

24/1155

Mẫu nhãn USALUKAST 5
Hộp 10 viên nén bao phim (1 vỉ x 10 viên)
100% real size



Mẫu nhãn USALUKAST 5
Hộp 30 viên nén bao phim (3 vỉ x 10 viên)
100% real size



Mẫu nhãn USALUKAST 5
Vi 10 viên nén bao phim
100% real size



USALUKAST® 5/10

Montelukast 5/10 mg

THÀNH PHẦN: Mỗi viên nén bao phim chứa:**USALUKAST® 5**

Montelukast (dưới dạng montelukast natri)5 mg

Tá dược: Microcrystalline cellulose, Lactose monohydrat, Natri croscarmellose, Colloidal anhydrous silica, Magnesi stearat, Opadry II white, Opadry II pink.

USALUKAST® 10

Montelukast (dưới dạng montelukast natri)10 mg

Tá dược: Microcrystalline cellulose, Lactose monohydrate, Natri croscarmellose, Colloidal anhydrous silica, Magnesi stearat, sunset yellow lake, Opadry II pink.

Mã ATC: R03DC03**TÍNH CHẤT****Dược lực học**

Montelukast là một hoạt chất dùng qua đường uống gắn kết với ái lực cao và có tính chọn lọc đối với thụ thể CysLT₁ (ưu tiên đối với các thụ thể khác có tính được lý quan trọng đối với đường hô hấp, như là thụ thể prostanoid, cholinergic, hay β -adrenergic). Montelukast ức chế tác động sinh lý của LTD₄ tại thụ thể CysLT₁ mà không có bất kỳ tác dụng chủ vận nào.

Cysteinyl leukotriene (LTC₄, LTD₄, LTE₄) là các sản phẩm của quá trình chuyển hóa acid arachidonic và được phóng thích từ nhiều loại tế bào khác nhau, bao gồm các dưỡng bào và các tế bào bạch cầu ái toan. Các eicosanoid này gắn kết với thụ thể cysteinyl leukotriene (CysLT). Thụ thể CysLT tuýp-1 (CysLT₁) được tìm thấy trong đường hô hấp của người (bao gồm các cơ trơn hô hấp và các đại thực bào trong đường hô hấp) và trên các tế bào tiền viêm khác (bao gồm các tế bào bạch cầu ái toan và một số tế bào gốc dòng tủy khác). Các CysLT liên quan đến sinh lý bệnh học của bệnh hen suyễn và viêm mũi dị ứng. Trong bệnh hen suyễn, các tác dụng thông qua trung gian leukotriene bao gồm phù nề đường dẫn khí, co thắt cơ trơn, và các hoạt động của tế bào bị thay đổi trong quá trình viêm. Trong viêm mũi dị ứng, các CysLT được phóng thích từ niêm mạc mũi sau khi tiếp xúc dị nguyên trong cả các phản ứng giai đoạn sớm và giai đoạn muộn và liên quan đến các triệu chứng của viêm mũi dị ứng.

Dược động học

Montelukast được hấp thu nhanh qua đường uống. Người lớn uống một viên nén bao phim 10 mg lúc bụng đói, đạt được nồng độ đỉnh montelukast trung bình trong huyết tương (C_{max}) sau 3 đến 4 giờ (T_{max}). Khả dụng sinh học qua đường uống trung bình là 64%. Khả dụng sinh học và C_{max} không bị ảnh hưởng bởi bữa ăn sáng thông thường.

Hơn 99% montelukast gắn với protein trong huyết tương. Thể tích phân bố ở trạng thái ổn định của montelukast trung bình từ 8 đến 11 lít.

Montelukast được chuyển hóa rộng rãi. Trong các nghiên cứu với liều điều trị, không phát hiện được nồng độ các chất chuyển hóa của montelukast ở trạng thái ổn định ở bệnh nhân người lớn và trẻ em. Các nghiên cứu *In vitro* dùng microsome ở gan người cho thấy CYP3A4, 2C8, và 2C9 đều liên quan đến chuyển hóa của montelukast.

Độ thanh thải huyết tương trung bình của montelukast là 45 mL/phút ở những người lớn khỏe mạnh. Sau khi uống một liều montelukast có gắn đồng vị phóng xạ, 86% hoạt động phóng xạ thu được trong phân trong 5 ngày và < 0,2% được tìm thấy trong nước tiểu.

Thời gian bán hủy trung bình trong huyết tương của montelukast trong khoảng từ 2,7 đến 5,5 giờ ở người trẻ khỏe mạnh. Dược động học của montelukast gần như tuyến tính đối với liều uống lên đến 50 mg. Trong thời gian dùng liều montelukast 10 mg 1 lần trong ngày khoảng 14% hoạt chất ban đầu tích lũy trong huyết tương.

Đã có bằng chứng giảm chuyển hóa ở bệnh nhân suy gan nhẹ đến vừa và có xơ gan trên lâm sàng làm cho diện tích dưới đường cong (AUC) trung bình của montelukast cao hơn 41% (Khoảng tin cậy 90% = 7%, 85%) sau khi dùng liều đơn 10 mg. Sự thải trừ của montelukast hơi kéo dài so với thời gian thải trừ ở những người khỏe mạnh (thời gian bán thải trung bình 7,4 giờ).

CHỈ ĐỊNH

- **Hen suyễn:** Montelukast được chỉ định để phòng ngừa và điều trị lâu dài bệnh hen suyễn cho người lớn và trẻ em từ 12 tháng tuổi trở lên.
- **Co thắt phế quản do vận động gắng sức (EIB):** Montelukast được chỉ định để phòng ngừa co thắt phế quản do vận động gắng sức (EIB) cho bệnh nhân từ 6 tuổi trở lên.
- **Viêm mũi dị ứng:** Montelukast được chỉ định để làm giảm các triệu chứng của viêm mũi dị ứng theo mùa cho bệnh nhân từ 2 tuổi trở lên, và viêm mũi dị ứng quanh năm cho bệnh nhân từ 6 tháng tuổi trở lên.

LIỀU LƯỢNG - CÁCH DÙNG

Hen suyễn: USALUKAST® nên được dùng một lần mỗi ngày vào buổi tối. Các liều dùng dưới đây đã được khuyến nghị:

- **Đối với người lớn & thanh thiếu niên ≥ 15 tuổi:** 1 viên 10 mg.

- **Đối với bệnh nhi từ 6 đến 14 tuổi:** 1 viên 5 mg.

Co thắt phế quản do vận động gắng sức (EIB): nên dùng một liều đơn USALUKAST® ít nhất 2 giờ trước khi vận động gắng sức để phòng ngừa co thắt phế quản

do gắng sức. Các liều dùng dưới đây đã được khuyến nghị:

-Đối với người lớn & thanh thiếu niên ≥ 15 tuổi: 1 viên 10 mg.

-Đối với bệnh nhi từ 6 đến 14 tuổi: 1 viên 5 mg.

Không nên uống thêm một liều USALUKAST® trong vòng 24 giờ khi đã dùng một liều trước đó. Bệnh nhân đã dùng liều hàng ngày USALUKAST® cho một chỉ định khác (bao gồm hen suyễn mãn tính) không nên dùng thêm liều để phòng ngừa EIB. Bệnh nhân nên có sẵn thuốc chủ vận β tác dụng ngắn để dùng trong trường hợp cấp cứu. Độ an toàn và hiệu quả của thuốc trên bệnh nhi dưới 6 tuổi bị EIB chưa được xác định. Liều dùng hàng ngày của USALUKAST® để điều trị lâu dài bệnh hen suyễn chưa được xác định để ngăn ngừa đợt cấp của EIB.

Viêm mũi dị ứng

USALUKAST® nên được dùng một lần mỗi ngày đối với viêm mũi dị ứng. Hiệu quả đã được chứng minh đối với viêm mũi dị ứng theo mùa khi uống montelukast vào buổi sáng hay buổi tối không liên quan đến bữa ăn. Thời điểm uống thuốc có thể được điều chỉnh cho phù hợp với nhu cầu của bệnh nhân.

Các liều dùng dưới đây đã được khuyến nghị để điều trị các triệu chứng của viêm mũi dị ứng theo mùa hay viêm mũi dị ứng quanh năm:

-Đối với người lớn & thanh thiếu niên ≥ 15 tuổi: 1 viên 10 mg.

-Đối với bệnh nhi từ 6 đến 14 tuổi: 1 viên 5 mg.

Hen suyễn và Viêm mũi dị ứng

Bệnh nhân bị hen suyễn và viêm mũi dị ứng chỉ nên dùng một liều USALUKAST® mỗi ngày vào buổi tối.

-Đối với người lớn & thanh thiếu niên ≥ 15 tuổi: 1 viên 10 mg.

-Đối với bệnh nhi từ 6 đến 14 tuổi: 1 viên 5 mg.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

Quá mẫn cảm với các thành phần của thuốc.

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN (ADR)

Rất thường gặp, $ADR > 1/10$

Nhiễm trùng và nhiễm ký sinh trùng: Nhiễm trùng đường hô hấp trên*.

Thường gặp, $1/10 < ADR \leq 1/100$

Tiêu hóa: Tiêu chảy**, buồn nôn**, nôn**, đau bụng, khó tiêu.

Gan mật: Tăng transaminases (ALT, AST) huyết thanh.

Dạ và mô dưới da: Phát ban**.

Toàn thân: Sốt**

Ít gặp, $1/1000 \leq ADR < 1/100$

Miễn dịch: Phản ứng quá mẫn bao gồm phản ứng phản vệ.

Tâm thần: Giấc mơ bất thường bao gồm ác mộng, mất ngủ, mộng du, cáu gắt, lo lắng, bồn chồn, kích động bao gồm hành vi gây hấn hay thù địch, trầm cảm.

Thần kinh: Chóng mặt, buồn ngủ dị cảm/ giảm cảm giác, co giật.

Hệ hô hấp, lồng ngực và trung thất: Chảy máu cam.

Tiêu hóa: Khô miệng, khó tiêu.

Dạ và mô dưới da: Bầm tím, nổi mề đay, ngứa.

Cơ xương và mô liên kết: Đau khớp, đau cơ bao gồm chuột rút cơ bắp.

Toàn thân: Suy nhược, mệt mỏi, khó chịu, phù nề.

Hiếm gặp, $1/10,000 \leq ADR < 1/1,000$

Máu và hệ bạch huyết: tăng nguy cơ chảy máu.

Tâm thần: Run.

Tim: Đánh trống ngực.

Dạ và mô dưới da: Phù mạch.

Rất hiếm gặp, $ADR < 1/10,000$

Miễn dịch: Sự thâm nhiễm gan của bạch cầu ái toan.

Tâm thần: Ảo giác, có suy nghĩ hoặc hành vi tự tử (khả năng tự tử).

Hệ hô hấp, lồng ngực và trung thất: Hội chứng Churg-Strauss (CSS).

Gan mật: Viêm gan (bao gồm tổn thương gan ứ mật, tổn thương tế bào gan, và tổn thương gan kiểu hỗn hợp).

Dạ và mô dưới da: Hồng ban dạng nốt, hồng ban đa dạng.

***Tác dụng phụ này rất thường gặp ở cả bệnh nhân dùng montelukast và bệnh nhân dùng giả dược trong các thử nghiệm lâm sàng.**

**** Tác dụng phụ này thường gặp ở cả bệnh nhân dùng montelukast và bệnh nhân dùng giả dược trong các thử nghiệm lâm sàng.**

Thông báo cho bác sĩ những tác dụng bất lợi gặp phải khi dùng thuốc.

ẢNH HƯỞNG TỚI KHẢ NĂNG LÁI XE VÀ VẬN HÀNH MÁY MÓC

Chưa có cơ sở chứng minh montelukast có ảnh hưởng đến khả năng lái xe và vận hành máy móc. Tuy nhiên, trong một số ít trường hợp, bệnh nhân đã được báo cáo chóng mặt hoặc ngủ gà. Do đó, cần thận trọng khi sử dụng thuốc khi lái xe và vận hành máy móc.

CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG

Montelukast không được chỉ định để cắt cơn co thắt phế quản trong các cơn hen cấp, bao gồm đợt bùng phát cơn hen cấp tính. Nên khuyến bệnh nhân chuẩn bị sẵn loại thuốc cấp cứu thích hợp.

Không nên thay thế đột ngột các loại corticosteroid dạng hít hay uống bằng montelukast.

Những bệnh nhân đã được biết nhạy cảm với aspirin nên tránh dùng tiếp aspirin hay các loại thuốc kháng viêm không thuộc nhóm steroid trong thời gian uống montelukast. Mặc dù montelukast hiệu quả trong việc cải thiện chức năng thông khí ở những bệnh nhân hen được ghi nhận nhạy cảm với aspirin, nhưng nó không cho thấy rút ngắn đáp ứng co thắt phế quản đối với aspirin và các thuốc kháng viêm không thuộc nhóm steroid khác ở những bệnh nhân hen nhạy cảm với aspirin.

Các tai biến tâm thần kinh đã được ghi nhận trên các bệnh nhân người lớn, thanh thiếu niên và trẻ em dùng montelukast. Bệnh nhân nên được hướng dẫn để thông

báo cho bác sĩ kê toa của họ nếu các thay đổi này xảy ra. Bác sĩ cần đánh giá cẩn thận các nguy cơ và lợi ích của việc tiếp tục điều trị với montelukast nếu các tai biến này xảy ra.

Bệnh nhân hen đang điều trị với montelukast có thể biểu hiện tăng bạch cầu ái toan toàn thân, đôi khi có các đặc điểm lâm sàng của viêm mạch máu phù hợp với hội chứng Churg-Strauss, một tình trạng bệnh lý thường được điều trị với corticosteroid toàn thân. Những trường hợp này đôi khi đi kèm với giảm liều corticosteroid uống. Các bác sĩ nên cảnh giác với tăng bạch cầu ái toan, phát ban quanh mạch máu, các triệu chứng hô hấp xấu đi, các biến chứng tim và/hay bệnh lý thần kinh xuất hiện trên những bệnh nhân của họ.

Thời kỳ mang thai

Không có những nghiên cứu đầy đủ và có đối chứng trên phụ nữ mang thai. Chỉ nên dùng montelukast cho phụ nữ mang thai khi thực sự cần thiết.

Thời kỳ cho con bú

Chưa biết montelukast có được bài tiết vào sữa mẹ hay không. Do nhiều thuốc được bài tiết vào sữa mẹ, nên thận trọng khi dùng montelukast ở người mẹ đang cho con bú.

Sử dụng cho trẻ em

Độ an toàn và hiệu quả của thuốc trên bệnh nhi dưới 12 tháng tuổi bị hen suyễn, 6 tháng bị viêm mũi dị ứng quanh năm và 6 tuổi bị co thắt phế quản do gắng sức chưa được xác định.

Suy gan

Không cần chỉnh liều cho bệnh nhân suy gan nhẹ đến vừa.

Suy thận

Không cần chỉnh liều cho bệnh nhân suy thận.

TƯƠNG TÁC THUỐC

Không cần chỉnh liều khi dùng montelukast chung với theophyllin, prednison, prednisolon, thuốc uống ngừa thai, terfenadin, digoxin, warfarin, gemfibrozil, itraconazol, hormon tuyến giáp, thuốc an thần gây ngủ, các thuốc kháng viêm không thuộc nhóm steroid, benzodiazepin, thuốc chống sung huyết và các thuốc gây cảm ứng enzym Cytochrome P450 (CYP).

QUÁ LIỀU

Hiện không có thông tin cụ thể về điều trị khi dùng quá liều montelukast. Trong các nghiên cứu về hen mạn tính, montelukast đã được dùng với các liều mỗi ngày lên đến 200 mg/ngày cho người lớn trong 22 tuần và các nghiên cứu ngắn hạn với liều lên đến 900 mg mỗi ngày cho bệnh nhân trong khoảng 1 tuần, không thấy có phản ứng phụ quan trọng trên lâm sàng. Trong trường hợp quá liều, cần áp dụng các biện pháp điều trị nâng đỡ như loại bỏ các chất chưa hấp thu được từ ống tiêu hóa, theo dõi lâm sàng và bắt đầu điều trị nâng đỡ nếu cần.

Đã có những ghi nhận về quá liều cấp tính sau khi thuốc lưu hành và trên các nghiên cứu lâm sàng với montelukast. Các ghi nhận này bao gồm ở trẻ em và người lớn với liều cao đến 1000 mg. Các phát hiện quan sát trên lâm sàng và cận lâm sàng phù hợp với hồ sơ về an toàn ở bệnh nhân người lớn và trẻ em.

Không rõ có thể loại montelukast ra bằng thẩm phân phúc mạc hay chạy thận nhân tạo hay không.

BẢO QUẢN: Ở nhiệt độ dưới 30°C. Tránh ánh sáng trực tiếp và nơi ẩm ướt.

TRÌNH BÀY: Vỉ 10 viên. Hộp 1 vỉ, 3 vỉ và 10 vỉ.

HẠN DÙNG: 36 tháng kể từ ngày sản xuất.

Để xa tầm tay trẻ em

*Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng
Nếu cần thêm thông tin, xin hỏi ý kiến thầy thuốc
Thuốc này chỉ dùng theo đơn của bác sĩ*

Sản xuất và phân phối bởi: **CÔNG TY CỔ PHẦN DƯỢC PHẨM AMPHARCO U.S.A**
Khu Công Nghiệp Nhơn Trạch 3, xã Hiệp Phước, Huyện Nhơn Trạch, Tỉnh Đồng Nai.
ĐT: 0613 566205 Fax: 0613 566203



**TUQ.CỤC TRƯỞNG
P.TRƯỞNG PHÒNG
Lỗ Minh Hùng**