



Rx_Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc

HISBILAS

Viên nén Bilastine 20 mg

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng

Để xa tầm tay trẻ em

Thông báo ngay cho bác sĩ hoặc dược sĩ những tác dụng không mong muốn gặp phải khi sử dụng thuốc

Sử dụng thuốc có dạng bào chế và hàm lượng thích hợp với liều được chỉ định

THÀNH PHẦN VÀ HÀM LƯỢNG

Mỗi viên nén có chứa:

Hoạt chất:

Bilastine.....20 mg

Tá dược vừa đủ: Silicified microcrystalline cellulose, microcrystalline cellulose 102, sodium starch glycolate (type A), colloidal silicon dioxide, magnesium stearate.

DẠNG BÀO CHẾ

Viên nén màu trắng đến trắng ngà, hình oval, hai mặt khum và có vạch ngang, cạnh và thành viên lành lặn. Không bể đôi viên thuốc.

CHỈ ĐỊNH

Điều trị triệu chứng cho người lớn và trẻ em từ 12 tuổi trở lên trong trường hợp viêm mũi dị ứng (quanh năm hoặc theo mùa) và mày đay.

LIỀU DÙNG VÀ CÁCH DÙNG

Liều dùng

Người lớn và trẻ em từ 12 tuổi trở lên

Liều dùng 20 mg (1 viên nén) x 1 lần/ngày để điều trị triệu chứng viêm mũi dị ứng (quanh năm hoặc theo mùa) và mày đay.

Nên uống thuốc vào 1 giờ trước hoặc 2 giờ sau khi ăn hoặc uống nước ép trái cây.

Thời gian điều trị

Trong viêm mũi dị ứng, điều trị chỉ giới hạn trong khoảng thời gian có tiếp xúc với yếu tố dị nguyên. Điều trị viêm mũi dị ứng theo mùa có thể ngừng thuốc sau khi các triệu chứng được giải quyết và sử dụng lại khi triệu chứng xuất hiện trở lại. Viêm mũi dị ứng quanh năm có thể điều trị liên tục trong suốt thời gian tiếp xúc với dị nguyên. Đối với mày đay, thời gian điều trị phụ thuộc vào dạng mày đay, thời gian và diễn biến của các triệu chứng.

Đối tượng đặc biệt

Trẻ em

- Trẻ em từ 6 đến 11 tuổi có cân nặng ít nhất 20 kg: Sử dụng dạng bào chế thích hợp như viên nén phân tán trong miệng 10 mg.
- Trẻ em dưới 6 tuổi và cân nặng dưới 20 kg: Dữ liệu sẵn có tham khảo ở mục Cảnh báo và thận trọng khi dùng thuốc, Tác dụng không mong muốn và Dược lực học nhưng không thể đưa ra liều khuyến cáo. Do đó, bilastine không nên sử dụng ở nhóm tuổi này.

Độ an toàn và hiệu quả của bilastine ở trẻ em suy gan, thận chưa được thiết lập.

Người cao tuổi

Không cần điều chỉnh liều trên người cao tuổi.

Suy thận

Nghiên cứu thực hiện trên người lớn bị suy thận cho thấy không cần điều chỉnh liều bilastine ở đối tượng này.

Suy gan

Chưa có dữ liệu lâm sàng trên bệnh nhân suy gan. Do bilastine không chuyển hóa qua gan và thải trừ dưới dạng không đổi qua nước tiểu và phân, suy gan có thể không gây nồng độ thuốc trong máu tăng vượt quá giới hạn an toàn ở người lớn. Do đó, không cần chỉnh liều trên bệnh nhân suy gan.

Cách dùng

Đường uống.

Uống cùng với nước và dùng thuốc 1 lần duy nhất trong ngày.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

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

CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG KHI DÙNG THUỐC

Trẻ em

Sự an toàn và hiệu quả của bilastine ở trẻ em dưới 2 tuổi chưa được thiết lập và có rất ít kinh nghiệm lâm sàng đối với trẻ từ 2 – 5 tuổi, do đó không sử dụng bilastine ở những nhóm tuổi này.

Suy thận

Ở những bệnh nhân suy thận vừa hoặc nặng, sử dụng đồng thời bilastine với các chất ức chế P-glycoprotein (P-gp) như ketoconazole, erythromycin, cyclosporine, ritonavir hay diltiazem có thể làm tăng nồng độ bilastine trong huyết tương và tăng nguy cơ xảy ra tác dụng phụ. Vì vậy, tránh dùng đồng thời bilastine với các chất ức chế P-glycoprotein ở bệnh nhân suy thận vừa hoặc nặng.

Tá dược

Sản phẩm này có chứa ít hơn 1 mmol (23 mg) natri (sodium) trong 1 viên, về cơ bản là “không chứa natri”.

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

Phụ nữ có thai

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

Các nghiên cứu trên động vật không cho thấy tác hại trực tiếp hoặc gián tiếp liên quan đến độc tính sinh sản, quá trình sinh sản hay sự phát triển sau sinh. Để phòng ngừa, không dùng thuốc này trong thời kỳ mang thai.

Phụ nữ cho con bú

Sự bài tiết của bilastine trong sữa mẹ chưa được nghiên cứu ở người. Dữ liệu được động học sẵn có trên động vật cho thấy bilastine có bài tiết qua sữa. Quyết định tiếp tục/ngừng cho con bú hoặc ngừng/tránh điều trị bằng bilastine cần phải tính đến lợi ích cho con bú đối với trẻ và lợi ích điều trị bằng bilastine đối với người mẹ.

Khả năng sinh sản

Không có hoặc có rất ít dữ liệu lâm sàng. Một nghiên cứu trên chuột cho thấy bilastine không có bất kỳ tác động bất lợi nào lên khả năng sinh sản.

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

Một nghiên cứu được thực hiện trên người lớn để đánh giá tác động của bilastine lên khả năng lái xe đã cho thấy điều trị với liều 20 mg không ảnh hưởng đến khả năng lái xe. Tuy nhiên, đáp ứng của mỗi cá nhân đối với thuốc có thể khác nhau, không lái xe hoặc vận hành máy móc cho đến khi đáp ứng của bệnh nhân đối với bilastine được thiết lập.

TƯƠNG TÁC, TƯƠNG Kỵ CỦA THUỐC

Tương tác

Các nghiên cứu tương tác thuốc chỉ thực hiện trên người lớn.

- Thức ăn: Thức ăn làm giảm đáng kể sinh khả dụng đường uống của bilastine khoảng 30%.
- Nước ép bưởi chùm: Uống 20 mg bilastine với nước ép bưởi chùm làm giảm 30% sinh khả của thuốc. Ảnh hưởng này cũng có thể xảy ra với các nước ép trái cây khác. Mức độ giảm sinh khả dụng có thể khác nhau giữa các chế phẩm và các loại trái cây. Cơ chế của tương tác này thông qua ức chế OATP1A2, một chất vận chuyển vào mà bilastine là cơ chất. Các thuốc là cơ chất hoặc chất ức chế của OATP1A2 như ritonavir hoặc rifampicin cũng có thể làm giảm nồng độ bilastine trong huyết tương.
- Ketoconazole hoặc erythromycin: Uống bilastine 20 mg x 1 lần/ngày đồng thời với ketoconazole 400 mg x 1 lần/ngày hoặc erythromycin 500 mg x 3 lần/ngày làm tăng AUC của bilastine 2 lần và C_{max} của bilastine 2 – 3 lần. Điều này có thể được giải thích do sự tương tác với các chất vận chuyển ra ở ruột, vì bilastine là cơ chất của P-gp và không bị chuyển hóa. Những thay đổi này dường như không ảnh hưởng đến tính an toàn của bilastine, ketoconazole hay erythromycin. Các thuốc khác là cơ chất hay chất ức chế của P-gp như cyclosporine cũng có thể làm tăng nồng độ bilastine trong huyết tương.
- Diltiazem: Sử dụng bilastine 20 mg x 1 lần/ngày đồng thời với diltiazem 60 mg x 1 lần/ngày làm tăng C_{max} của bilastine 50%. Điều này có thể giải thích do sự tương tác với các chất vận chuyển ra ở ruột và không ảnh hưởng đến tính an toàn của bilastine.
- Rượu: Trạng thái tâm thần vận động sau khi uống 20 mg bilastine x 1 lần/ngày cùng với rượu tương tự như kết quả ghi nhận sau khi uống đồng thời rượu và giả dược.
- Lorazepam: Uống đồng thời 20 mg bilastine x 1 lần/ngày và lorazepam 3 mg x 1 lần/ngày trong 8 ngày không làm tăng tác dụng ức chế thần kinh trung ương của lorazepam.

Trẻ em

Nghiên cứu tương tác thuốc chỉ được thực hiện ở người lớn. Vì không có kinh nghiệm lâm sàng về sự tương tác của bilastine với các thuốc khác, thức ăn và nước ép trái cây ở trẻ em, xem xét kết quả ghi nhận từ các nghiên cứu tương tác thuốc ở người lớn khi kê đơn bilastine cho trẻ em. Không có dữ liệu lâm sàng ở trẻ em để khẳng định liệu những thay đổi về AUC và C_{max} do tương tác có ảnh hưởng đến tính an toàn của bilastine hay không.

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

Tóm tắt dữ liệu an toàn ở thanh thiếu niên và người lớn

Tỷ lệ các biến cố bất lợi ở người lớn và thanh thiếu niên bị viêm mũi dị ứng hoặc mày đay vô căn mạn tính được điều trị bằng 20 mg bilastine trong các thử nghiệm lâm sàng tương đương với tỷ lệ ở những bệnh nhân dùng giả dược (12,7% so với 12,8%).

Các thử nghiệm lâm sàng pha II và pha III được tiến hành trong giai đoạn nghiên cứu lâm sàng bao gồm 2.525 người lớn và thanh thiếu niên được điều trị với các liều bilastine khác nhau, trong đó có 1.697 bệnh nhân sử dụng liều 20 mg. Trong các thử nghiệm này có 1.362 bệnh nhân dùng giả dược. Các phản ứng bất lợi thường gặp nhất được ghi nhận ở bệnh nhân dùng bilastine 20 mg để điều trị viêm mũi dị ứng và mày đay vô căn mạn tính là đau đầu, buồn ngủ, chóng mặt và mệt mỏi. Những tác dụng phụ này xảy ra với tần suất tương tự như ở những bệnh nhân dùng giả dược.

Dưới đây là các tác dụng không mong muốn tối thiểu có thể liên quan đến bilastine và được báo cáo ở hơn 0,1% trong số 1.697 bệnh nhân được điều trị với bilastine 20 mg trong quá trình nghiên cứu lâm sàng của thuốc.

Tác dụng không mong muốn được đánh giá trên các hệ cơ quan dựa theo các tần suất sau: rất thường gặp ($ADR \geq 1/10$), thường gặp ($1/100 \leq ADR < 1/10$), ít gặp ($1/1.000 \leq ADR < 1/100$), hiếm gặp ($1/10.000 \leq ADR < 1/1.000$), rất hiếm gặp ($ADR < 1/10.000$) và không rõ tần suất (không thể ước tính từ dữ liệu hiện có). Bảng dưới đây không bao gồm các tác dụng phụ có tần suất hiếm gặp, rất hiếm gặp và không rõ tần suất.

Hệ cơ quan		Bilastine 20 mg N = 1.697	Tất cả các liều của bilastine N = 2.525	Giả dược N = 1.362
Tần suất	Tác dụng không mong muốn			
Nhiễm trùng và nhiễm ký sinh trùng				
Ít gặp	Herpes miệng	2 (0,12%)	2 (0,08%)	0 (0,0%)
Chuyển hóa và dinh dưỡng				
Ít gặp	Tăng cảm giác thèm ăn	10 (0,59%)	11 (0,44%)	7 (0,51%)
Tâm thần				
Ít gặp	Lo lắng	6 (0,35%)	8 (0,32%)	0 (0,0%)
	Mất ngủ	2 (0,12%)	4 (0,16%)	0 (0,0%)
Hệ thần kinh				
Thường gặp	Buồn ngủ	52 (3,06%)	82 (3,25%)	39 (2,86%)
	Đau đầu	68 (4,01%)	90 (3,56%)	46 (3,38%)
Ít gặp	Chóng mặt	14 (0,83%)	23 (0,91%)	8 (0,59%)
Tai và mê đạo				
Ít gặp	Ù tai	2 (0,12%)	2 (0,08%)	0 (0,0%)
	Chóng mặt	3 (0,18%)	3 (0,12%)	0 (0,0%)
Tim				
Ít gặp	Block nhánh phải	4 (0,24%)	5 (0,20%)	3 (0,22%)
	Rối loạn nhịp xoang	5 (0,30%)	5 (0,20%)	1 (0,07%)
	Kéo dài khoảng QT trên điện tâm đồ	9 (0,53%)	10 (0,40%)	5 (0,37%)

	Bất thường khác trên điện tâm đồ	7 (0,41%)	11 (0,44%)	2 (0,15%)
Hô hấp, lồng ngực và trung thất				
Ít gặp	Khó thở	2 (0,12%)	2 (0,08%)	0 (0,0%)
	Khó chịu ở mũi	2 (0,12%)	2 (0,08%)	0 (0,0%)
	Khô mũi	3 (0,18%)	6 (0,24%)	4 (0,29%)
Tiêu hóa				
Ít gặp	Đau bụng trên	11 (0,65%)	14 (0,55%)	6 (0,44%)
	Đau bụng	5 (0,30%)	5 (0,20%)	4 (0,29%)
	Buồn nôn	7 (0,41%)	10 (0,40%)	14 (1,03%)
	Khó chịu ở dạ dày	3 (0,18%)	4 (0,16%)	0 (0,0%)
	Tiêu chảy	4 (0,24%)	6 (0,24%)	3 (0,22%)
	Khô miệng	2 (0,12%)	6 (0,24%)	5 (0,37%)
	Khó tiêu	2 (0,12%)	4 (0,16%)	4 (0,29%)
	Viêm dạ dày	4 (0,24%)	4 (0,16%)	0 (0,0%)
Da và mô dưới da				
Ít gặp	Ngứa	2 (0,12%)	4 (0,16%)	2 (0,15%)
Toàn thân và tại chỗ				
Ít gặp	Mệt mỏi	14 (0,83%)	19 (0,75%)	18 (1,32%)
	Khát	3 (0,18%)	4 (0,16%)	1 (0,07%)
	Cải thiện tình trạng trước đó	2 (0,12%)	2 (0,08%)	1 (0,07%)
	Sốt	2 (0,12%)	3 (0,12%)	1 (0,07%)
	Suy nhược	3 (0,18%)	4 (0,16%)	5 (0,37%)
Xét nghiệm				
Ít gặp	Tăng gamma-glutamyltransferase	7 (0,41%)	8 (0,32%)	2 (0,15%)
	Tăng alanine aminotransferase	5 (0,30%)	5 (0,20%)	3 (0,22%)
	Tăng aspartate aminotransferase	3 (0,18%)	3 (0,12%)	3 (0,22%)
	Tăng creatinin máu	2 (0,12%)	2 (0,08%)	0 (0,0%)
	Tăng triglyceride máu	2 (0,12%)	2 (0,08%)	3 (0,22%)
	Tăng cân	8 (0,47%)	12 (0,48%)	2 (0,15%)

Không rõ tần suất (không thể ước tính từ dữ liệu hiện có): Đánh trống ngực, nhịp tim nhanh, phản ứng quá mẫn (như sốc phản vệ, khó thở, phát ban, phù cục bộ/sưng cục bộ, ban đỏ) và nôn được báo cáo sau khi lưu hành trên thị trường.

Mô tả các phản ứng bất lợi ở bệnh nhân người lớn và thanh thiếu niên:

Đã ghi nhận các tình trạng buồn ngủ, đau đầu, chóng mặt và mệt mỏi ở những bệnh nhân điều trị bằng bilastine 20 mg và bằng giả dược. Tần suất đối với tình trạng buồn ngủ là

3,06% so với 2,86%; đau đầu 4,01% so với 3,38%; chóng mặt 0,83% so với 0,59% và mệt mỏi 0,83% so với 1,32%.

Dữ liệu an toàn trong giai đoạn nghiên cứu lâm sàng đã được khẳng định bởi dữ liệu thu thập sau khi thuốc lưu hành trên thị trường.

Tóm tắt dữ liệu an toàn ở trẻ em

Trong quá trình nghiên cứu lâm sàng, tần suất, mức độ nghiêm trọng và loại tác dụng không mong muốn ở thanh thiếu niên (12 – 17 tuổi) tương tự so với ở người lớn. Dữ liệu thu thập ở nhóm đối tượng này (thanh thiếu niên) sau khi đưa thuốc ra thị trường đã xác nhận cho các kết quả thử nghiệm lâm sàng.

Trong một thử nghiệm lâm sàng có đối chứng kéo dài 12 tuần, tỷ lệ trẻ em (2 – 11 tuổi) báo cáo tác dụng không mong muốn sau khi điều trị viêm mũi dị ứng hoặc mày đay vô căn mạn tính bằng bilastine 10 mg tương đương với bệnh nhân dùng giả dược (68,5% so với 67,5%). Các biến cố bất lợi liên quan thường gặp nhất trên 291 trẻ em (2 – 11 tuổi) dùng bilastine (viên nén phân tán trong miệng) trong các thử nghiệm lâm sàng (*260 trẻ trong nghiên cứu tính an toàn trên lâm sàng, 31 trẻ trong nghiên cứu dược động học) là đau đầu, viêm kết mạc dị ứng, viêm mũi và đau bụng. Những tác dụng phụ này xảy ra có tần suất tương đương với 249 bệnh nhân dùng giả dược.

Dưới đây là các tác dụng không mong muốn ít nhất có thể liên quan đến bilastine và được báo cáo ở hơn 0,1% trẻ em (2 – 11 tuổi) có điều trị với bilastine trong giai đoạn nghiên cứu lâm sàng của thuốc.

Tác dụng không mong muốn được đánh giá trên các hệ cơ quan dựa theo các tần suất sau: rất thường gặp ($ADR \geq 1/10$), thường gặp ($1/100 \leq ADR < 1/10$), ít gặp ($1/1.000 \leq ADR < 1/100$), hiếm gặp ($1/10.000 \leq ADR < 1/1.000$), rất hiếm gặp ($ADR < 1/10.000$) và không rõ tần suất (không thể ước tính từ dữ liệu hiện có). Bảng dưới đây không bao gồm các tác dụng phụ có tần suất hiếm gặp, rất hiếm gặp và không rõ tần suất.

phụ có tần suất nhiễm gặp, rất hiếm gặp và không rõ tần suất.

Hệ cơ quan		Bilastine 10 mg N = 291*	Giả dược N = 249
Tần suất	Tác dụng không mong muốn		
Nhiễm trùng và nhiễm ký sinh trùng			
Thường gặp	Viêm mũi	3 (1,0%)	3 (1,2%)
Hệ thần kinh			
Thường gặp	Đau đầu	6 (2,1%)	3 (1,2%)
Ít gặp	Chóng mặt	1 (0,3%)	0 (0,0%)
	Mất ý thức	1 (0,3%)	0 (0,0%)
Mắt			
Thường gặp	Viêm kết mạc dị ứng	4 (1,4%)	5 (2,0%)
Ít gặp	Kích ứng mắt	1 (0,3%)	0 (0,0%)
Tiêu hóa			
Thường gặp	Đau bụng/đau bụng trên	3 (1,0%)	3 (1,2%)
Ít gặp	Tiêu chảy	2 (0,7%)	0 (0,0%)
	Buồn nôn	1 (0,3%)	0 (0,0%)
	Sưng môi	1 (0,3%)	0 (0,0%)

Da và mô dưới da			
Ít gặp	Chàm	1 (0,3%)	0 (0,0%)
	Mày đay	2 (0,7%)	2 (0,8%)
Toàn thân và tại chỗ			
Ít gặp	Mệt mỏi	2 (0,7%)	0 (0,0%)

* 260 trẻ trong nghiên cứu tính an toàn trên lâm sàng, 31 trẻ nghiên cứu được động học.

Mô tả các phản ứng bất lợi ở trẻ em

Đau đầu, đau bụng, viêm kết mạc dị ứng và viêm mũi đều được ghi nhận ở trẻ em dùng bilastine 10 mg và dùng giả dược. Tần suất báo cáo đối với đau đầu là 2,1% so với 1,2%; đau bụng 1,0% so với 1,2%; viêm kết mạc dị ứng 1,4% so với 2,0% và viêm mũi 1,0% so với 1,2%.

QUÁ LIỀU VÀ CÁCH XỬ TRÍ

Thông tin liên quan đến quá liều cấp tính của bilastine dựa trên kết quả thử nghiệm lâm sàng trong giai đoạn phát triển thuốc và dữ liệu sau khi đưa thuốc ra thị trường. Trong các thử nghiệm lâm sàng, 26 người lớn khỏe mạnh đã dùng bilastine liều gấp 10 – 11 lần liều điều trị (liều duy nhất 220 mg hoặc liều 200 mg/ngày trong 7 ngày), tần suất xuất hiện các tác dụng không mong muốn cao gấp 2 lần so với nhóm dùng giả dược. Các phản ứng bất lợi ghi nhận thường xuyên nhất là chóng mặt, đau đầu và buồn nôn. Không ghi nhận tác dụng phụ nghiêm trọng nào cũng như sự kéo dài khoảng QT đáng kể. Thông tin thu thập được sau khi thuốc lưu hành trên thị trường phù hợp với kết quả từ các thử nghiệm lâm sàng.

Một nghiên cứu chéo thông qua giá trị QT/QTc trên 30 người lớn khỏe mạnh nhằm đánh giá tác động của bilastine đa liều (100 mg x 4 ngày) lên sự tái cực tâm thất cho thấy không có sự kéo dài giá trị QTc nào đáng kể.

Chưa có dữ liệu về quá liều ở trẻ em.

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

DƯỢC LỰC HỌC

Nhóm dược lý: Thuốc kháng histamin toàn thân khác.

Mã ATC: R06AX29.

Bilastine là thuốc kháng histamin tác dụng kéo dài, không gây buồn ngủ, có ái lực chọn lọc đối với thụ thể H₁ ngoại biên và không có ái lực với thụ thể muscarinic.

Bilastine ức chế các phản ứng ban đỏ, mày đay do histamin trong vòng 24 giờ sau khi sử dụng liều duy nhất.

DƯỢC ĐỘNG HỌC

Hấp thu

Bilastine hấp thu nhanh sau khi uống với thời gian đạt nồng độ tối đa trong huyết tương khoảng 1,3 giờ. Không có sự tích lũy thuốc. Giá trị sinh khả dụng đường uống trung bình của bilastine là 61%.

Phân bố

Các nghiên cứu *in vitro* và *in vivo* cho thấy bilastine là cơ chất của P-gp và OATP. Bilastine không phải là cơ chất của chất vận chuyển BCRP hay các chất vận chuyển tại thận OCT2, OAT1 và OAT3. Theo các nghiên cứu *in vitro*, bilastine không ức chế các chất vận chuyển

sau trong tuần hoàn hệ thống: P-gp, MRP2, BCRP, BSEP, OATP1B1, OATP1B3, OATP2B1, OAT1, OAT3, OCT1, OCT2 và NTCP, vì chỉ phát hiện sự ức chế nhẹ đối với P-gp, OATP2B1 và OCT1 với IC_{50} ước tính $\geq 300 \mu M$, cao hơn rất nhiều so với C_{max} trong huyết tương tính toán được trên lâm sàng. Do đó, những tương tác này không có ý nghĩa trên lâm sàng. Tuy nhiên, dựa theo các kết quả này, không thể loại trừ tác dụng ức chế của bilastine lên các chất vận chuyển trên niêm mạc ruột như P-gp.

Ở liều điều trị, tỉ lệ liên kết với protein huyết tương của bilastine khoảng 84 – 90%.

Chuyển hóa

Trong các nghiên cứu *in vitro*, bilastine không gây cảm ứng hay ức chế hoạt động của các isoenzym CYP450.

Thải trừ

Trong một nghiên cứu cân bằng khối thực hiện trên người lớn khỏe mạnh, sau khi dùng liều duy nhất 20 mg ^{14}C -bilastine, gần 95% liều được tìm thấy trong nước tiểu (28,3%) và phân (66,5%) dưới dạng không đổi. Điều này cho thấy bilastine chuyển hóa không đáng kể ở người. Thời gian bán thải trung bình ở tình nguyện viên khỏe mạnh là 14,5 giờ.

Tuyến tính

Bilastine thể hiện được động học tuyến tính trong khoảng liều nghiên cứu (5 – 220 mg) và mức độ biến thiên giữa các cá thể thấp.

Được động học ở những đối tượng đặc biệt

Suy thận

Trong một nghiên cứu trên các đối tượng suy thận, giá trị trung bình của $AUC_{0-\infty}$ tăng từ 737,4 ($\pm 260,8$) ng x giờ/mL ở người có chức năng thận bình thường (GFR: > 80 mL/phút/ $1,73 m^2$) lên 967,4 ($\pm 140,2$) ng x giờ/mL ở bệnh nhân suy thận nhẹ (GFR: 50 – 80 mL/phút/ $1,73 m^2$); 1384,2 ($\pm 263,23$) ng x giờ/mL ở bệnh nhân suy thận vừa (GFR: 30 – 50 mL/phút/ $1,73 m^2$) và 1708,5 ($\pm 699,0$) ng x giờ/mL ở bệnh nhân suy thận nặng (GFR: < 30 mL/phút/ $1,73 m^2$). Thời gian bán thải trung bình của bilastine ở đối tượng có chức năng thận bình thường, bệnh nhân suy thận nhẹ, vừa và nặng lần lượt là 9,3 giờ ($\pm 2,8$); 15,1 giờ ($\pm 7,7$); 10,5 giờ ($\pm 2,3$) và 18,4 giờ ($\pm 11,4$). Quá trình thải trừ qua nước tiểu gần như hoàn thành sau 48 – 72 giờ ở tất cả các đối tượng. Những thay đổi được động học này được xem là không ảnh hưởng có ý nghĩa lâm sàng đến tính an toàn của bilastine do nồng độ thuốc trong huyết tương ở bệnh nhân suy thận vẫn nằm trong ngưỡng an toàn.

Suy gan

Không có dữ liệu về được động học trên bệnh nhân suy gan. Bilastine không bị chuyển hóa ở người. Kết quả nghiên cứu trên nhóm bị suy thận cho thấy sự thải trừ qua thận đóng vai trò chính và bài xuất qua mật chỉ góp một phần rất nhỏ trong sự thải trừ bilastine. Thay đổi chức năng gan được xem là không ảnh hưởng có ý nghĩa lâm sàng đến được động học của bilastine.

Người cao tuổi

Có rất ít dữ liệu được động học ở người trên 65 tuổi. Không có sự khác biệt có ý nghĩa thống kê được ghi nhận giữa đặc tính được động học của bilastine ở người trên 65 tuổi so với người trưởng thành từ 18 đến 35 tuổi.

Trẻ em

Không có dữ liệu dược động học ở thanh thiếu niên (12 – 17 tuổi) vì có thể ngoại suy từ dữ liệu của người lớn.

Dữ liệu dược động học ở trẻ em được lấy từ một nghiên cứu dược động học pha II trên 31 trẻ em từ 4 – 11 tuổi bị viêm mũi dị ứng hoặc mày đay mạn tính sử dụng viên nén phân tán trong miệng bilastine 10 mg x 1 lần/ngày. Phân tích dược động học dữ liệu nồng độ thuốc trong huyết tương cho thấy trẻ em dùng bilastine 10 mg x 1 lần/ngày ghi nhận nồng độ thuốc trong tuần hoàn tương đương với người lớn và thanh thiếu niên sử dụng liều 20 mg, bằng giá trị AUC trung bình 1.014 ng x giờ/mL đối với trẻ 6 – 11 tuổi. Những kết quả này phần lớn nằm dưới ngưỡng an toàn dựa theo dữ liệu liều 80 mg x 1 lần/ngày ở người lớn trong hồ sơ an toàn của thuốc. Điều này chứng minh bilastine 10 mg x 1 lần/ngày, đường uống là liều điều trị phù hợp đối với trẻ em từ 6 – 11 tuổi có cân nặng tối thiểu 20 kg.

QUY CÁCH ĐÓNG GÓI

Hộp 5 vỉ x 10 viên.

BẢO QUẢN

Bảo quản trong bao bì kín, nơi khô ráo, nhiệt độ dưới 30°C.

TIÊU CHUẨN CHẤT LƯỢNG

Nhà sản xuất.

HẠN DÙNG

36 tháng kể từ ngày sản xuất.

Số lô sản xuất (Batch No.), ngày sản xuất (Mfg. date), hạn dùng (Exp. date): xin xem trên nhãn bao bì.

Cơ sở sản xuất:

Công ty TNHH Sinh Dược phẩm Hera

Lô A17 Khu công nghiệp Tứ Hạ, phường Tứ Hạ, thị xã Hương Trà, tỉnh Thừa Thiên Huế, Việt Nam.

