

Rx Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc



Viên nén
DCL-Betahistin 8mg

Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc

Để xa tầm tay của trẻ em.

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.

1. THÀNH PHẦN, HÀM LƯỢNG CỦA THUỐC:

Mỗi viên nén DCL-Betahistin 8mg có chứa:

Thành phần hoạt chất: Betahistin dihydroclorid 8 mg

Thành phần tá dược: Povidon K30, Cellulose vi tinh thể PH101, Mannitol, Acid citric monohydrat, Sodium starch glycolat, Silicon dioxyd, Talc, Acid stearic.

2. DẠNG BẢO CHẾ: Viên nén.

Mô tả sản phẩm: Viên nén tròn màu trắng, hai mặt trơn, cạnh và mặt viên không sứt mẻ.

3. CHỈ ĐỊNH:

Betahistin được chỉ định để điều trị hội chứng Ménière, các triệu chứng có thể bao gồm chóng mặt, ù tai, giảm thính lực và buồn nôn.

4. CÁCH DÙNG VÀ LIỀU DÙNG:

Cách dùng: Dùng đường uống. Uống thuốc tốt nhất trong bữa ăn hoặc sau bữa ăn với một ly nước.

Liều dùng:

Người lớn:

- Liều khởi đầu: Betahistin 16 mg x 3 lần/ngày.

- Liều duy trì: Betahistin khoảng 24 đến 48 mg/ngày. Liều dùng nên được thay đổi tùy theo đáp ứng lâm sàng.

Đối với trẻ em: Không khuyến cáo dùng cho trẻ dưới 18 tuổi do chưa có đầy đủ dữ liệu về an toàn và hiệu quả.

Đối với người già: Mặc dù dữ liệu nghiên cứu lâm sàng còn giới hạn ở nhóm bệnh nhân này, kinh nghiệm sau khi dùng thuốc rộng rãi cho thấy cần điều chỉnh liều ở nhóm bệnh nhân này.

Người bị suy thận: Chưa có thử nghiệm lâm sàng cụ thể nào ở nhóm bệnh nhân này, nhưng theo kinh nghiệm sau khi dùng thuốc, không cần điều chỉnh liều ở nhóm bệnh nhân này.

Người bị suy gan: Chưa có thử nghiệm lâm sàng cụ thể nào ở nhóm bệnh nhân này, nhưng theo kinh nghiệm sau khi dùng thuốc, không cần điều chỉnh liều ở nhóm bệnh nhân này.

5. CHỐNG CHỈ ĐỊNH:

Quá mẫn với betahistin dihydroclorid và bất kỳ thành phần nào của thuốc.

Betahistin chống chỉ định ở những bệnh nhân bị u tế bào ưa crôm. Vì betahistin là một chất tổng hợp tương tự histamin, nó có thể gây ra sự giải phóng catecholamine từ khối u dẫn đến tăng huyết áp nghiêm trọng.

6. CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG KHI DÙNG THUỐC:

Cần thận trọng khi điều trị cho bệnh nhân bị loét dạ dày tá tràng hoặc có tiền sử loét dạ dày tá tràng vì chứng khó tiêu thỉnh thoảng gặp ở bệnh nhân uống betahistin.

Bệnh nhân hen phế quản và loét dạ dày tá tràng cần được theo dõi cẩn thận trong quá trình điều trị bằng betahistin.

Cần thận trọng khi kê đơn betahistin cho bệnh nhân bị mày đay, phát ban hoặc viêm mũi dị ứng, vì khả năng làm trầm trọng thêm các triệu chứng này.

Cần thận trọng ở những bệnh nhân bị hạ huyết áp nặng.

Betahistin không phải là phương pháp điều trị thích hợp cho các bệnh lý sau:

- Chóng mặt kịch phát lành tính,
- Chóng mặt liên quan đến bệnh lý hệ thần kinh trung ương.

Thận trọng khi sử dụng

Uống thuốc vào giữa bữa ăn giúp tránh bị đau dạ dày.

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

Thời kỳ mang thai:

Không có dữ liệu đầy đủ về việc sử dụng betahistin ở phụ nữ có thai.

Các nghiên cứu trên động vật chưa đầy đủ về ảnh hưởng đối với quá trình mang thai, sự phát triển của phôi thai/bào thai, quá trình sinh nở và phát triển sau khi sinh, những nguy cơ tiềm ẩn ở người chưa biết. Biện pháp phòng ngừa, tốt nhất là tránh sử dụng betahistin trong thời kỳ mang thai.

Thời kỳ cho con bú:

Người ta chưa biết liệu betahistin có bài tiết qua sữa mẹ hay không. Betahistin bài tiết qua sữa chuột. Ảnh hưởng sau sinh trong các nghiên cứu trên động vật còn giới hạn ở liều lượng rất cao. Cần cân nhắc tầm quan trọng của thuốc đối với người mẹ so với lợi ích của việc cho con bú và nguy cơ có thể xảy ra đối với trẻ.

Khả năng sinh sản:

Các nghiên cứu trên động vật không cho thấy có ảnh hưởng đến khả năng sinh sản ở chuột.

8. ẢNH HƯỞNG CỦA THUỐC LÊN KHẢ NĂNG LÁI XE VÀ VẬN HÀNH MÁY MÓC:

Chóng mặt, ù tai và mất thính lực liên quan đến hội chứng Ménière có ảnh hưởng tiêu cực đến khả năng lái xe và sử dụng máy móc. Trong các nghiên cứu lâm sàng được thiết kế đặc biệt để điều tra khả năng lái xe và sử dụng máy móc, betahistin không có hoặc có tác dụng không đáng kể.

9. TƯƠNG TÁC, TƯƠNG Kỵ CỦA THUỐC:

Không có trường hợp nào được chứng minh về tương tác nguy hiểm

Chưa có nghiên cứu tương tác *in vitro* nào được thực hiện. Dựa trên dữ liệu *in vitro*, không có sự ức chế *in vitro* nào đối với enzyme Cytochrome P450.

Mặc dù về mặt lý thuyết có thể dự đoán được sự đối kháng giữa Betahistin và thuốc kháng histamin, nhưng không có tương tác nào như vậy được báo cáo.

Có một trường hợp báo cáo về sự tương tác giữa ethanol và hợp chất chứa pyrimethamin với dapson và một báo cáo khác về tác dụng phụ tăng cường của betahistin với salbutamol.

Dữ liệu *in vitro* cho thấy sự ức chế chuyển hóa betahistin bởi các loại thuốc ức chế monoamino-oxidase (MAO) bao gồm phân nhóm MAO-B (ví dụ: selegilin). Cần thận trọng khi sử dụng đồng thời các chất ức chế betahistin và MAO (bao gồm cả MAO-B chọn lọc).

Betahistin là một chất tương tự histamin, việc sử dụng đồng thời với các thuốc đối kháng H1 có thể làm giảm tác dụng lẫn nhau của thuốc.

10. TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN:

Các tác dụng không mong muốn sau đây đã xảy ra với tần suất được chỉ định dưới đây ở những bệnh nhân được điều trị bằng betahistin trong các thử nghiệm lâm sàng có đối chứng với giả dược [rất phổ biến ($\geq 1/10$); phổ biến ($\geq 1/100$ đến $< 1/10$); không phổ biến ($\geq 1/1.000$ đến $< 1/100$); hiếm ($\geq 1/10.000$ đến $< 1/1.000$); rất hiếm ($< 1/10.000$)].

Rối loạn tiêu hóa:

Thường gặp: Buồn nôn và khó tiêu.

Rối loạn thần kinh:

Thường gặp: Nhức đầu.

Ngoài những tác dụng phụ được báo cáo trong quá trình thử nghiệm lâm sàng, các tác dụng không mong muốn sau đây đã được báo cáo một cách tự phát trong quá trình sử dụng thuốc sau khi thuốc lưu hành và trong các tài liệu khoa học. Tần số không thể được ước tính từ dữ liệu có sẵn và do đó được phân loại là "không được biết".

Rối loạn hệ thống miễn dịch:

Các phản ứng quá mẫn, ví dụ như phản vệ đã được báo cáo.

Rối loạn tiêu hóa:

Các biểu hiện tiêu hóa nhẹ (ví dụ như nôn mửa, đau đường tiêu hóa, chướng bụng và đầy hơi) đã được quan sát thấy. Những biểu hiện này thường có thể được giải quyết bằng cách dùng liều trong bữa ăn hoặc bằng cách giảm liều.

Rối loạn da và mô dưới da:

Các phản ứng quá mẫn ở da và dưới da đã được báo cáo, đặc biệt là phù mạch, mày đay, phát ban và ngứa.

Báo cáo các phản ứng có hại nghi ngờ:

Báo cáo các tác dụng không mong muốn còn nghi ngờ sau khi thuốc được cấp phép lưu hành là quan trọng. Điều này cho phép tiếp tục theo dõi cân bằng giữa lợi ích/nguy cơ của thuốc. Các chuyên gia chăm sóc sức

không được yêu cầu báo cáo bất kỳ các tác dụng không mong muốn nghi ngờ nào và các thông tin an toàn và hiệu quả của thuốc qua trang Trung tâm DI & ADR Quốc gia và Trung tâm DI & ADR TP. Hồ Chí Minh.

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

11. QUÁ LIỀU VÀ CÁCH XỬ TRÍ:

Quá liều:

Một vài trường hợp quá liều đã được báo cáo. Một số bệnh nhân có các triệu chứng nhẹ đến trung bình khi dùng liều lên đến 640 mg (ví dụ: buồn nôn, buồn ngủ, đau bụng). Các biến chứng nghiêm trọng hơn (ví dụ như co giật, biến chứng phổi hoặc tim) đã được quan sát thấy trong các trường hợp cố ý dùng quá liều betahistin, đặc biệt là khi kết hợp với các thuốc quá liều khác.

Cách xử trí quá liều:

Không có thuốc giải độc đặc hiệu cho betahistin dihydroclorid. Nên rửa dạ dày và điều trị triệu chứng. Điều trị quá liều nên bao gồm các biện pháp hỗ trợ cơ bản.

12. ĐẶC TÍNH DƯỢC LỰC HỌC:

Nhóm dược lý trị liệu: Thuốc điều trị chóng mặt.

Mã ATC: N07CA01.

Cơ chế tác động:

Cơ chế tác động của betahistin chỉ được hiểu một phần. Có một số giả thuyết hợp lý hỗ trợ bởi các nghiên cứu trên động vật và dữ liệu trên người.

- Betahistin ảnh hưởng đến hệ thống tiết histamin: Betahistin có 2 cơ chế tác động, là một chất chủ vận thụ thể histamin H1 một phần và cũng là một chất đối kháng thụ thể histamin H3 nằm trong mô tế bào thần kinh, và có hoạt tính không đáng kể trên thụ thể H2. Betahistin làm tăng chuyển hóa và phóng thích histamin bằng cách ngăn chặn các thụ thể H3 tiền synap và gây ra cảm ứng điều hòa giảm thụ thể H3.

Betahistin dihydroclorid là một loại thuốc giống histamin, trong đó hoạt tính dược lý có thể được quy cho một tác dụng cụ thể và/hoặc ảnh hưởng trực tiếp hơn đến cơ chế phục hồi của nhân tiền đình. Nó có hoạt tính chủ vận tại thụ thể histamin H1 yếu và có hoạt tính đối kháng H3 trung bình; các cơ quan thụ cảm. Tác dụng đối kháng của betahistin dihydroclorid tại thụ thể H3: có thể cho thấy tăng cường giải phóng histamin tiền synap trong *in vitro* bằng cách ngăn chặn phản hồi ức chế tự động tại các đầu cuối tiết histamin, tác dụng của nó trên tế bào nhân tiền đình trung gian là để làm giảm đáng kể khả năng đáp ứng của chúng với histamin. Tác dụng này của betahistin dihydroclorid xảy ra tại các thụ thể H1 sau synap, vì betahistin dihydroclorid không có bất kỳ tác dụng nào tại các thụ thể H2. Do đó, tác dụng của betahistin dihydroclorid phù hợp với tác dụng chủ vận một phần tại các thụ thể này, betahistin dihydroclorid có ít tác dụng kích thích tự nó nhưng làm giảm các đáp ứng hưng phấn đối với histamin bằng cách chiếm các vị trí của thụ thể H1.

Đáp ứng giảm của các tế bào nhân tiền đình trung gian đối với histamin khi có hiện diện betahistin dihydroclorid có thể là kết quả của việc hoạt hóa các con đường thông tin thứ hai kết hợp với thụ thể H2 riêng chứ không phải là sự hoạt hóa bình thường của cả hai hệ thống thông tin thứ hai H1 và H2 với nhau.

Do đó, sự kích thích đồng thời của con đường thụ thể H1 và H2 được biết là gây ra sự khuếch đại lớn đáp ứng cAMP của tế bào, trên đó gây ra bởi sự kích thích của con đường thụ thể H2 riêng. Sự giảm biên độ và tổng hợp thời gian của kích thích do histamin gây ra trong tế bào nhân tiền đình trung gian khi có mặt betahistin dihydroclorid là gợi ý về một cơ chế như vậy. Tác dụng chủ vận một phần này của betahistin dihydroclorid tại thụ thể H1 có thể là một phần quan trọng trong cơ chế hoạt động của nó.

- Betahistin có thể làm tăng lưu lượng máu đến vùng ốc tai cũng như đến toàn bộ não: Thử nghiệm được lý trên động vật cho thấy tuần hoàn máu trong các vân mạch của tai trong được cải thiện, có thể là do sự giãn của các cơ vòng tiền mao mạch của vi tuần hoàn tai trong. Betahistin cũng được chứng minh là làm tăng lưu lượng tuần hoàn máu não ở người.
- Betahistin hỗ trợ điều chỉnh tiền đình: Betahistin đẩy nhanh quá trình phục hồi tiền đình sau khi cắt dây thần kinh một bên ở động vật, bằng cách thúc đẩy và hỗ trợ điều chỉnh tiền đình trung ương; tác dụng này được đặc trưng bởi sự điều hòa tăng chuyển hóa và phóng thích histamin, được thực hiện qua trung gian đối kháng thụ thể H3. Ở người, thời gian phục hồi sau khi cắt dây thần kinh tiền đình cũng giảm khi điều trị bằng betahistin.
- Betahistin làm thay đổi quá trình kích hoạt tế bào thần kinh trong nhân tiền đình: Betahistin cũng được tìm thấy có tác dụng ức chế phụ thuộc vào liều lượng đối với sự tạo ra các đột biến của tế bào thần kinh ở nhân tiền đình bên và giữa. Các đặc tính dược lực học đã được chứng minh trên động vật có thể góp phần vào lợi ích điều trị của betahistin trên hệ thống tiền đình. Hiệu quả của betahistin đã được chứng minh trong các nghiên cứu ở bệnh nhân chóng mặt do tiền đình và bệnh Ménière như đã được chứng minh bằng sự cải thiện về mức độ nghiêm trọng và tần suất của các cơn chóng mặt.

13. ĐẶC TÍNH DƯỢC ĐỘNG HỌC:

Hấp thu:

Betahistin dihydroclorid được hấp thu dễ dàng và gần như hoàn toàn sau khi uống và nồng độ đỉnh trong huyết tương của betahistin dihydroclorid được đánh dấu ^{14}C đạt được một giờ sau khi uống ở các đối tượng nhịn ăn. Sau hấp thu, thuốc chuyển hóa gần như hoàn toàn và nhanh chóng thành acid 2-pyridylaxetic. Nồng độ betahistin trong huyết tương rất thấp. Do đó, các phân tích dược động học dựa trên các phép đo 2-PAA trong huyết tương và nước tiểu.

Trong điều kiện ăn no, Cmax thấp hơn do với điều kiện nhịn ăn. Tuy nhiên, tổng mức hấp thu betahistin là tương tự nhau trong cả hai điều kiện, cho thấy rằng lượng thức ăn chỉ làm chậm quá trình hấp thu betahistin.

Phân bố:

Tỷ lệ betahistin liên kết với protein huyết tương dưới 5%.

Chuyển dạng sinh học:

Sau khi hấp thu, betahistin được chuyển hóa nhanh chóng và gần như hoàn toàn thành 2-PAA (không có hoạt tính dược lý). Sau khi uống betahistin, nồng độ 2-PAA trong huyết tương (và nước tiểu) đạt tối đa 1 giờ sau khi uống và giảm dần với thời gian bán thải khoảng 3,5 giờ.

Thải trừ:

2-PAA được bài tiết dễ dàng qua nước tiểu. Trong khoảng liều từ 8 đến 48 mg, khoảng 85% liều ban đầu được phục hồi trong nước tiểu. Sự bài tiết betahistin qua thận hoặc qua phân ít.

Betahistin dihydroclorid được thải trừ qua thận với 85 - 90% hoạt tính phóng xạ của liều 8 mg xuất hiện trong nước tiểu trong 56 giờ. Tốc độ bài tiết tối đa đạt được trong vòng 2 giờ sau khi dùng. Nồng độ thuốc gốc trong huyết tương dưới giới hạn phát hiện định lượng.

Do đó, khả dụng sinh học đã được đánh giá từ sự bài tiết qua nước tiểu của chất chuyển hóa chính của betahistin, acid 2-pyridylacetic.

Chưa có bằng chứng về chuyển hóa tiền hệ thống. Sự bài tiết qua mật không quan trọng như một con đường thải trừ thuốc hoặc các chất chuyển hóa của nó ở chuột và ít có khả năng xảy ra ở người.

Tính tuyến tính:

Tỷ lệ hồi phục không đổi trong khoảng liều uống 8 - 48 mg cho thấy được động học của betahistin tuyến tính, và cho thấy rằng con đường chuyển hóa liên quan không bão hòa.

14. QUI CÁCH ĐÓNG GÓI:

- Hộp 5 vi, 10 vi (PVdC-alu) x 10 viên nén; Hộp 5 vi (PVdC-alu) x 20 viên nén.

15. ĐIỀU KIỆN BẢO QUẢN, HẠN DÙNG, TIÊU CHUẨN CHẤT LƯỢNG CỦA THUỐC:

- **Bảo quản:** Nơi khô mát, nhiệt độ dưới 30°C, tránh ánh sáng.
- **Hạn dùng:** 36 tháng kể từ ngày sản xuất.
- **Tiêu chuẩn chất lượng:** Tiêu chuẩn cơ sở.

16. TÊN, ĐỊA CHỈ CỦA CƠ SỞ SẢN XUẤT THUỐC:

CÔNG TY CỔ PHẦN DƯỢC PHẨM CỬU LONG

Địa chỉ: Số 150, Đường 14/9, Phường 5, Thành phố Vĩnh Long, Tỉnh Vĩnh Long

Điện thoại: 0270 3822533

