm sàng từ các số liệu thực nghiệm theo dõi được vẫn còn cần được xác nhận.

Các thử nghiệm lâm sàng trên những người tình nguyện ($n = 375$) và các bệnh nhân ($n = 2650$) bị viêm mũi dị ứng và nổi mề đay tự phát mạn tính cho thấy khi dùng rupatadin ở mức liều từ 2 - 100 mg không quan sát thấy ảnh hưởng đáng kể trên điện tim đồ.

Do đặc điểm sinh lý bệnh cơ bản là như nhau, đồng thời, bệnh nhân mạn tính có thể dễ dàng phục hồi về sau, người ta đã sử dụng chứng nổi mề đay tự phát mạn tính làm mô hình nghiên cứu lâm sàng, bất kể nguyên nhân gây bệnh. Vì sự giải phóng histamin là yếu tố gây nổi mề đay nên rupatadin được cho là có tác dụng làm giảm triệu chứng trong các tình trạng nổi mề đay khác cũng như tình trạng nổi mề đay tự phát mạn tính theo các hướng dẫn lâm sàng.

Trong một thử nghiệm lâm sàng có đối chứng trên bệnh nhân nổi mề đay tự phát mạn tính, rupatadin có tác dụng làm giảm ngứa sau 4 tuần điều trị (giảm ngứa khi dùng rupatadin là 57,5%, so với khi dùng giả dược là 44,9%) và giảm số lượng trung bình bệnh nhân bị ngứa, đồ da khi dùng rupatadin là 54,3% và khi dùng giả dược là 39,7%.

Đặc tính dược động học:

Hấp thu và sinh khả dụng

Rupatadin được hấp thu nhanh chóng sau khi uống. Thời gian đạt nồng độ thuốc tối đa trong máu trung bình khoảng 0,75 giờ sau khi uống. C_{max} trung bình là 2,6 ng/ml sau khi uống một liều đơn 10 mg và 4,6 ng/ml khi uống liều đơn 20 mg. Dược động học của rupatadin tuyến tính với liều dùng trong mức liều từ 10 – 40 mg. Sau khi uống 10 mg/lần/ngày trong 7 ngày, C_{max} trung bình là 3,8 ng/ml. Nồng độ thuốc trong huyết tương giảm theo hàm mũ bậc 2 với thời gian bán thải là 5,9 giờ. Tỷ lệ rupatadin liên kết với protein huyết tương là 98,5 - 99%. Hiện vẫn chưa có dữ liệu về sinh khả dụng tuyệt đối của rupatadin do rupatadin chưa được chỉ định theo đường tiêm tĩnh mạch trên người.

Ảnh hưởng của thức ăn

Thức ăn làm tăng sự tiếp xúc toàn thân (diện tích dưới đường cong, AUC) với rupatadin khoảng 23%. Mức tiếp xúc với một trong các chất chuyển hóa có hoạt tính của thuốc và với chất chuyển hóa chính không có hoạt tính hầu như giống nhau (giảm khoảng 5% đối với chất chuyển hóa có hoạt tính và giảm khoảng 3% đối với chất chuyển hóa không có hoạt tính). Thời gian cần để đạt đến nồng độ rupatadin tối đa trong huyết tương (t_{max}) chậm lại 1 giờ. Nồng độ tối đa trong huyết tương (C_{max}) không bị ảnh hưởng bởi thức ăn. Những sự khác biệt này không có ý nghĩa lâm sàng.

Chuyển hóa và thải trừ

Trong một nghiên cứu về thải trừ thuốc ở người (40 mg 14C - rupatadin), 34,6% lượng chất đánh dấu phóng xạ được tìm thấy trong nước tiểu, còn trong phân là 60,9% ở các mẫu thu được sau 7 ngày. Rupatadin khi được dùng theo đường uống bị chuyển hóa đáng kể trước khi vào tuần hoàn máu. Lượng hoạt chất không bị biến đổi được tìm thấy trong phân và nước tiểu là không đáng kể. Nghĩa là rupatadin gần như bị chuyển hóa hoàn toàn. Các nghiên cứu chuyển hóa *in vitro* trên tế bào gan người chỉ ra rằng rupatadin chủ yếu được chuyển hóa bởi Cytochrom P450 (CYP 3A4).

Dược động học trên các nhóm bệnh nhân đặc biệt

Trong một nghiên cứu trên người tình nguyện khỏe mạnh để so sánh kết quả giữa người trẻ tuổi và người cao tuổi giá trị diện tích dưới đường cong và nồng độ thuốc tối đa trong máu của rupatadin ở người cao tuổi lớn hơn so với người trẻ tuổi. Điều này có thể do ở người cao tuổi, chuyển hóa lần đầu qua gan giảm. Người ta không quan sát được sự khác biệt này khi phân tích với những chất chuyển hóa khác của thuốc. Thời gian bán thải trung bình của rupatadin ở người cao tuổi và người trẻ tuổi tương ứng là 8,7 giờ và 5,9 giờ. Những kết quả này của rupatadin và các chất chuyển hóa không tạo ra khác biệt có ý nghĩa về mặt lâm sàng nên có thể kết luận hiệu chỉnh liều khi dùng liều 10 mg cho người cao tuổi là không cần thiết.

Điều kiện bảo quản:

Bảo quản thuốc ở nơi khô thoáng, nhiệt độ dưới 30°C, tránh ánh sáng.

Hạn dùng của thuốc:

36 tháng kể từ ngày sản xuất.

Tiêu chuẩn:

Tiêu chuẩn cơ sở.

Nhà sản xuất:

CÔNG TY CP US PHARMA USA

Lô B1 – 10, Đường D2, Khu công nghiệp Tây Bắc Củ Chi – TP. Hồ Chí Minh – Việt Nam.

Mọi thắc mắc và thông tin chi tiết, xin liên hệ số điện thoại 028-37908860