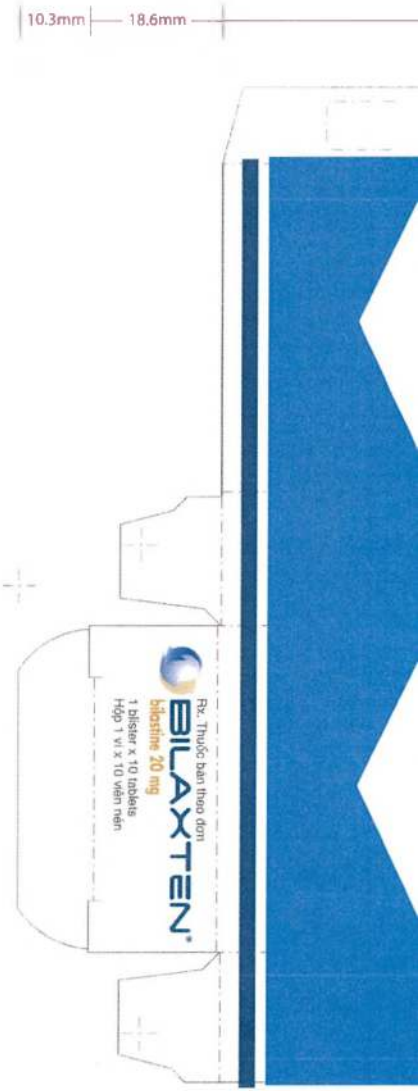
A. MENARINI SINGAPORE PTE. LTD. SINGAPORE
VĂN PHÒNG ĐẠI DIỆN TẠI TP. HÀ NỘI

BỘ Y TẾ
CỤC QUẢN LÝ DƯỢC
ĐÃ PHÊ DUYỆT
05-09-2016
Lần đầu:...../...../.....

Pantone 144C | Pantone 3005C | Pantone 032C
Pantone 541C | Black

IPM number: 2013MEN-258-1
Product name: BILAXTEN bilastine 20mg x 4 tablets
Countries: Vietnam
Version: 6
Date: 22 May 2013



Pantone 144C | Pantone 3005C | Pantone 032C

Pantone 541C | Black

IPM number: 2013MEN-272-1
Product name: BILAXTEN bilastine 20mg x10 tablets
Countries: Vietnam
Version: 3
Date: 22 May 2013

114mm

18.6mm

10.3mm

11mm

47.5mm

19.5mm

47.5mm

7.8mm

18.8mm

Each tablet contains 20 mg of bilastine.
Indication, administration, contra-indication and noted signs, please see packing insert.
Store below 30°C. Keep out of reach of children. Read package insert carefully before use.

Lot/Số lô SX:
MFD/Ngày SX:
EXP/HD:

Mỗi viên nén chứa 20 mg bilastine.
Chỉ định, cách dùng, chống chỉ định và các dấu hiệu lưu ý: xin đọc trong tờ hướng dẫn sử dụng.
Bảo quản dưới 30°C. Để xa tầm tay trẻ em. Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.

Marketing Authorisation Holder/Công ty đăng ký: A.Menarini Singapore Pte. Ltd
30 Pasir Panjang Road #08-32 Mapletree Business City Singapore 117440
Under license granted by FAES FARMA S.A. Spain

2013MEN-2272-1

Manufactured by/SX bởi:
A. Menarini Manufacturing Logistics and Services S.r.l.
Via Campo di Pile L'Aquila (AQ), I-67100, Italy
Batch controlled by/Kiểm nghiệm bởi:
A. Menarini Manufacturing Logistics and Services S.r.l.
Via Sette Santi, 3 50131 Firenze Italy

MENARINI

Rx. Thuốc bán theo đơn

BILAXTEN®

bilastine 20 mg

1 blister x 10 tablets
Hộp 1 vỉ x 10 viên nén

Reg.No/SĐK:

Importer/DNNK:

MENARINI

BILAXTEN®
bilastine 20 mg

A. MENARINI SINGAPORE PTE. LTD. SINGAPORE
VĂN PHÒNG ĐẠI DIỆN TẠI TP. HÀ NỘI

Pantone 144C | Pantone 3005C | Pantone 032C

Pantone 541C | Black

IPM number: 2013MEN-273-1
Product name: BILAXTEN bilastine 20mg x 20 tablets
Countries: Vietnam
Version: 3
Date: 22 May 2013

114mm

18.6mm

10.3mm

11mm

47.5mm

19.5mm

47.5mm

7.8mm

18.8mm

Each tablet contains 20 mg of bilastine
Indication, administration, contra-indication and noted signs, please see packing insert
Store below 30°C. Keep out of reach of children. Read package insert carefully before use

Lot/Số lô SX:

MFD/Ngày SX:

EXP/HD

Mỗi viên nén chứa 20 mg bilastine
Chỉ định, cách dùng, chống chỉ định và các dấu hiệu lưu ý, xin đọc trong tờ hướng dẫn sử dụng
Bảo quản dưới 30°C. Để xa tầm tay trẻ em. Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng

Marketing Authorisation Holder/Công ty đăng ký: A.Menarini Singapore Pte. Ltd
30 Pasir Panjang Road #08-32, Mapletree Business City Singapore 117440

Under license granted by FAES FARMA S.A. Spain

2013MEN-273-1

Manufactured by/SX bởi:
A. Menarini Manufacturing Logistics and Services S.r.l.
Via Campo di Pile, L'Aquila (AQ), I-67100, Italy
Batch controlled by/Kiểm nghiệm bởi
A. Menarini Manufacturing Logistics and Services S.r.l.
Via Sette Santi, 3 50131 Firenze Italy

MENARINI

VĂN PHÒNG ĐẠI DIỆN TẠI TP. HÀ NỘI
A. MENARINI SINGAPORE PTE. LTD.

Rx. Thuốc bán theo đơn

BILAXTEN®

bilastine 20 mg

2 blister x 10 tablets
Hộp 2 vỉ x 10 viên nén

Reg.No/SĐK:

Importer/DNNK:

MENARINI

BILAXTEN®
bilastine 20 mg

Pantone 144C | Pantone 3005C | Pantone 032C

Pantone 541C | Black

IPM number: 2013MEN-274-1
Product name: BILAXTEN bilastine 20mg x 30 tablets
Countries: Vietnam
Version: 4
Date: 22 May 2013

Manufactured by /SX bởi
A. Menarini Manufacturing Logistics and Services S.r.l.
Via Campo di Pile, L'Aquila (AQ), 67100, Italy
Batch controlled by/Kiểm nghiệm bởi
A. Menarini Manufacturing Logistics and Services S.r.l.
Via Sette Santi, 3 50131 Firenze Italy

MENARINI

Rx. Thuốc bán theo đơn

BILAXTEN®

bilastine 20 mg

3 blister x 10 tablets
Hộp 3 vỉ x 10 viên nén

Reg No/SĐK

Importer/DNNK

MENARINI

5mm

BILAXTEN®
bilastine 20 mg
3 blister x 10 tablets
Hộp 3 vỉ x 10 viên nén

Bilastine-containing 20 mg of Bilastine.
Indication, administration, contra-indication and dosage, please see packing insert.
Store below 30°C. Keep out of reach of children. Read package insert carefully before use.

Mẫu mỗi lần dùng 20 mg của Bilastine.
Chỉ định, cách dùng, chống chỉ định và các dấu hiệu lưu ý, xin đọc trong tờ hướng dẫn sử dụng.
Bảo quản dưới 30°C. Để xa tầm tay trẻ em. Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.

Under license granted by FAES FARMA S.A. Spain

MFD Ngày S.X.
XX XX 20XX
2mm
20mm

A. MENARINI SINGAPORE PTE. LTD. SINGAPORE
VĂN PHÒNG ĐẠI DIỆN TẠI TP. HÀ NỘI

Pantone 144C Pantone 3005C Pantone 032C

Pantone 541C Black

IPM number: 2013MEN-275-1
Product name: BILAXTEN bilastine 20mg x 40 tablets
Countries: Vietnam
Version: 4
Date: 22 May 2013

Manufactured by SX bởi
A. Menarini Manufacturing Logistics and Services S.r.l.
Via Campo di Pile, L'Aquila (AQ) 67100 Italy
Batch controlled by Kiểm nghiệm bởi
A. Menarini Manufacturing Logistics and Services S.r.l.
via Sette Santi, 3 50131 Firenze Italy

MENARINI

Rx. Thuốc bán theo đơn

BILAXTEN®

bilastine 20 mg

4 blister x 10 tablets
Hộp 4 vỉ x 10 viên nén

Reg.No/SĐK

Importer/DNNK

MENARINI

5mm

BILAXTEN®
bilastine 20 mg
4 blister x 10 tablets
Hộp 4 vỉ x 10 viên nén

A. MENARINI SINGAPORE PTE. LTD. SINGAPORE
VĂN PHÒNG ĐẠI DIỆN TẠI TP. HÀ NỘI

Pantone 144C Pantone 3005C Pantone 032C

Pantone 541C Black

IPM number: 2013MEN-276-1
Product name: BILAXTEN bilastine 20mg x 50 tablets
Countries: Vietnam
Version: 4
Date: 22 May 2013

Manufactured by S.X. bởi
A. Menarini Manufacturing Logistics and Services S.r.l.
Via Campo di Pile, L'Aquila (AQ) 67100 Italy
Batch coordinated by Viêm nghiệm bởi
A. Menarini Manufacturing Logistics and Services S.r.l.
via Sette Santi, 3 50131 Firenze Italy

MENARINI

Rx. Thuốc bán theo đơn

BILAXTEN®

bilastine 20 mg

5 blister x 10 tablets
Hộp 5 vỉ x 10 viên nén

Reg No/SĐK

Importer/DNNK

MENARINI

5mm

BILAXTEN®

bilastine 20 mg

5 blister x 10 tablets
Hộp 5 vỉ x 10 viên nén

MFD/Ngày S.X.

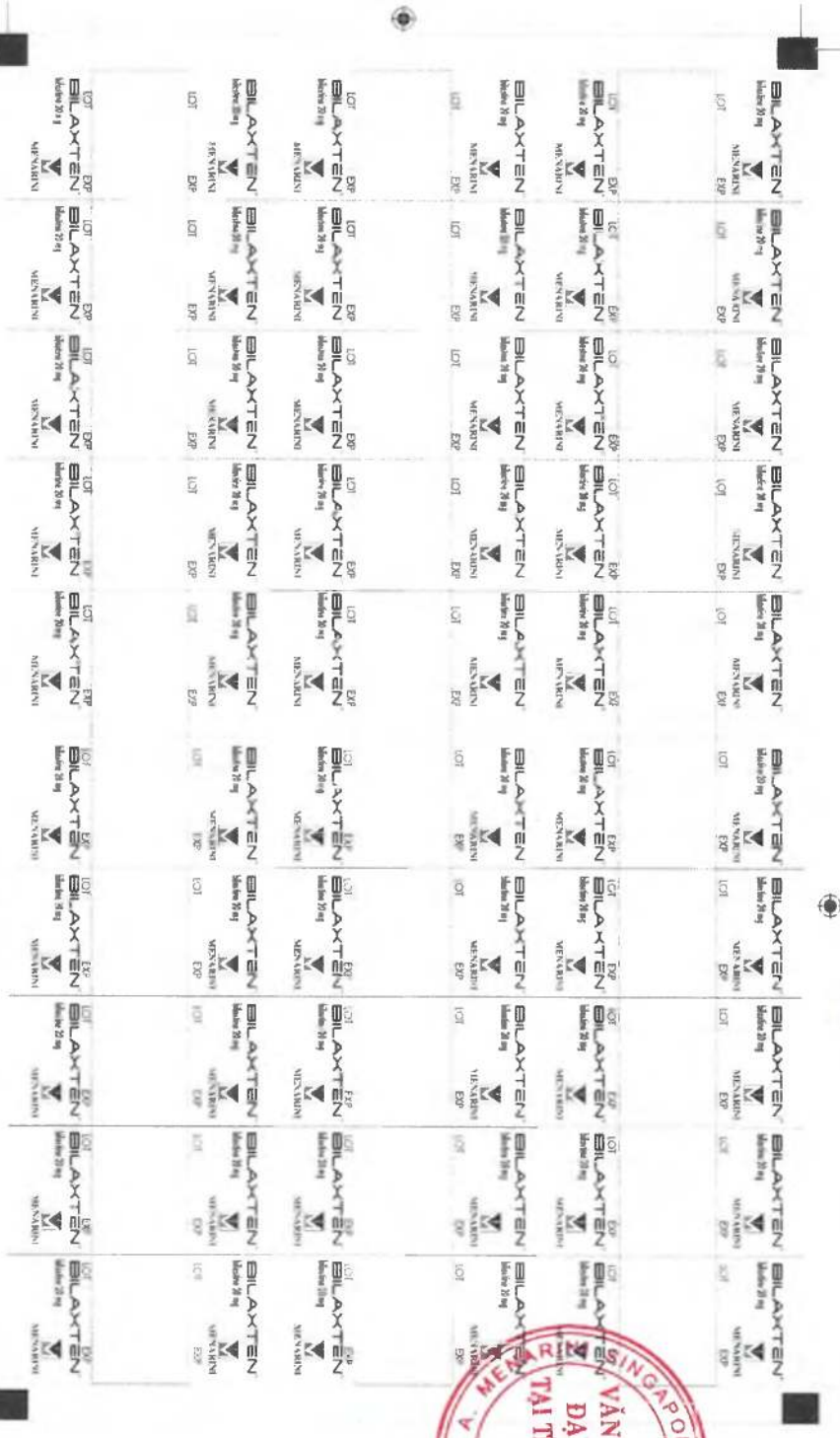
EXP/HSD

2mm

2mm

A. MENARINI SINGAPORE PTE. LTD. SINGAPORE

VĂN PHÒNG
ĐẠI DIỆN
TẠI TP. HÀ NỘI


BILAXTEN
MENARINI
LOT
EXP
VIỆT NAM
VIỆT NAM
VIỆT NAM

BILAXTEN® 20 mg viên nén
Bilastine

A. MENARINI SINGAPORE PTE. LTD. SINGAPORE
VĂN PHÒNG ĐẠI DIỆN TẠI TP. HÀ NỘI

TÊN SẢN PHẨM
BILAXTEN 20 mg viên nén

THÀNH PHẦN ĐỊNH TÍNH VÀ ĐỊNH LƯỢNG
Mỗi viên nén chứa 20 mg Bilastine.

DẠNG TRÌNH BÀY
Viên nén màu trắng hình bầu dục, hai mặt lồi. Giữa viên có vạch chia để bẻ đôi giúp dễ nuốt hơn nhưng không có giá trị để chia đôi liều lượng thuốc.

ĐẶC TÍNH LÂM SÀNG
Chỉ định
Điều trị triệu chứng trong trường hợp viêm mũi dị ứng (quanh năm hoặc theo mùa) và mày đay.

Liều lượng và cách sử dụng
Sử dụng cho người lớn và trẻ em trên 12 tuổi.
Liều dùng 20 mg (1 viên) một lần/ngày để điều trị triệu chứng viêm mũi dị ứng (thường xuyên hoặc theo mùa) và mày đay.

Cần uống thuốc vào thời điểm 1 giờ trước hoặc 2 giờ sau ăn. Nên uống toàn bộ liều trong 1 lần duy nhất trong ngày.

Người cao tuổi
Không cần chỉnh liều trên người cao tuổi (xem phần đặc tính dược động học và dược lực học). Chưa có nhiều bằng chứng về việc sử dụng thuốc ở bệnh nhân trên 65 tuổi.

Trẻ em dưới 12 tuổi
Thông tin về độ an toàn và hiệu quả của bilastine trên trẻ em dưới 12 tuổi vẫn chưa được nghiên cứu đầy đủ.

Bệnh nhân suy thận
Không cần chỉnh liều trên bệnh nhân suy thận (Xem phần Đặc tính dược động học).

Bệnh nhân suy gan
Chưa có dữ liệu lâm sàng về việc dùng thuốc trên bệnh nhân suy gan. Do bilastine không chuyển hóa qua gan mà chủ yếu thải trừ qua thận, tình trạng suy gan có thể không làm nồng độ thuốc trong máu vượt quá giới hạn an toàn. Do đó, không cần chỉnh liều trên bệnh nhân suy gan (Xem phần đặc tính dược động học).

Độ dài đợt điều trị:
Trong điều trị viêm mũi dị ứng, việc điều trị chỉ giới hạn trong khoảng thời gian có tiếp xúc với yếu tố dị nguyên. Cụ thể là, trong điều trị viêm mũi dị ứng theo mùa, có thể ngừng thuốc khi hết triệu chứng và sử dụng lại khi triệu chứng xuất hiện trở lại. Trong điều trị viêm mũi dị ứng quanh năm, nên sử dụng thuốc liên tục trong suốt thời gian tiếp xúc với dị nguyên.
Trong điều trị mày đay, thời gian điều trị phụ thuộc vào dạng mày đay, thời gian và diễn biến của triệu chứng.

Chống chỉ định
Chống chỉ định cho các bệnh nhân quá mẫn với bilastine hoặc bất cứ thành phần tá dược nào trong chế phẩm.

Lưu ý và thận trọng khi sử dụng
Thông tin về hiệu quả và độ an toàn của bilastine trên trẻ em dưới 12 tuổi vẫn chưa được nghiên cứu đầy đủ.

Trên bệnh nhân suy thận nặng hoặc trung bình, việc sử dụng đồng thời bilastine với các chất ức chế glycoprotein P như ketoconazol, erythromycin, cyclosporin, ritonavir hoặc diltiazem có thể làm tăng nồng độ bilastine trong huyết tương, do đó làm tăng nguy cơ xảy ra phản ứng bất lợi. Vì vậy, cần tránh sử dụng đồng thời bilastine và các chất ức chế glycoprotein P trên bệnh nhân suy thận nặng hoặc trung bình.

Tương tác thuốc và các tương tác khác có liên quan
Tương tác với thức ăn: Thức ăn có thể làm giảm sinh khả dụng đường uống của bilastine khoảng 30%.

Tương tác với nước bưởi chùm: uống bilastine 20 mg với nước bưởi chùm làm giảm sinh khả dụng của thuốc 30%. Hiện tượng này có thể xảy ra với các loại nước quả khác. Mức độ giảm sinh khả dụng có thể dao động giữa các chế phẩm và các loại hoa quả khác nhau. Cơ chế của tương tác này là thông qua quá trình ức chế OATP1A2, một chất vận chuyển bilastine từ đường tiêu hóa vào máu (xem mục Đặc tính dược động học). Các thuốc là cơ chất hoặc chất ức chế OATP1A2 như ritonavir hoặc rifampicin có thể làm giảm nồng độ bilastine trong huyết tương.

Tương tác với ketoconazol hoặc erythromycin: Uống đồng thời bilastine và ketoconazol hoặc erythromycin có thể làm tăng AUC của bilastine 2 lần, tăng Cmax 2-3 lần. Điều này có thể giải thích do tương tác với các chất vận chuyển đưa thuốc trở lại lòng ống tiêu hóa, do bilastine là cơ chất của P-gp và không bị chuyển hóa (xem phần Đặc tính dược động học). Những thay đổi này có thể không ảnh hưởng đến mức độ an toàn của bilastine cũng như ketoconazol hoặc erythromycin. Các thuốc khác cũng là cơ chất hoặc chất ức chế P-gp, ví dụ như cyclosporine, cũng có nguy cơ làm tăng nồng độ huyết tương của bilastine.

Tương tác với diltiazem: Uống đồng thời bilastine 20 mg và diltiazem 60 mg làm tăng nồng độ Cmax của bilastine lên 50%. Điều này có thể lí giải do tương tác với các chất vận chuyển đưa thuốc trở lại lòng ống tiêu hóa (xem phần Đặc tính dược động học), và có thể không ảnh hưởng đến mức độ an toàn của bilastine.

Tương tác với rượu: Trạng thái tâm thần vận động sau khi uống đồng thời rượu và 20 mg bilastine tương tự như kết quả ghi nhận sau khi uống đồng thời rượu và giả dược.

Tương tác với lorazepam: Uống đồng thời bilastine 20 mg và lorazepam 3 mg trong 8 ngày không làm tăng tác dụng trên hệ thần kinh trung ương của lorazepam.

Tác động trên khả năng sinh sản, phụ nữ có thai và cho con bú
Tác động trên khả năng sinh sản: Chưa có hoặc rất ít bằng chứng lâm sàng. Một nghiên cứu trên chuột cho thấy không có tác động tiêu cực nào trên chức năng sinh sản (xem phần Dữ liệu an toàn tiền lâm sàng).

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

Nghiên cứu trên động vật không cho thấy tác động có hại trực tiếp hoặc gián tiếp lên khả năng sinh sản, sự phát triển của bào thai và sau sinh (xem phần Dữ liệu an toàn tiền lâm sàng). Tuy nhiên, để đảm bảo an toàn, tránh sử dụng BILAXTEN trong giai đoạn mang thai.

Phụ nữ cho con bú: Thông tin về khả năng bài xuất qua sữa mẹ của bilastine vẫn chưa được biết rõ. Đặc điểm này cũng chưa được nghiên cứu trên động vật. Trên thực tế, cần quyết định tiếp tục/ngừng cho con bú hay tiếp tục/ngừng sử dụng BILAXTEN dựa trên tương quan giữa lợi ích của việc bú mẹ cho trẻ và lợi ích của mẹ khi sử dụng bilastine.

Tác động lên khả năng lái xe và vận hành máy móc
Một nghiên cứu được thực hiện để đánh giá tác động của bilastine lên khả năng lái xe đã cho thấy việc sử dụng liều 20 mg không ảnh hưởng đến khả năng lái xe. Tuy nhiên, bệnh nhân cần được thông báo rằng có một số trường hợp hiếm gặp có thể thấy buồn ngủ và ảnh hưởng đến khả năng vận hành máy móc tàu xe.

Tác dụng không mong muốn
Trong các thử nghiệm lâm sàng, số lượng tác dụng không mong muốn gặp phải ở bệnh nhân viêm mũi dị ứng hoặc mày đay nguyên phát mãn tính được điều trị bằng bilastine 20 mg tương tự với số lượng ghi nhận trên bệnh nhân sử dụng giả dược (12,7% so với 12,8%).

Các phản ứng bất lợi của thuốc (ADRs) thường ghi nhận được trên bệnh nhân sử dụng bilastine 20mg trong thử nghiệm lâm sàng pha II và pha III là đau đầu, buồn ngủ, chóng mặt và mệt mỏi. Các phản ứng này xuất hiện với tuần suất tương tự tần suất ghi nhận được trên bệnh nhân sử dụng giả dược.

Các phản ứng bất lợi ít nhất có thể liên quan đến bilastine và được báo cáo trong hơn 0,1% bệnh nhân dùng bilastine 20mg trong giai đoạn phát triển lâm sàng của thuốc được phân loại dưới đây.

Tần suất ghi nhận như sau:

Rất phổ biến (≥1/10)
Phổ biến (≥1/100 to <1/10)
Không phổ biến (≥1/1.000 to <1/100)
Hiếm gặp (≥1/10.000 to <1/1.000)
Rất hiếm gặp (<1/10.000)
Không rõ (không thể ước tính được từ các dữ liệu hiện có)
Các phản ứng hiếm gặp, rất hiếm gặp và không rõ không được ghi vào bảng.

Hệ cơ quan **Tần suất**	**Phản ứng bất lợi**	**Bilastine 20 mg N=1697**	**All Bilastine Doses N=2525**	**Placebo N=1362**
Nhiễm trùng và nhiễm kí sinh trùng				
Không phổ biến	***Herpes miệng***	2 (0,12%)	2 (0,08%)	0 (0,0%)
Rối loạn chuyển hóa và dinh dưỡng				
Không phổ biến	***Tăng cảm giác thèm ăn***	10 (0,59%)	11 (0,44%)	7 (0,51%)
Rối loạn tâm lý				
Không phổ	***Lo lắng***	6 (0,35%)	8 (0,32%)	0 (0,0%)

biến	*Mất ngủ*	2 (0,12%)	4 (0,16%)	0 (0,0%)
Rối loạn ốc tai, tiền đình				
Không phổ biến	*Ù tai*	2 (0,12%)	2 (0,08%)	0 (0,0%)
	Chóng mặt	3 (0,18%)	3 (0,12%)	0 (0,0%)
Rối loạn nhịp tim				
Không phổ biến	*Blốc 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%)
Rối loạn hệ thần kinh				
Phổ biến	*Buồn ngủ*	52 (3,06%)	82 (3,25%)	39 (2,86%)
	Đau đầu	68(4,01%)	90 (3,56%)	46 (3,38%)
Không phổ biến	*Hoa mắt, chóng mặt*	14 (0,83%)	23 (0,91%)	8 (0,59%)
Rối loạn hô hấp, lồng ngực và trung thất				
Không phổ biến	*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%)
Rối loạn tiêu hóa				
Không phổ biến	*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%)
	Kích ứng 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%)
Rối loạn da và mô mềm				
Không phổ biến	*Mẩn ngứa*	2 (0,12%)	4 (0,16%)	2 (0,15%)
Không phổ biến	*Mệt mỏi*	14 (0,83%)	19 (0,75%)	18 (1,32%)
	Khát	3 (0,18%)	4 (0,16%)	1 (0,07%)
	Tăng tình trạng mệt mỏi sẵn có	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%)

Các chỉ số xét nghiệm				
Không phổ biến	*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 nồng độ creatinin trong máu	2 (0,12%)	2 (0,08%)	0 (0,0%)
	Tăng nồng độ triglicerid trong máu	2 (0,12%)	2 (0,08%)	3 (0,22%)
	Tăng cân	8 (0,47%)	12 (0,48%)	2 (0,15%)

Thông báo với bác sĩ bất kì phản ứng không mong muốn nào gặp phải trong quá trình sử dụng thuốc.

Quá liều

Thông tin liên quan đến các trường hợp quá liều cấp của bilastine mới chỉ giới hạn trong các kết quả thử nghiệm lâm sàng trong giai đoạn phát triển thuốc. Sau khi dùng bilastine với liều cao gấp 10 đến 11 lần liều điều trị (220 mg (liều đơn); hoặc 200 mg/ngày trong 7 ngày), tần suất xuất hiện phản ứng không mong muốn trên người tình nguyện cao gấp 2 lần so với giả dược. Tác dụng không mong muốn được ghi nhận nhiều nhất là chóng mặt, nhức đầu và buồn nôn. Không ghi nhận phản ứng bất lợi nghiêm trọng nào cũng như sự kéo dài đáng kể khoảng QT trên điện tâm đồ.

Một nghiên cứu chéo thông qua thông số QT/QT hiệu chỉnh đã được tiến hành trên 30 người tình nguyện khỏe mạnh nhằm đánh giá tác động của bilastine liều lặp lại (100mg x 4 ngày) lên sự tái phân cực tâm thất. Nghiên cứu đã chỉ ra rằng chế độ dùng nêu trên không làm kéo dài đáng kể giá trị QT hiệu chỉnh.

Trong trường hợp quá liều, cần áp dụng các biện pháp điều trị triệu chứng và điều trị hỗ trợ.

Chưa có thuốc đối kháng đặc hiệu cho bilastine.

ĐẶC TÍNH DƯỢC LÝ

Đặc tính dược lực học

Nhóm dược lý: Thuốc kháng histamin sử dụng đường toàn thân, các thuốc kháng histamin khác sử dụng đường toàn thân. Mã ATC là RO6AX29.

Bilastine là một chất đối kháng histamin không gây buồn ngủ, có tác dụng kéo dài, đối kháng chọn lọc trên thụ thể H_1 ngoại vi và không có ái lực với thụ thể muscarinic.

Bilastine ức chế các phản ứng mẩn ngứa, ban đỏ trên da do histamin trong vòng 24 giờ sau khi sử dụng một liều đơn.

Trong các thử nghiệm lâm sàng được thực hiện trên người lớn và trẻ vị thành niên có viêm mũi dị ứng (theo mùa hoặc quanh năm), bilastine 20 mg, sử dụng một lần một ngày trong vòng 14-28 ngày, đem lại hiệu quả trong việc làm giảm các triệu chứng như hắt hơi, chảy nước mũi, ngứa mũi, ngạt mũi, chảy nước mắt và đỏ mắt. Bilastine kiểm soát hiệu quả các triệu chứng trong vòng 24 giờ.

Trong hai thử nghiệm lâm sàng được thực hiện trên bệnh nhân mày đay nguyên phát mãn tính, bilastine 20 mg, uống một lần/ngày trong 28 ngày chứng minh được hiệu quả trong làm giảm mức độ ngứa và giảm số lượng, kích thước của các vết sần cũng như cảm giác khó chịu của bệnh nhân do mày đay. Bệnh nhân cải thiện được chất lượng giấc ngủ và do đó, cải thiện chất lượng cuộc sống.

Không có trường hợp nào kéo dài khoảng QT hiệu chỉnh hoặc tác dụng không mong muốn trên tim mạch được ghi nhận trong các thử nghiệm lâm sàng của bilastine, ngay cả với liều 200 mg mỗi ngày (gấp 10 lần liều điều trị) trong vòng 7 ngày trên 9 bệnh nhân, hoặc thậm chí ngay cả khi cùng phối hợp với các thuốc ức chế P-gp, như ketoconazole (24 bệnh nhân) và erythromycin (bệnh nhân). Thêm vào đó, một nghiên cứu theo dõi khoảng QT cũng đã được thực hiện trên 30 người tình nguyện.

Trong các thử nghiệm lâm sàng có kiểm soát, khi sử dụng liều khuyến cáo là 20 mg một lần/ngày, dữ liệu về tính an toàn trên hệ thần kinh trung ương của bilastine tương đương với giả dược và tỉ suất ghi nhận tình trạng buồn ngủ không khác biệt có ý nghĩa thống kê so với giả dược. Các thử nghiệm lâm sàng cho thấy bilastine với liều 40 mg một lần/ngày không ảnh hưởng đến hoạt tính tâm thần vận động cũng như khả năng lái xe được đánh giá thông qua một bài kiểm tra lái xe quy chuẩn.

Người cao tuổi (≥ 65 tuổi) được lựa chọn trong nghiên cứu pha II và pha III, kết quả cho thấy không có sự khác biệt trong hiệu quả cũng như độ an toàn khi so sánh với nhóm bệnh nhân trẻ tuổi hơn.

Đặc tính dược động học

Hấp thu

Bilastine được hấp thu nhanh sau khi uống và đạt nồng độ tối đa trong huyết tương sau khoảng 1,3 giờ. Thuốc không bị tích lũy. Giá trị sinh khả dụng đường uống trung bình của bilastine là 61%.

Phân bố

Nghiên cứu *in vitro* và *in vivo* cho thấy bilastine là một cơ chất của P-gp (xem mục Tương tác thuốc và các tương tác có liên quan, tương tác với ketoconazol, erythromycin và diltiazem) và cơ chất của OATP (xem mục Tương tác thuốc và các tương tác có liên quan, tương tác với nước bưởi chùm). Bilastine không phải là cơ chất của các chất vận chuyển BCRP hoặc chất vận chuyển tại thận OCT2, OAT1 và OAT3. Theo các nghiên cứu *in vitro*, bilastine không được dự đoán là ức chế các chất vận chuyển trong toàn hệ thống, bao gồm: P-gp, MRP2, BCRP, BSEP, OATP1B1, OATP1B3, OATP2B1, OAT1, OAT3, OCT1, OCT2, và NTCP, do chỉ có mức độ ức chế thấp được ghi nhận với P-gp, OATP2B1 và OCT1, với giá trị IC_{50} ước tính ≥ 300 µM, cao hơn rất nhiều so với nồng độ tối đa ước tính trong huyết tương C_{max}. Vì thế, các tương tác này không có nhiều ảnh hưởng trên lâm sàng. Tuy nhiên, cũng theo các nghiên cứu này, không thể loại trừ tác dụng ức chế của bilastine lên các chất vận chuyển trên niêm mạc ruột.

Ở liều điều trị, tỉ lệ gắn với protein huyết tương của thuốc là 84-90%.

Chuyển hóa

Kết quả các nghiên cứu *in vitro* cho thấy bilastine không cảm ứng hoặc ức chế hoạt tính của CYP450.

Thải trừ

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

Mức độ tuyến tính
Bilastine biểu hiện mô hình dược động học tuyến tính trong khoảng liều nghiên cứu (5 đến 220 mg), với mức độ dao động nhỏ giữa các cá thể.

Bệnh nhân suy thận:
Trong một nghiên cứu trên các bệnh nhân suy thận, giá trị trung bình (SD) của $AUC_{0-\infty}$ tăng từ 737,4 (±260,8) ng x giờ/ml trên bệnh nhân chức năng thận bình thường (độ lọc cầu thận: > 80 ml/phút/1,73 m^2) lên 967,4 (±140,2) ng x giờ/ml trên bệnh nhân suy thận nhẹ (Độ lọc cầu thận: 50-80 ml/phút/1,73 m^2), 1384,2 (±263,23) ng x giờ/ml trên bệnh nhân suy thận trung bình (Độ lọc cầu thận: 30 - <50 ml/phút/1,73 m^2), và 1708,5 (±699,0) ng x giờ/ml trên bệnh nhân suy thận nặng (Độ lọc cầu thận: < 30 ml/phút/1,73 m^2). Giá trị trung bình (SD) của thời gian bán thải của bilastine là 9,3 h (± 2,8) trên các bệnh nhân bình thường, 15,1 h (± 7,7) trên bệnh nhân suy thận nhẹ, 10,5 h (± 2,3) trên bệnh nhân suy thận trung bình và 18,4 h (± 11,4) trên bệnh nhân suy thận nặng. Quá trình bài xuất qua nước tiểu gần như được hoàn tất sau 48 -72giờ trên tất cả các đối tượng. Những thay đổi về dược động học này không cho thấy ảnh hưởng rõ rệt trên lâm sàng trên độ an toàn của bilastine, do nồng độ thuốc trong huyết tương trong trường hợp bệnh nhân suy thận vẫn nằm trong khoảng điều trị.

Bệnh nhân suy gan:
Không có dữ liệu về dược động học trên bệnh nhân suy gan. Ở người, bilastine không bị chuyển hóa. Do kết quả trong những nghiên cứu trên bệnh nhân suy thận cho thấy đường thải trừ qua thận là đường thải trừ chính, quá trình bài xuất qua mật chỉ đóng góp một phần rất nhỏ vào sự thải trừ của bilastine. Sự thay đổi chức năng gan có thể không làm thay đổi đáng kể dược động học của bilastine trên lâm sàng.

Người cao tuổi:
Có rất ít dữ liệu về việc sử dụng thuốc cho người trên 65 tuổi. Chưa có khác biệt có ý nghĩa thống kê nào được ghi nhận giữa đặc tính dược động học của bilastine trên người cao tuổi và trên người trẻ tuổi.

Dữ liệu an toàn tiền lâm sàng
Các nghiên cứu về độ an toàn dược lý, độc tính khi dùng liều lặp lại, độc tính trên gen, nguy cơ gây ung thư cho thấy không có nguy cơ đặc biệt khi sử dụng bilastine.

Trong các nghiên cứu về độc tính của bilastine trên sinh sản (nghiên cứu trên chuột trước và sau khi trứng làm tổ, nghiên cứu trên nguy cơ hình thành không hoàn chỉnh xương sọ, xương ức và xương chi của thỏ), các bất thường chỉ ghi nhận ở liều gây độc tính trên mẹ. Nồng độ thuốc tương ứng với NOAELs rất cao (> 30 lần) so với nồng độ tương ứng ở liều điều trị khuyến cáo trên người.

Trong một nghiên cứu về tác động của thuốc trên khả năng sinh sản của chuột, bilastine được sử dụng với liều lên tới 1000 mg/kg/ngày không gây ra tác động trên các cơ quan sinh sản đực và cái. Các chỉ số liên quan đến khả năng giao phối, sinh sản và mang thai đều không bị ảnh hưởng.

Một nghiên cứu đánh giá sự phân bố của thuốc trên chuột bằng cách đo nồng độ thuốc có gắn chất phóng xạ đã cho thấy bilastine không bị tích lũy trong hệ thần kinh trung ương.

ĐẶC TÍNH DƯỢC PHẨM

Các tá dược
Microcrystalline Cellulose, Sodium Starch Glycolate (Type A) (nguồn gốc từ khoai tây), Colloidal Anhydrous Silica, Magnesium Stearate.

Các chất tương kị
Chưa ghi nhận

Thời hạn sử dụng
5 năm

Bảo quản
Bảo quản ở nhiệt độ dưới 30°C.
Tránh tầm tay với và tầm mắt của trẻ nhỏ.

TUQ. CỤC TRƯỞNG
P.TRƯỞNG PHÒNG
Nguyễn Huy Hùng

Đọc kĩ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng. Để biết thêm thông tin, hãy tham khảo ý kiến bác sĩ của bạn. Thuốc này cần được kê đơn.

Bản chất và thành phần của bao bì
Thuốc được đóng gói trong vỉ gồm 2 phần:
Lớp vỏ bao, có chứa polyamide (mặt ngoài của vỏ), nhôm và PVC (mặt trong của vỏ)
Lá nhôm
Lá nhôm được bịt kín bằng nhiệt sử dụng lớp dính nhiệt (polymer kết hợp PVC-PVAC và nhựa butylmethacrylate) để gắn vào lớp vỏ bao sau khi đã đúc khuôn và đặt viên thuốc.

Hộp 1 vỉ x 4 viên, 1 vỉ x 10 viên, 2 vỉ x 10 viên, 3 vỉ x 10 viên, 4 vỉ x 10 viên, 5 vỉ x 10 viên. Các vỉ được đóng gói trong hộp bìa cứng. Không phải dạng nào kể trên cũng được bán trên thị trường.

Lưu ý khi sử dụng
Không có lưu ý gì đặc biệt. Tất cả các sản phẩm không sử dụng nữa hoặc vỏ thuốc bỏ đi cần được xử lý theo quy định tại từng địa phương.

NGÀY DUYỆT NỘI DUNG
Tháng 5 năm 2013

SẢN XUẤT BỞI
A. Menarini Manufacturing Logistics and Services S.r.l.
Via Campo di Pile, L'Aquila (AQ), I-67100, Italy

KIỂM NGHIỆM BỞI
A. Menarini Manufacturing Logistics and Services S.r.l.
Via Sette Santi, 3 50131 Firenze Italy