

Thuốc bán theo đơn

## LERTAZIN 5MG

Levocetirizine dihydrochloride 5mg

Công thức:

Mỗi viên nén bao phim chứa:

Hoạt chất:

Levocetirizine dihydrochloride .....5mg

Tá dược: Lactose monohydrate, microcrystalline cellulose, Colloida anhydrous silica, Magnesium Stearate, opadry white.

Dạng bào chế: viên nén bao phim.

Dược lực học:

Levocetirizine là thuốc kháng histamine mạnh, dẫn xuất piperazine.

Levocetirizine, đồng phân quang học R của cetirizine, có tác dụng đối kháng chọn lọc ở thụ thể H1. Những nghiên cứu đã chứng minh rằng levocetirizine có ái lực cao với thụ thể H1 trên người ( $K_i = 3.2 \text{ nmol/l}$ ). Levocetirizine có ái lực cao hơn hai lần so với cetirizine ( $K_i = 6.3 \text{ nmol/l}$ ). Levocetirizine được tách ra từ thụ thể H1 với thời gian bán thải là  $115 \pm 38$  phút. Những nghiên cứu dược lực ở người tình nguyện chứng minh rằng với levocetirizine với liều một nửa có tác dụng bằng với cetirizine trên da và tóc. Trong nghiên cứu in vitro cho thấy levocetirizine ức chế eotaxine gây ra sự di rời của bạch cầu ưa eosin qua tế bào da và phổi. Một nghiên cứu dược động học cho thấy ba tác dụng ức chế chính của levocetirizine 5mg trong 6 giờ đầu của phản ứng dị ứng với phấn hoa, so với 14 bệnh nhân dùng giả dược. Ức chế phóng thích VCAM-1, điều chỉnh độ thấm thấu của thành mạch và giảm bạch cầu ái toan. Hiệu quả và tính an toàn của

levocetirizine trong một số nghiên cứu mù đôi, dùng giả dược, những thử nghiệm lâm sàng được thực hiện ở những bệnh nhân trưởng thành bị viêm mũi dị ứng theo mùa.

Dược động học:

Hấp thu:

Levocetirizine được hấp thu nhanh và rộng rãi sau khi uống. Nồng độ đỉnh trong huyết tương đạt được sau 0.9 giờ uống thuốc. Trạng thái ổn định đạt được sau 2 ngày. Nồng độ đỉnh theo thứ tự là 270ng/ml và 308ng/ml sau khi dùng liều duy nhất và liều lặp lại 5mg ngày 1 lần. Mức độ hấp thu thì độc lập với liều và không bị ảnh hưởng bởi thức ăn, nhưng nồng độ đỉnh giảm và thời gian chậm.

Phân phối:

Levocetirizine không phân bố trong mô, cũng như đi qua hàng rào máu não. 90% levocetirizine gắn với protein huyết tương. Thể tích phân bố là 0.4l/kg.

Chuyển hóa:

Sự chuyển hóa của levocetirizine ít hơn 14% liều và vì thế những kết quả khác nhau từ biến đổi gen hoặc uống kèm cùng với chất ức chế enzyme không đáng kể. Giai đoạn chuyển hóa bao gồm sự oxy hóa, N- và alkyl hóa O- và kết hợp với taurine. Quá trình alkyl hóa qua trung gian CYP 3A4 trong khi quá trình oxy hóa liên quan đến đồng dạng CYP nhiều và/hoặc không xác định.

Levocetirizine không ảnh hưởng đến hoạt động CYP isoenzyme 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 và 3A4 ở nồng độ cao hơn nồng độ đỉnh đạt được sau khi sử dụng liều 5mg. Do sự chuyển hóa thấp và không có sự ức chế trao đổi chất, nên sự tương tác giữa levocetirizine và các chất khác là không thể.

Thải trừ:

Nửa đời huyết tương của levocetirizine là  $7.9 \pm 1.9$ h. Độ thanh thải là 0.63 ml/phút/kg. Levocetirizine và chất chuyển



hóa thải trừ chủ yếu thông qua nước tiểu, chiếm 85.4%. Bài tiết qua phân chỉ chiếm 12.9%.

Chỉ định điều trị:

Điều trị các biểu hiện dị ứng do Histamin như: Viêm mũi dị ứng, mày đay...

Chống chỉ định:

Với những người mẫn cảm với levocetirizine và dẫn xuất piperazine, hoặc những thành phần khác của thuốc. Bệnh nhân suy thận nặng có độ thanh thải creatinine ít hơn 10ml/phút.

Liều dùng và cách dùng:

Người lớn và trẻ em trên 12 tuổi: Liều khuyến cáo là 5mg mỗi ngày.

Người già: Điều chỉnh liều ở bệnh nhân suy thận vừa và nặng.

Trẻ em từ 6 đến 12: liều hàng ngày là 5mg

Trẻ em dưới 6 tuổi: Levocetirizine không được khuyến cáo sử dụng ở bệnh nhân dưới 6 tuổi.

Bệnh nhân suy thận:

Khoảng cách phải được điều chỉnh theo chức năng thận. Phải đánh giá độ thanh thải creatinin của bệnh nhân (CLcr). CLcr (ml/phút) được đánh giá bằng cách xác định creatinine trong huyết thanh

$$CL_{CR} = \frac{[140 - \text{tuổi}]}{72} \times \text{cân nặng (kg)} \quad (\times 0.85 \text{ đối với phụ nữ})$$

Điều chỉnh liều ở bệnh nhân suy thận như sau:

Nhóm	Độ thanh thải Creatinine (ml/min)	Liều dùng
Chức năng thận bình thường	≥80	1 × 1 viên mỗi ngày
Suy thận nhẹ	50-79	1 × 1 viên mỗi ngày

Suy thận vừa	30-49	1 viên mỗi 2 ngày
Suy thận nặng	<30	1 viên mỗi 3 ngày
Thận giai đoạn cuối – bệnh nhân lọc thận	<10-	Chống chỉ định

Bệnh nhân suy gan: Không cần giảm liều ở những bệnh nhân chỉ bị suy gan. Bệnh nhân suy gan và thận cần điều chỉnh liều.

Khoảng thời gian điều trị:

Khoảng thời gian điều trị phụ thuộc vào loại bệnh, khoảng thời gian bị bệnh và chu kỳ của bệnh. Đối với sốt cỏ khô, nói chung khoảng thời gian điều trị là 3-6 tuần là đủ nếu tiếp xúc với phấn hoa ngắn trong khoảng 1 tuần. Đã có các bằng chứng lâm sàng về chế độ điều trị 4 tuần với viên nén bao phim Levocetirizine 5mg. Đối với chàm mạn tính và viêm mũi dị ứng mạn tính đã có dữ liệu lâm sàng về thời gian điều trị lên đến 1 năm đối với chất đồng phân racemic và lên đến 18 tháng đối với bệnh nhân sản ngứa có liên quan đến viêm da dị ứng.

Thận trọng và cảnh báo:

Thận trọng ở bệnh nhân có uống rượu.

Lertazin 5 mg viên nén bao phim chứa lactose. Bệnh nhân với vấn đề di truyền hiếm gặp của không dung nạp galactose, thiếu hụt lactase Lapp hoặc kém hấp thu glucose-galactose không nên dùng thuốc này.

Tác dụng không mong muốn:

Thường gặp (>1/100 đến <1/10): khô miệng, đau đầu, mệt mỏi, ngứa gà.

Không thường gặp (>1/1000 đến <1/100): mệt mỏi, đau bụng

Rất hiếm gặp (<1/10000): Tăng cân, xét nghiệm chức năng gan bất thường, rối loạn tim mạch: đánh trống ngực, loạn thị, rối loạn hô hấp: khó thở, rối loạn tiêu hóa: buồn nôn, da và

các rối loạn mô dưới da: phù, ngứa, phát ban da, nổi mề đay, rối loạn hệ thống miễn dịch: mẫn cảm bao gồm sốc phản vệ, rối loạn gan mật: viêm gan.

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

Tương tác thuốc:

Chưa có nghiên cứu tương tác thuốc của Levocetirizine (bao gồm chưa có nghiên cứu với những chất tăng cường CYP3A4). Những nghiên cứu về các chất đồng phân racemic của Cetirizine cho thấy không có tương tác với

Pseudoephedrine, Cimetidine, Ketoconazole, Erythromycin, Azithromycin, glipizide và diazepam. Người ta quan sát thấy có sự giảm nhẹ độ thanh thải cetirizine (16%) trong nghiên cứu dùng đa liều phối hợp với theophylline (400mg duy nhất mỗi ngày). Trong khi đó theophylline có khuynh hướng không bị ảnh hưởng bởi thuốc kèm theo cetirizine. Sự hấp thu của levocetirizine không bị ảnh hưởng bởi thức ăn nhưng tỷ lệ hấp thu bị giảm.

Ở một số bệnh nhân nhạy cảm thì khi sử dụng Cetirizine hoặc Levocetirizine cùng với rượu hoặc các thuốc ức chế thần kinh trung ương thì có thể gây tác dụng bất lợi trên hệ thống thần kinh trung ương.

Phụ nữ có thai và cho con bú:

Levocetirizine không gây quái thai ở động vật, nhưng không có nghiên cứu đầy đủ trên người mang thai, cho nên không dùng cho phụ nữ đang mang thai và cho con bú.

Lái xe và vận hành máy móc:

Tránh sử dụng những phương tiện máy móc, lái xe khi dùng thuốc này.

Sử dụng quá liều và điều trị:

Triệu chứng: ngủ gà ở người lớn; ban đầu là lo âu và kích

động, sau đó là ngủ gà ở trẻ em.

Điều trị: Chưa có thuốc giải độc đặc hiệu với levocetirizine. Nếu quá liều xảy ra thì điều trị triệu chứng và điều trị duy trì. Rửa dạ dày nên được cân nhắc nếu khoảng thời gian quá liều ngắn. Loại trừ levocetirizine bằng phương pháp thẩm phân là không có hiệu quả.

Bảo quản:

Bảo quản nơi khô mát, nhiệt độ không quá 30°C, tránh ánh sáng.

Để xa tầm tay trẻ em.

Hạn dùng: 3 năm.

Không được dùng thuốc khi quá thời hạn sử dụng ghi trên nhãn.

Đóng gói: Hộp 3 vỉ x 10 viên nén bao phim.

Tiêu chuẩn: nhà sản xuất.

Lời khuyến cáo:

Thuốc này chỉ dùng theo sự kê đơn của thầy thuốc.

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.

Nếu cần thêm thông tin xin hỏi ý kiến bác sĩ.

Sản xuất bởi:

KRKA, d.d., Novo mesto, Šmarješka cesta 6, 8501 Novo mesto, Slovenia

Đăng ký bởi:



**TENAMYD PHARMA CORP.**