https://nhathuocngocanh.com/

ALLERGAN

Rx Thuốc bán theo đơn

RELESTAT™

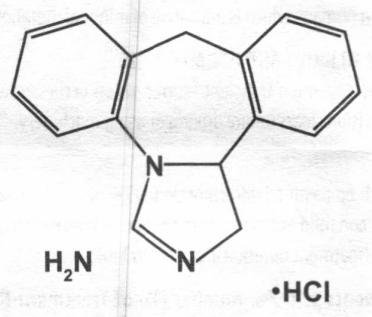
(Dung dịch nhỏ mắt epinastine HCl) 0,05%

Vô khuẩn

MÔ TẢ

RELESTAT™ (dung dịch nhỏ mắt epinastine HCl) 0,05% là một dung dịch trong, không màu, đẳng trương, vô khuẩn, chứa epinastine HCl là chất kháng histamin và là chất ức chế phóng thích histamin từ dưỡng bào, dùng tại chỗ cho mắt.

Epinastine HCl được biểu thị bởi công thức cấu tạo sau đây:



$C_{16}H_{15}N_3$ HCl. Trọng lượng phân tử 285,78

Tên hóa học: 3-Amino-9, 13b-dihydro-1H-dibenz[c,f] imidazo[1,5-a] azepine hydrochloride

Mỗi mL chứa:

Hoạt chất: Epinastine HCl 0,05% (0,5 mg/mL) tương đương với epinastine 0,044% (0,44 mg/mL);

Chất bảo quản: Benzalkonium clorid 0,01%;

Thành phần không hoạt tính: Dinatri edetat, nước tinh khiết, natri clorid, natri phosphat monobasic dihydrat, natri hydroxyd, natri hydroxyd và/hoặc acid hydrocloric (để điều chỉnh pH).

RELESTAT™ có pH khoảng 7 và độ thẩm thấu ở mức từ 250 đến 310 mOsm/kg.

DƯỢC LÝ LÂM SÀNG

Các đặc tính dược lực học

Nhóm dược trị liệu: Thuốc dùng trong nhãn khoa; thuốc làm giảm sung huyết và thuốc chống dị ứng; Các thuốc chống dị ứng khác

Mã ATC: S01G X10

Epinastine là một chất đối kháng thụ thể H_1 trực tiếp, có hoạt tính tại chỗ và là chất ức chế phóng thích histamin từ dưỡng bào. Epinastine có hoạt tính chọn lọc đối với thụ thể histamin H_1 và có ái lực đối với thụ thể histamin H_2. Epinastine còn có ái lực đối với các thụ thể α_1-, α_2- và 5-HT_2. Epinastine không thấm qua hàng rào máu não do đó không có khả năng gây ra các tác dụng phụ đối với hệ thần kinh trung ương.

Các đặc tính dược động học

14 người bị viêm kết mạc dị ứng được nhỏ 1 giọt dung dịch nhỏ mắt RELESTAT™ vào mỗi mắt, 2 lần/ngày trong 7 ngày. Vào ngày 7, nồng độ epinastine tối đa trung bình trong huyết tương đạt được là 0,04 ± 0,014 ng/ml sau khoảng 2 giờ cho thấy nồng độ thuốc tồn lưu trong toàn thân thấp. Trong khi những nồng độ này thể hiện sự tăng hơn những nồng độ ghi nhận được sau khi dùng một liều đơn, các trị số diện tích dưới đường cong nồng độ (AUC) vào ngày 1 và ngày 7 không thay đổi cho thấy là không có tăng sự hấp thu toàn thân khi dùng đa liều. Epinastine gắn kết 64% với các protein huyết tương. Độ thanh thải toàn thân toàn phần khoảng 56 lít/giờ và thời gian bán thải cuối trong huyết tương khoảng 12 giờ. Epinastine được thải trừ chủ yếu dưới dạng không đổi. Khoảng 55% liều dùng đường tĩnh mạch được tìm thấy dưới dạng không đổi trong nước tiểu với khoảng 30% trong phân. Dưới 10% epinastine được chuyển hóa. Thải trừ qua thận chủ yếu qua sự bài tiết chủ động ở ống thận.

Các nghiên cứu lâm sàng: Epinastine HCl 0,05% đã cho thấy là chất tốt hơn một cách rõ rệt trong việc cải thiện ngứa mắt ở những bệnh nhân bị viêm kết mạc dị ứng trong các nghiên cứu lâm sàng sử dụng 2 mô hình khác nhau: (1) mô hình dùng kháng nguyên kết mạc (CAC) trong đó bệnh nhân được nhỏ thuốc sau đó được nhỏ kháng nguyên vào túi cùng kết mạc dưới; và (2) các nghiên cứu môi trường trong đó bệnh nhân được nhỏ thuốc và được đánh giá trong suốt mùa dị ứng ở nơi cư trú của họ. Các kết quả đã chứng minh epinastine HCl 0,05% có khởi phát tác dụng nhanh trong vòng 3 đến 5 phút sau khi dùng kháng nguyên kết mạc. Thời gian tác dụng cho thấy là 8 giờ, lập nên chế độ điều trị thích hợp là 2 lần/ngày. Chế độ dùng thuốc này cho thấy là an toàn và hiệu quả đến 8 tuần mà không có dấu hiệu về sự giảm đáp ứng cấp

CHỈ ĐỊNH

Dung dịch nhỏ mắt RELESTAT™ được chỉ định để điều trị và/hay phòng ngừa ngứa mắt liên quan với viêm kết mạc dị ứng ở bệnh nhân thanh thiếu niên (12 tuổi trở lên) & người lớn.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

Dung dịch nhỏ mắt RELESTAT™ chống chỉ định đối với những bệnh nhân quá mẫn cảm với epinastine hoặc với bất kỳ thành phần nào của thuốc.

CẢNH BÁO

RELESTAT™ chỉ được dùng tại chỗ đường mắt, không được tiêm hoặc dùng đường uống.

THẬN TRỌNG

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng. Nếu cần thêm thông tin xin hỏi ý kiến bác sĩ.

Thuốc này chỉ dùng theo đơn của bác sĩ.

Thông tin cho bệnh nhân:

Cần khuyên bệnh nhân không mang kính sát tròng nếu đang bị đỏ mắt. Không nên dùng dung dịch nhỏ mắt RELESTAT™ để điều trị kích ứng mắt do kính sát tròng. Chất bảo quản benzalkonium clorid trong RELESTAT™ có thể bị hấp thu bởi kính sát tròng mềm.

Bệnh nhân đeo kính sát tròng mềm (ưa nước) cần được hướng dẫn về việc bỏ kính sát tròng trước khi nhỏ RELESTAT™ và đợi 10-15 phút để dung dịch thẩm thấu trước khi đeo lại kính sát tròng.

Cần chỉ dẫn cho bệnh nhân tránh để đầu lọ thuốc tiếp xúc với mắt, vùng quanh mắt, ngón tay hoặc bất kỳ bề mặt nào khác để tránh nhiễm bẩn dung dịch do các vi khuẩn thông thường đã biết gây ra nhiễm trùng mắt. Tổn thương mắt nghiêm trọng và mất thị lực sau đó có thể là do sử dụng các dung dịch bị nhiễm bẩn.

Nên giữ lọ thuốc được đóng kín khi chưa sử dụng.

Tác dụng gây ung thư, gây đột biến, suy giảm khả năng sinh sản:

Trong các nghiên cứu gây ung thư theo chế độ ăn trong 18 tháng trên chuột nhắt hoặc 2 năm trên chuột cống, epinastine không gây ung thư với liều đến 40 mg/kg [cao hơn khoảng 30.000 lần so với liều khuyến nghị tối đa cho người dùng cho mắt là 0,0014 mg/kg/ngày (MROHD) tính theo mg/kg cân nặng, giả sử 100% được hấp thu ở người và ở động vật].

Các lô epinastine mới được tổng hợp không có tính gây đột biến trong thử nghiệm Ames/*Salmonella* và thử nghiệm về bất thường nhiễm sắc thể *in vitro* sử dụng các tế bào lympho ở người. Đã ghi nhận các kết quả dương tính với những lô epinastine đầu tiên trong 2 nghiên cứu về bất thường nhiễm sắc thể *in vitro* được tiến hành trong thập niên 1980 dùng các tế bào lympho ngoại biên và tế bào V79 ở người, tương ứng. Epinastine cho kết quả âm tính trong các nghiên cứu gây gãy nhiễm sắc thể trên cơ thể sống (*in vivo*), bao gồm thử nghiệm nhân nhỏ ở chuột nhắt và thử nghiệm về bất thường nhiễm sắc thể ở chuột Hamster Trung quốc. Epinastine cũng cho kết quả âm tính trong thử nghiệm đổi dạng tế bào sử dụng tế bào phôi chuột Hamster Syrian, thử nghiệm đột biến điểm sử dụng tế bào động vật có vú V79/HGPRT và thử nghiệm tổng hợp DNA không định trước *in vivo/in vitro* sử dụng tế bào gan nguyên thủy của chuột cống.

Epinastine không có tác dụng trên khả năng sinh sản của chuột cống đực. Đã quan sát thấy giảm khả năng sinh sản ở chuột cống cái khi được dùng liều uống gấp khoảng 90.000 lần liều khuyến nghị tối đa cho người dùng cho mắt (MROHD).

Phụ nữ có thai:

Tác dụng gây quái thai

Trong một nghiên cứu về sự phát triển phôi thai trên chuột cống mang thai, đã quan sát thấy độc tính ở chuột mẹ mà không có tác dụng trên phôi thai ở liều uống gấp khoảng 150.000 lần lần liều khuyến nghị tối đa cho người dùng cho mắt (MROHD). Toàn bộ sự tiêu thai và sẩy thai ghi nhận được trong một nghiên cứu phôi thai trên thỏ mang thai ở liều uống gấp khoảng 55.000 lần liều khuyến nghị tối đa cho người dùng cho mắt (MROHD). Trong cả hai nghiên cứu, không thấy tác dụng gây quái thai do thuốc.

Epinastine làm giảm lên cân ở chuột con sau khi cho chuột cống mẹ dùng liều uống gấp khoảng 90.000 lần liều khuyến nghị tối đa cho người dùng cho mắt (MROHD).

Tuy nhiên, chưa có các nghiên cứu đầy đủ và được kiểm soát tốt ở phụ nữ có thai. Tính an toàn của viên nén epinastine hydrochloride (10 hoặc 20mg một lần/ngày) đã được đánh giá trên 11 phụ nữ mang thai. Không quan sát thấy tác dụng có hại nào của thuốc và không thấy có ảnh hưởng của epinastine lên phụ nữ có thai, sinh nở hoặc trẻ sơ sinh. Do các nghiên cứu về sự sinh sản trên động vật không phải bao giờ cũng dự đoán được đáp ứng trên người, chỉ nên dùng dung dịch nhỏ mắt RELESTAT™ trong thai kỳ nếu lợi ích dự tính cao hơn nguy cơ có thể có đối với thai nhi.

Bà mẹ cho con bú:

Một nghiên cứu trên chuột cống cho con bú đã phát hiện sự bài tiết epinastine qua sữa của chuột mẹ. Chưa rõ có phải thuốc này được bài tiết qua sữa người hay không. Do có nhiều loại thuốc được bài tiết qua sữa mẹ nên cần thận trọng khi dùng dung dịch nhỏ mắt RELESTAT™ cho phụ nữ đang cho con bú.

Sử dụng trong nhi khoa:

Chưa có các nghiên cứu đầy đủ và có kiểm soát về ảnh hưởng của RELESTAT™ lên trẻ em dưới 3 tuổi. Độ an toàn trong chỉ định nhãn khoa của dung dịch nhỏ mắt epinastine đã được kiểm tra trên 96 trẻ em trong độ tuổi từ 3-12 tuổi, và kết quả là an toàn & dung nạp tốt. An toàn và hiệu quả của epinastine đối với bệnh nhân >12 tuổi đã được xác định.

Sử dụng cho người già:

RELESTAT™ chưa được nghiên cứu ở những bệnh nhân lớn hơn 65 tuổi. Dữ liệu nghiên cứu về tính an toàn sau khi thuốc lưu hành cho dạng viên nén epinastine hydrochloride (lên đến liều 20 mg mỗi ngày một lần) đã chỉ ra rằng không có vấn đề đặc biệt nào về tính an toàn trên bệnh nhân cao tuổi so với người trưởng thành trẻ tuổi; do đó, không cần thiết phải điều chỉnh liều lượng.

TƯƠNG TÁC VỚI CÁC THUỐC KHÁC VÀ CÁC DẠNG TƯƠNG TÁC KHÁC

Chưa có các nghiên cứu về tương tác thuốc được thực hiện.

Không có các tương tác thuốc-thuốc được dự đoán trên người vì nồng độ epinastine toàn thân rất thấp sau khi nhỏ mắt. Hơn nữa, ở người, epinastine chủ yếu được thải trừ dưới dạng không đổi cho thấy mức chuyển hóa tối thiểu.

TÁC ĐỘNG TRÊN KHẢ NĂNG LÁI XE VÀ SỬ DỤNG MÁY MÓC

Như với bất kỳ loại thuốc nhỏ mắt nào, nếu bị nhìn mờ thoáng qua lúc nhỏ thuốc, bệnh nhân nên chờ cho đến khi nhìn rõ trở lại trước khi lái xe hoặc sử dụng máy móc.

PHẢN ỨNG PHỤ

Trong các nghiên cứu lâm sàng với dung dịch nhỏ mắt epinastine hydrochloride 0,05%, hầu hết các phản ứng có hại là ở mắt và ở mức độ nhẹ và không nghiêm trọng.

Các tác dụng phụ ≥ 1,0% từ các nghiên cứu với thời gian điều trị ít nhất là 2 tuần được liệt kê trong Bảng 1.

Bảng 1: Tác Dụng Phụ ≥ 1,0%: Số lượng (%) các tác dụng phụ liên quan đến điều trị và các tác dụng phụ chung trong nghiên cứu trên thuốc nhỏ mắt Epinastine HCl 0,05% với thời gian điều trị ít nhất 2 tuần*

Bệnh nhân điều trị ≥ 2 tuần [a,c] (N=489)		
	Tác dụng phụ liên quan đến điều trị	**Tác dụng phụ chung**
Rối loạn mắt		
Cảm giác bỏng rát/ kích ứng mắt	18 (3,7%)	22 (4,5%)

** Tác dụng phụ liên quan đến điều trị (được coi như phản ứng có hại) xảy ra với tỉ lệ ≥ 1% được liệt kê trong bảng này. Tất các các tác dụng phụ bất kể mọi nguyên nhân đều được liệt kê ra để tham khảo*

Bảng 2 trình bày các tác dụng phụ liên quan đến điều trị xảy ra với tỉ lệ < 1,0% trong các nghiên cứu lâm sàng trên.

Bảng 2: Tác Dụng Phụ < 1,0%: Số lượng (%) các tác dụng phụ liên quan đến điều trị và các tác dụng phụ chung trong nghiên cứu trên thuốc nhỏ mắt Epinastine HCl 0,05% với thời gian điều trị ít nhất 2 tuần*

Bệnh nhân điều trị ≥ 2 tuần [a,c] (N=489)		
	Tác dụng phụ liên quan đến điều trị	**Tác dụng phụ chung**
Rối loạn hệ thống thần kinh trung ương		
Đau đầu	3 (0,6%)	16 (3,3%)
Rối loạn mắt		
Sung huyết kết mạc	2 (0,4%)	4 (0,8%)
Ngứa mắt	2 (0,4%)	3 (0,6%)
Rối loạn thị giác	2 (0,4%)	2 (0,4%)
Ghèn mắt	1 (0,2%)	2 (0,4%)
Khô mắt	1 (0,2%)	3 (0,6%)
Rối loạn hô hấp, ngực và trung thất		
Hen suyễn	2 (0,4%)	3 (0,6%)
Kích ứng mũi	1 (0,2%)	3 (0,6%)
Viêm mũi	1 (0,2%)	10 (2,0%)
Rối loạn tiêu hóa		
Thay đổi vị giác	3 (0,6%)	3 (0,6%)

** Tác dụng phụ liên quan đến điều trị (được coi như phản ứng có hại) xảy ra với tỉ lệ < 1% được liệt kê trong bảng này. Tất các các tác dụng phụ bất kể mọi nguyên nhân đều được liệt kê ra để tham khảo*

Kinh nghiệm hậu mãi:

Các phản ứng có hại như xung huyết mắt, tăng chảy nước mắt và đau mắt đã xảy ra khi lưu hành thuốc nhỏ mắt RELESTAT™ trong thực hành lâm sàng. Do đây là những báo cáo tự nguyện trên một nhóm dân số có quy mô không được biết, do vậy không thể ước tính được tần suất.

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

QUÁ LIỀU

Sau khi nhỏ dung dịch nhỏ mắt epinastine hydrochloride 0,3% 3 lần/ngày (tương ứng với 9 lần liều khuyến nghị mỗi ngày), đã quan sát thấy sự co đồng tử có thể hồi phục được mà không có ảnh hưởng trên thị lực hoặc các thông số về mắt khác.

Lọ RELESTAT™ 5 mL chứa 2,5 mg epinastine hydrochloride. Dạng viên đã được tiếp thị với liều uống đến 20 mg epinastine hydrochloride, 1 lần/ngày, như vậy không có khả năng nhiễm độc sau khi uống dạng nhỏ mắt, ngay cả khi uống hết cả thuốc trong một lọ.

Không có trường hợp quá liều nào được báo cáo.

LIỀU LƯỢNG VÀ CÁCH DÙNG

Thuốc nhỏ mắt.

Liều khuyến nghị là một giọt vào mỗi mắt, 2 lần/ngày.

Nên tiếp tục điều trị trong suốt giai đoạn phơi nhiễm (tức là cho đến khi mùa phấn hoa đã qua hoặc cho đến khi sự phơi nhiễm với dị nguyên đã hết), ngay cả khi không có triệu chứng.

RELESTAT™ có thể được dùng cho bệnh nhân thanh thiếu niên (12 tuổi trở lên) với cùng liều chỉ định cho người lớn.

Chưa có kinh nghiệm trên nghiên cứu lâm sàng về việc sử dụng RELESTAT™ lâu hơn 8 tuần. Nếu bệnh nhân sử dụng thêm 1 loại thuốc tra mắt nào khác, thì nên sử dụng cách xa nhau ít nhất 10 phút.

QUY CÁCH ĐÓNG GÓI

RELESTAT™ (dung dịch nhỏ mắt epinastine HCl) 0,05% được chứa trong lọ nhựa polyethylene tỷ trọng thấp (LDPE) màu trắng đục vô khuẩn có đầu nhỏ giọt và nắp polystyrene có độ cứng cao (HIPS) màu trắng như sau:

5 mL đóng trong lọ dung tích 10 mL.

BẢO QUẢN

Bảo quản dưới 30°C. Tránh ánh sáng. Giữ lọ thuốc được đóng kín.

Để xa tầm tay trẻ em.

HẠN DÙNG

24 tháng kể từ ngày sản xuất.

Hủy bỏ phần thuốc không dùng sau khi mở bao bì được 4 tuần.

Không dùng thuốc quá hạn sử dụng đã ghi trên bao bì.

NHÀ SẢN XUẤT:

Allergan Pharmaceuticals Ireland

Castlebar Road, Westport, County Mayo, Ireland.

© 2017 Allergan. Tất cả bản quyền thuộc công ty Allergan.
Tất cả các thương hiệu là tài sản riêng của chủ sở hữu tương ứng.

Ngày sửa đổi: 13/09/2017.