

RX THUỐC NÀY CHỈ DÙNG THEO ĐƠN THUỐC

Halofar

**ĐỂ XA TẮM TAY CỦA TRẺ EM
ĐỌC KỸ HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG TRƯỚC KHI DÙNG
NẾU CẦN THÊM THÔNG TIN, XIN HỎI Ý KIẾN BÁC SĨ
THÔNG BÁO NGAY CHO BÁC SĨ HOẶC DƯỢC SĨ
NHỮNG TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN
GẶP PHẢI KHI SỬ DỤNG THUỐC**

1. Thành phần công thức thuốc

- Thành phần hoạt chất:
- + Haloperidol2 mg
- Thành phần tá dược: Era-pac, lactose, povidon, magnesi stearat vừa đủ 1 viên nén.

2. Dạng bào chế

Viên nén tròn màu trắng, hai mặt phẳng, một mặt có chữ "HLD" ở trên và "2mg" ở dưới, mặt kia có rãnh hình chữ thập, không mùi.

3. Chỉ định

- Điều trị các biểu hiện rối loạn tâm thần.
- Kiểm soát tật máy giạt vận động và phát âm trong hội chứng Tourette ở trẻ em và người lớn.
- Điều trị các vấn đề hành vi nghiêm trọng ở trẻ em như gây gổ, tấn công, kích động (dù không có sự khiêu khích).
- Điều trị thời gian ngắn ở trẻ em hiếu động thái quá kèm theo các rối loạn hành vi bao gồm các triệu chứng sau đây: ám ảnh, khó tập trung, hung hăng, tâm trạng không ổn định và khó khoan dung.
- Haloperidol dùng cho trẻ em khi không đáp ứng với liệu pháp tâm lý hoặc các loại thuốc chống loạn thần khác.

4. Cách dùng và Liều dùng

- Liều cần điều trị có sự thay đổi đáng kể giữa các bệnh nhân. Như với tất cả các thuốc chống loạn thần khác, liều lượng nên theo nhu cầu và đáp ứng của mỗi bệnh nhân. Điều chỉnh liều phải được thực hiện càng nhanh càng tốt để đạt được sự kiểm soát điều trị tối ưu. Để xác định liều lượng ban đầu, cần cân nhắc đến tuổi tác, mức độ bệnh của bệnh nhân, đáp ứng trước kia đối với các thuốc chống loạn thần khác và bất kỳ thuốc kèm theo hoặc tình trạng bệnh.
- Trẻ em, bệnh nhân suy nhược hoặc lão khoa cũng như những người có tiền sử phản ứng phụ đối với thuốc chống loạn thần, có thể cần haloperidol liều ít hơn. Đáp ứng tối ưu ở những bệnh nhân này thường đạt được khi chỉnh liều dần dần và với liều lượng thấp, như được đề nghị dưới đây.

Liều bắt đầu điều trị:

- **Người lớn:**
- + Triệu chứng trung bình: 0,5 mg – 2 mg, 2 – 3 lần/ngày.
- + Triệu chứng nặng: 3 mg – 5 mg, 2 – 3 lần/ngày.
- Để đạt được kiểm soát nhanh, liều cao hơn có thể cần trong một số trường hợp.
- + Bệnh nhân cao tuổi hoặc suy nhược cơ thể: 0,5 mg – 2 mg, 2 – 3 lần/ngày.
- + Bệnh nhân mạn tính hoặc kháng thuốc: 3 mg - 5 mg, 2 – 3 lần/ngày.
- Bệnh nhân vẫn còn khó chịu hoặc kiểm soát không tốt, có thể cần điều chỉnh liều. Trong một số trường hợp, liều hàng ngày lên tới 100 mg có thể cần thiết để đạt được đáp ứng tối ưu. Đôi khi haloperidol có thể được dùng trên 100 mg cho bệnh nhân kháng thuốc nặng. Tuy nhiên, dữ liệu lâm sàng đã không chứng minh được sự an toàn của việc sử dụng kéo dài liều này.
- **Trẻ em:**
- + Haloperidol không dùng cho trẻ em dưới 3 tuổi.
- + Trẻ em từ 3 – 12 tuổi (trọng lượng từ 15 kg đến 40 kg): nên điều trị bắt đầu với liều thấp nhất có thể (0,5 mg/ngày). Nếu cần, liều sẽ tăng lên thêm 0,5 mg, trong khoảng mỗi 5 – 7 ngày cho đến khi đạt được kết quả điều trị mong muốn. Tổng liều có thể chia thành 2 – 3 lần/ngày.
- Rối loạn tâm thần: 0,05 – 0,15 mg/kg/ngày.
- Rối loạn hành vi không tâm thần và hội chứng Tourette: 0,05 – 0,075 mg/kg/ngày.
- Trong những trẻ em bị rối loạn nặng không tâm thần hoặc trẻ em hiếu động thái quá kèm rối loạn hành vi không đáp ứng liệu pháp tâm lý hoặc thuốc chống loạn thần khác, dùng thời gian ngắn haloperidol có thể đủ đáp ứng. Không có bằng chứng cho thấy liều lượng tối đa là sẽ hiệu quả. Có rất ít bằng chứng cho thấy cải thiện hành vi đạt được ở liều lượng vượt quá 6 mg/ngày.

Liều duy trì:

- Khi đạt được đáp ứng điều trị, liều lượng nên được dần dần giảm đến mức duy trì được hiệu quả.

5. Chống chỉ định

- Dị ứng với bất kỳ thành phần nào của thuốc.
- Trạng thái hôn mê
- Người bệnh Parkinson.
- Chứng mất trí.
- Chứng liệt trên nhân tiến triển.
- Khoảng QT kéo dài hoặc hội chứng QT bẩm sinh kéo dài.
- Nhồi máu cơ tim cấp gần đây.
- Suy tim mất bù.
- Tiền sử loạn nhịp thất hoặc thất nhanh.
- Hạ kali máu chưa điều chỉnh.
- Điều trị đồng thời với các sản phẩm thuốc kéo dài khoảng QT.

6. Cảnh báo và thận trọng khi dùng thuốc

Tăng tỷ lệ tử vong ở người cao tuổi với chứng mất trí:

- Hiếm trường hợp đột tử đã được báo cáo ở những bệnh nhân tâm thần đang dùng thuốc chống loạn thần, bao gồm haloperidol.
- Người cao tuổi mắc bệnh tâm thần kèm chứng sa sút trí tuệ điều trị bằng thuốc chống loạn thần có nguy cơ cao tử vong.
- Tác dụng của tim mạch**
- Khoảng QT kéo dài và/ hoặc loạn nhịp tâm thất, đã được báo cáo với haloperidol. Nguy cơ biến chứng này dường như tăng với liều cao, dùng đường tiêm, đặc biệt là tiêm tĩnh mạch.

- Thận trọng đối với bệnh nhân nhịp tim chậm, tiền sử gia đình có khoảng QT kéo dài hoặc có tiền sử nghiện rượu nặng.
- Trong quá trình điều trị, cần phải theo dõi khoảng QT của ECG và loạn nhịp thất với tất cả bệnh nhân. Trong khi điều trị, nên giảm liều nếu khoảng QT kéo dài, nhưng phải ngưng haloperidol nếu QT vượt quá 500 ms.
- Rối loạn điện giải như hạ kali huyết và hạ magnesi huyết làm tăng nguy cơ loạn nhịp thất và phải được chữa trị trước khi điều trị với haloperidol.
- Nhịp tim nhanh và hạ huyết áp (kể cả hạ huyết áp thể đứng) đã được báo cáo. Cần thận trọng khi dùng haloperidol cho bệnh nhân đã có biểu hiện hạ huyết áp hoặc hạ huyết áp thể đứng.

Mạch máu não: Thận trọng ở bệnh nhân có các yếu tố nguy cơ bị đột quỵ.

Hội chứng an thần kinh ác tính

Phản ứng hiếm gặp có đặc điểm tăng thân nhiệt, co cơ, ý thức thay đổi và tăng độ thanh thải phosphokinase máu. Tăng thân nhiệt thường là một dấu hiệu sớm của hội chứng này. Điều trị thuốc chống loạn thần phải được ngừng ngay lập tức, điều trị hỗ trợ thích hợp giám sát cẩn thận.

Hội chứng an thần kinh ác tính

Phản ứng hiếm gặp có đặc điểm tăng thân nhiệt, co cơ, ý thức thay đổi và tăng độ thanh thải phosphokinase máu. Tăng thân nhiệt thường là một dấu hiệu sớm của hội chứng này. Điều trị thuốc chống loạn thần phải được ngừng ngay lập tức, điều trị hỗ trợ thích hợp giám sát cẩn thận.

Rối loạn vận động chậm

Loạn vận động chậm có thể xuất hiện ở vài bệnh nhân khi điều trị lâu dài hoặc sau khi ngưng dùng thuốc. Hội chứng chủ yếu được đặc trưng bởi các cử động vô ý của lưỡi, mặt, miệng hoặc hàm. Hội chứng có thể bị che khuất khi tăng liều hoặc khi chuyển sang dùng thuốc chống loạn thần khác. Nếu xuất hiện các dấu hiệu và triệu chứng loạn vận động muộn nên xem xét ngừng hẳn tất cả các thuốc chống rối loạn tâm thần, kể cả haloperidol.

Triệu chứng ngoại tháp

- Triệu chứng ngoại tháp có thể xảy ra (run, co cứng, tăng tiết nước bọt, vận động chậm, ngừng vận động, loạn trương lực cấp). Việc sử dụng haloperidol có liên quan đến sự tiến triển của rối loạn vận động, đặc trưng bởi sự bền chôn khó chịu và thấy cần phải di chuyển, không có khả năng ngồi hoặc đứng yên. Rối loạn có thể xảy ra trong vài tuần đầu điều trị. Ở những bệnh nhân có những triệu chứng này, tăng liều có thể làm trầm trọng thêm.
- Rối loạn trương lực cấp có thể xảy ra trong vài ngày đầu điều trị, hoặc xảy ra khi tăng liều. Triệu chứng loạn trương lực bao gồm: vẹo cổ, nhăn mặt, cứng hàm, lè lưỡi, chuyển động mắt bất thường, như đảo mắt. Nam giới và người trẻ có nguy cơ cao bị phản ứng này. Khi bị loạn trương lực cấp có thể phải ngừng thuốc.
- Thuốc chống parkinson, kiểu kháng cholinergic có thể được kê toa để điều trị các triệu chứng ngoại tháp, nhưng khuyến cáo không nên kê toa như là một biện pháp phòng ngừa.

Động kinh/ co giật: Đã có báo cáo các cơn co giật có thể gây ra bởi haloperidol. Cần lưu ý ở những bệnh nhân bị động kinh hoặc trong các tình trạng có thể bị động kinh (ví dụ cai rượu và tổn thương não).

Liên quan đến gan mật: Haloperidol được chuyển hóa ở gan, nên điều chỉnh liều và thận trọng ở bệnh nhân suy gan. Chức năng gan bất thường hoặc viêm gan, thường là ứ mật đã được báo cáo.

Liên quan đến hệ nội tiết

- Thyroxin làm tăng độc tính của haloperidol. Thận trọng khi điều trị thuốc chống loạn thần ở bệnh nhân cường giáp.
- Tác dụng nội tiết của thuốc chống loạn thần bao gồm tăng prolactin huyết, có thể gây chứng vú to ở đàn ông và ngừng kinh tăng tiết sữa ở phụ nữ.
- Hạ đường huyết và hội chứng tiết hormon chống lợi niệu đã được báo cáo khi dùng haloperidol.

Huyết khối tĩnh mạch: Các trường hợp bị huyết khối tĩnh mạch (VTE) đã được báo cáo với thuốc chống loạn thần.

Đáp ứng điều trị và cai thuốc:

- Trong bệnh tâm thần phân liệt, đáp ứng với điều trị chống loạn thần có thể bị chậm.
- Nếu ngừng thuốc chống loạn thần, sự tái phát các triệu chứng liên quan có thể xảy ra trong vài tuần hoặc vài tháng.
- Có rất ít báo cáo về các triệu chứng cai thuốc (bao gồm buồn nôn, nôn và mất ngủ) sau khi ngừng đột ngột liều cao thuốc chống loạn thần. Việc giảm liều dần dần trước khi ngừng thuốc hẳn được khuyến khích như một biện pháp phòng ngừa.

Bệnh nhân trầm cảm: Không nên dùng haloperidol đơn thuần ở những bệnh nhân trầm cảm. Có thể kết hợp với thuốc chống trầm cảm để điều trị trầm cảm và loạn thần cùng tồn tại.

Chuyển từ hưng cảm sang trầm cảm: Có một nguy cơ trong việc điều trị chứng hưng cảm của rối loạn lưỡng cực cho bệnh nhân chuyển từ trạng thái hưng cảm sang trầm cảm. Giám sát bệnh nhân chuyển sang giai đoạn trầm cảm với các nguy cơ kèm theo như hành vi tự tử là rất quan trọng để ngăn ngừa.

Chuyển hóa kém CYP2D6: Haloperidol nên dùng thận trọng ở những bệnh nhân chuyển hóa kém cytochrom P450 (CYP) 2D6 và những người đang dùng thuốc ức chế CYP3A4.

- Những bệnh nhân có vấn đề di truyền hiếm gặp của không dung nạp galactose, thiếu lactase hoặc kém hấp thu glucose-galactose không nên dùng thuốc này.

7. Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai và cho con bú

- Phụ nữ mang thai: Dữ liệu hạn chế cho thấy haloperidol không có độc tính dị dạng hay ngộ độc trên bào thai/ trẻ sơ sinh. Tuy nhiên, đã có những báo cáo về trường hợp dị dạng bẩm sinh sau khi tiếp xúc với haloperidol ở thai nhi, chủ yếu khi kết hợp với các thuốc khác. Nên tránh sử dụng haloperidol trong thai kỳ.
- Phụ nữ cho con bú: Haloperidol được bài tiết vào sữa mẹ. Một lượng nhỏ haloperidol đã được phát hiện trong máu và nước tiểu của trẻ sơ sinh bú mẹ được điều trị bằng haloperidol. Không có thông tin đầy đủ về ảnh hưởng của haloperidol ở trẻ bú sữa mẹ. Quyết định ngừng cho con bú hoặc ngưng điều trị với

RX THUỐC NÀY CHỈ DÙNG THEO ĐƠN THUỐC

Halofar

haloperidol nên cân nhắc đến lợi ích của việc cho con bú và lợi ích của việc điều trị bằng thuốc ở người mẹ.

8. Ảnh hưởng của thuốc lên khả năng lái xe và vận hành máy móc

Haloperidol ảnh hưởng vừa phải đối với khả năng lái xe và sử dụng máy móc. Có thể xảy ra an thần hoặc giảm khả năng tỉnh táo (đặc biệt dùng liều cao) khi bắt đầu điều trị và có thể tăng khi uống rượu. Bệnh nhân được khuyến không lái xe hoặc vận hành máy móc trong quá trình điều trị.

9. Tương tác của thuốc:

Tác dụng của tim mạch: Halofar chống chỉ định khi kết hợp với thuốc kéo dài khoảng QT. Ví dụ bao gồm:

- Thuốc chống loạn nhịp nhóm IA (disopyramid, quinidin).
- Thuốc chống loạn nhịp nhóm III (amiodaron, dofetilid, dronedaron, ibutilid, sotalolol).
- Một vài thuốc chống trầm cảm (citalopram, escitalopram).
- Một vài thuốc kháng sinh (azithromycin, clarithromycin, erythromycin, levofloxacin, moxifloxacin, telithromycin).
- Thuốc chống loạn thần khác (dẫn chất phenothiazin, sertindol, pimozid, ziprasidon)
- Một vài thuốc chống nấm (pentamidin).
- Một vài thuốc chống sốt rét (halofantrin).
- Một vài thuốc dạ dày ruột (dolasetron).
- Một vài thuốc được dùng trong ung thư (toremifen, vandetanib).
- Một vài thuốc khác (bepiridil, methadone).
- Cần thận trọng khi dùng Haloperidol kết hợp với các sản phẩm thuốc gây ra mất cân bằng điện giải.

Các thuốc có thể làm tăng nồng độ haloperidol trong máu: Haloperidol được chuyển hóa qua nhiều đường. Các con đường chính là glucuronid hóa và giảm ceton. Hệ enzym cytochrom P450 - CYP3A4 cũng liên quan, CYP2D6 ở mức độ thấp hơn. Sự ức chế chuyển hóa qua những đường này do thuốc khác hoặc giảm hoạt tính enzym CYP2D6 có thể làm tăng nồng độ haloperidol trong máu. Các thuốc có thể làm tăng nồng độ haloperidol trong máu (dựa trên kinh nghiệm lâm sàng hoặc cơ chế tương tác thuốc) bao gồm:

- Thuốc ức chế CYP3A4: alprazolam, fluvoxamin, indinavir, itraconazol, ketoconazol, nefazodon, posaconazol, saquinavir, verapamil, voriconazol.
- Thuốc ức chế CYP2D6: bupropion, clorpromazin, duloxetine, paroxetin, promethazin, sertraline, venlafaxin.
- Thuốc ức chế CYP3A4 kết hợp CYP2D6: fluoxetin, ritonavir.
- Cơ chế không chắc chắn: buspiron.
- Tăng nồng độ haloperidol trong máu có thể làm tăng nguy cơ tác dụng phụ, bao gồm kéo dài khoảng QT. Tăng khoảng QT đã thấy khi haloperidol dùng phối hợp các chất ức chế chuyển hóa ketoconazol (400 mg/ ngày) và paroxetin (20 mg/ ngày). Cần theo dõi dấu hiệu, triệu chứng tăng hoặc kéo dài các tác dụng phụ trên bệnh nhân dùng haloperidol cùng với các sản phẩm thuốc đó và liều haloperidol sẽ giảm xuống khi cần thiết.

Các thuốc có thể làm giảm nồng độ haloperidol trong máu:

- Thuốc gây cảm ứng enzym mạnh CYP3A4: carbamazepin, phenobarbital, phenytoin, rifampicin.
- Sự cảm ứng enzym có thể được quan sát thấy sau một vài ngày điều trị. Sự cảm ứng enzym tối đa thường thấy trong khoảng 2 tuần và sau đó có thể kéo dài trong cùng thời gian sau khi ngừng điều trị. Trong điều trị kết hợp với thuốc gây cảm ứng CYP3A4, nên theo dõi bệnh nhân và tăng liều haloperidol nếu cần. Sau khi ngừng thuốc nồng độ haloperidol trong máu có thể tăng và giảm liều haloperidol nếu cần.
- Valproat natri ức chế glucuronid hóa nhưng không ảnh hưởng đến nồng độ haloperidol trong máu.

Ảnh hưởng của haloperidol đối với các thuốc khác:

- Haloperidol có thể làm tăng ức chế thần kinh trung ương do rượu hoặc các thuốc ức chế thần kinh trung ương, gồm thuốc ngủ, thuốc an thần hoặc thuốc giảm đau mạnh. Tác dụng ức chế thần kinh trung ương tăng khi kết hợp với methylidopa.
- Haloperidol có thể đối kháng hoạt động của adrenalin và các sản phẩm thuốc cường giao cảm khác (ví dụ: chất kích thích như amphetamines) và đảo nghịch tác dụng hạ áp huyết áp của các sản phẩm thuốc phong bế adrenergic như guanethidin.
- Haloperidol có thể đối kháng tác dụng levodopa và các chất chủ vận dopamin khác.
- Haloperidol là chất ức chế CYP2D6. Haloperidol ức chế chuyển hóa thuốc chống trầm cảm ba vòng (như imipramin, desipramin), do đó làm tăng nồng độ trong máu của các thuốc này.

Các tương tác khác

- Dùng cùng lithi và haloperidol hiếm xảy ra bệnh não, triệu chứng ngoại tháp, loạn vận động muộn, hội chứng ác tính thần kinh, hội chứng não cấp và hôn mê. Hầu hết các triệu chứng này có thể hồi phục. Nên ngưng điều trị nếu có triệu chứng như vậy.
- Đối kháng tác dụng của thuốc chống đông phenindion đã được báo cáo.

10. Tương kỵ của thuốc: Do không có các nghiên cứu về tính tương kỵ của thuốc, không trộn lẫn thuốc này với các thuốc khác.

11. Tác dụng không mong muốn của thuốc

- Hội chứng ngoại tháp xảy ra ở 40 – 70% số người bệnh được điều trị. Haloperidol có thể làm tăng nồng độ prolactin trong huyết tương tùy thuộc vào liều dùng.
- Thường gặp ADR $\leq 1/100$
Đau đầu, chóng mặt, trầm cảm và an thần. Triệu chứng ngoại tháp với rối loạn trương lực cấp, hội chứng Parkinson, đứng ngồi không yên. Loạn động muộn xảy ra khi điều trị thời gian dài.
- Ít gặp $1/1000 < ADR \leq 1/100$
Tăng tiết nước bọt và mồ hôi, ăn mất ngon, mất ngủ và thay đổi thể trọng. Tim đập nhanh và hạ huyết áp, tiết nhiều sữa, to vú nam giới, ít kinh hoặc mất kinh, nôn, táo bón, khó tiêu, khó miệng. Triệu chứng ngoại tháp với kiểu kích thích vận động, suy nhược, yếu cơ. Cơ động kinh lớn, kích thích tâm thần, lú lẫn, bí đái và nhìn mờ.

- Hiếm gặp, ADR $< 1/1.000$
- + Phản ứng quá mẫn, ví dụ phản ứng da, mày đay, choáng phản vệ. Hội chứng an thần kinh ác tính, Giảm bạch cầu, mất bạch cầu hạt và giảm tiểu cầu. Loạn nhịp thất, hạ glucose huyết, viêm gan và tắc mật trong gan.
- + Nói chung, những phản ứng ngoại tháp được kiểm soát bằng cách giảm liều hoặc điều trị bằng thuốc chống Parkinson. Tăng nhãn áp có thể xảy ra khi haloperidol được điều trị đồng thời với thuốc kháng cholin, bao gồm thuốc chống Parkinson.

12. Quá liều và cách xử trí

Quá liều:

- Triệu chứng nổi bật nhất là phản ứng ngoại tháp nặng, hạ huyết áp và an thần. Phản ứng ngoại tháp biểu hiện bằng cứng cơ và run. Cũng có thể cao huyết áp hơn là hạ huyết áp.
- Trong những trường hợp nặng, bệnh nhân sẽ xuất hiện hôn mê với ức chế hô hấp và hạ huyết áp đủ để tạo trạng thái sốc. Cần phải theo dõi nguy cơ loạn nhịp thất kèm kéo dài khoảng QT.
- Cách xử trí:**
- Không có thuốc giải đặc hiệu. Điều trị hỗ trợ. Tác dụng của than hoạt vẫn chưa được xác định. Thẩm phân máu không được khuyến cáo trong điều trị quá liều vì nó chỉ loại bỏ một lượng nhỏ haloperidol.
- Đường dẫn khí phải được sử dụng ống dẫn khí quản hoặc ống nội khí quản ở bệnh nhân hôn mê. Cần hô hấp nhân tạo ở bệnh nhân ức chế hô hấp.
- Theo dõi ECG và các dấu hiệu quan trọng và theo dõi tiếp tục cho đến khi ECG bình thường. Khuyến cáo nên điều trị loạn nhịp nặng với các biện pháp chống loạn nhịp thích hợp.
- Hạ huyết áp và đột quy tuần hoàn có thể được giải quyết bằng tiêm tĩnh mạch, huyết tương hoặc albumin đậm đặc và thuốc giãn mạch, như dopamin hoặc noradrenalin. Adrenalin không được sử dụng vì nó có thể gây hạ huyết áp thêm khi có haloperidol.
- Trong trường hợp phản ứng ngoại tháp nghiêm trọng nên tiêm thuốc chống parkinson.

13. Đặc tính dược lực học

- Nhóm dược lý: Thuốc an thần thuộc nhóm butyrophenon.
- Mã ATC: N05AD01.

Cơ chế hoạt động:

Haloperidol là thuốc chống loạn thần thuộc nhóm butyrophenon. Haloperidol là chất đối kháng thụ thể dopamin 2 (D2), ở liều khuyến cáo có hoạt tính kháng adrenergic alpha-1 thấp và không có hoạt tính kháng histamin hoặc kháng cholinergic.

Tác dụng dược lực học

- Haloperidol ức chế hoang tưởng và ảo giác nhờ việc phong bế tín hiệu dopaminergic trong con đường mesolimbic. Tác dụng phong bế dopamin trung ương có hoạt động trên các hạch nền. Haloperidol gây an thần hiệu quả, giải thích tác dụng thích hợp cho chứng hưng cảm và các hội chứng kích động khác.
- Hoạt động trên các hạch nền là nền tảng của tác dụng vận động ngoại tháp không mong muốn (loạn trương lực, akathisia và hội chứng parkinson).
- Tác dụng ức chế dopamin của haloperidol trên tế bào lactotropes trong thùy trước tuyến yên giải thích việc tăng prolactin huyết do ức chế dopamin nội sinh.

14. Đặc tính dược động học

Hấp thu: Sau khi uống, haloperidol được hấp thu từ 60 đến 70% ở đường tiêu hóa. Thuốc qua tuần hoàn ruột – gan, nồng độ đỉnh của haloperidol trong huyết thanh đạt được sau khoảng 2 – 6 giờ. Nồng độ haloperidol vẫn có thể phát hiện trong huyết tương người bệnh trong vài tuần sau khi uống 1 liều thuốc.

Phân bố: Haloperidol được phân phối nhanh chóng đến các mô khác nhau và các cơ quan. Nồng độ haloperidol huyết tương trung bình ở người lớn khoảng từ 88 đến 92%. Haloperidol qua được hàng rào máu – não; nó cũng đi qua nhau thai và được bài tiết vào sữa mẹ.

Chuyển hóa: Haloperidol được chuyển hóa chủ yếu ở gan. Các đường chuyển hóa chính của haloperidol bao gồm glucuronid hóa, giảm ceton, oxy hóa N-dealkylation và sự hình thành các chất chuyển hóa pyridinium. Các enzyme cytochrome P450 - CYP3A4 và CYP2D6 liên quan đến quá trình chuyển hóa haloperidol, ức chế hoặc kích thích CYP3A4, hoặc ức chế CYP2D6, có thể ảnh hưởng đến chuyển hóa haloperidol. Sự giảm hoạt tính của CYP2D6 có thể làm tăng nồng độ haloperidol.

Thải trừ: thời gian bán thải của haloperidol trung bình khoảng 24 giờ (khoảng từ 15 đến 37 giờ) sau khi uống. Độ thanh thải của haloperidol sau khi tiêm dao động từ 0,9 đến 1,5 l/h/kg và giảm ở những người chuyển hóa CYP2D6 kém. Hoạt động của enzyme CYP2D6 giảm có thể làm tăng nồng độ haloperidol. Ở những bệnh nhân tâm thần phân liệt độ thanh thải haloperidol ước tính là 44%. Sau khi tiêm tĩnh mạch haloperidol, 21% liều đã được thải trừ trong phân và 33% trong nước tiểu. Chưa tới 3% ở dạng không chuyển hóa được thải trừ trong nước tiểu.

15. Quy cách đóng gói: Hộp 10 vỉ x 20 viên nén.

16. Điều kiện bảo quản: Ở nhiệt độ không quá 30°C, tránh ánh sáng.

17. Hạn dùng: 36 tháng kể từ ngày sản xuất.

18. Tiêu chuẩn chất lượng của thuốc: TCCS

19. Tên, địa chỉ của cơ sở sản xuất thuốc



CÔNG TY CỔ PHẦN DƯỢC PHẨM

DƯỢC LIỆU PHARMEDIC

367 Nguyễn Trãi, Q. 1, TP. HCM, VN.

Sản xuất tại nhà máy GMP – WHO

1/67 Nguyễn Văn Quá,

Quận 12, TP. Hồ Chí Minh, Việt Nam.