

LUKACINCO

(Montelukast 4 mg)

Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng

Để xa tầm tay trẻ em

Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc



ITP PHARMA

THÀNH PHẦN

Mỗi 1 gói có chứa:

Hoạt chất: Montelukast (dưới dạng Montelukast natri) 4 mg

Tá dược: Microcrystalline cellulose, aspartam, manitol, colloidal anhydrous silica.

DẠNG BẢO CHẾ

Bột pha hỗn dịch uống

Bột thuốc màu trắng đến hơi vàng, tơi xốp, đồng nhất, có vị ngọt.

QUY CÁCH ĐÓNG GÓI:

Hộp 7, 14, 20, 28, 30 gói

ĐẶC TÍNH DƯỢC LỰC HỌC

Nhóm dược lý: Thuốc đối kháng thụ thể Leukotrien.

Mã ATC: R03D C03

Cơ chế tác dụng:

Các cysteinyl leukotrien (LTC 4, LTD 4, LTE 4) là các yếu tố gây viêm mạnh được giải phóng từ các tế bào mast và bạch cầu ái toan. Các chất trung gian gây viêm liên kết với các thụ thể leukotrien cysteinyl (CysLT) được tìm thấy trong đường hô hấp của con người và gây ra phản ứng viêm ở đường hô hấp, bao gồm co thắt phế quản, tiết nhầy, tinh thâm thành mạch và tăng hóa ứng động của bạch cầu ái toan.

Montelukast dùng đường uống liên kết có tính chọn lọc cao đối với thụ thể CysLT 1. Trong các nghiên cứu lâm sàng, montelukast ức chế co thắt phế quản khi dùng ở liều thấp. Tác dụng giãn phế quản được quan sát thấy trong vòng 2 giờ sau khi uống. Tác dụng làm giãn phế quản tác động bởi một chất chủ vận β có liên quan đến montelukast. Điều trị bằng montelukast ức chế sự co thắt phế quản ở giai đoạn sớm và giai đoạn cuối do ức chế kháng nguyên. Montelukast so với giả dược làm giảm bạch cầu ái toan máu ngoại vi ở bệnh nhân người lớn và trẻ em. Trong một nghiên cứu riêng biệt, điều trị bằng montelukast làm giảm đáng kể bạch cầu ái toan trong đường thở, kiểm soát được các triệu chứng hen trên lâm sàng.

ĐẶC TÍNH DƯỢC ĐỘNG HỌC:

Hấp thu

Montelukast được hấp thu nhanh sau khi uống. Nồng độ C_{max} trong huyết tương đạt được sau 2 giờ ở trẻ khi uống lúc đói. C_{max} tối đa trung bình là 66%.

Ở trẻ từ 2 tháng đến 6 tuổi nồng độ C_{max} đạt được sau khi uống 2 giờ cao hơn gấp 2 lần ở người lớn sử dụng viên 10 mg. Uống thuốc cùng với nước sốt táo hoặc uống cùng bữa ăn không khác biệt có ý nghĩa lâm sàng khi sử dụng thuốc lúc đói.

Phân bố

Montelukast liên kết 99% với protein huyết tương. Thể tích phân bố của Montelukast trung bình khoảng 8-11 lít. Nghiên cứu ở chuột với montelukast có gắn phóng xạ cho thấy có lượng rất ít qua được hàng rào máu não. Ngoài ra nồng độ thuốc đạt tối thiểu sau 24 giờ sử dụng thuốc.

Chuyển hóa

Montelukast được chuyển hóa nhanh, với nghiên cứu ở liều điều trị, nồng độ các chất chuyển hóa không được phát hiện ở trong huyết tương ở cả người lớn và trẻ em.

CYP2C8 là enzyme chính trong quá trình chuyển hóa của montelukast. Ngoài ra, CYP3A4 và CYP2C9 có thể góp 1 phần vào quá trình chuyển hóa. Tuy nhiên, itraconazol một chất ức chế CYP3A4 cho thấy không có sự biến đổi các thông số dược động học của montelukast ở những người khỏe mạnh dùng liều 10 mg montelukast mỗi ngày. Dựa trên các kết quả nghiên cứu *in vitro* trong microsome gan của người, nồng độ montelukast trong huyết tương không bị ức chế bởi các cytochrom P450 3A4, 2C9, 1A2, 2A6, 2C19 hoặc 2D6. Do đó hiệu quả điều trị của các chất chuyển hóa của montelukast là không đáng kể.

Thải trừ:

Độ thanh thải của montelukast trong huyết tương là 45 ml/phút ở người lớn khỏe mạnh. Sau khi uống montelukast có gắn phóng xạ, 86% thuốc được thu hồi sau 5 ngày, 2% được thải trừ qua nước tiểu.

Hầu hết montelukast và các chất chuyển hóa của nó được thải trừ qua mật.

Không cần hiệu chỉnh liều trên các bệnh nhân suy thận, bệnh nhân suy gan từ nhẹ đến trung bình. Không có đầy đủ dữ liệu nghiên cứu dược động học ở bệnh nhân suy gan nặng có điểm số Child-Pugh > 9.

Với liều cao montelukast sử dụng gấp 20-60 lần liều khuyến cáo, có thấy sự giảm nồng độ theophyllin trong huyết tương, không thấy ảnh hưởng này ở liều khuyến cáo 10 mg x 1 lần/ngày.

CHỈ ĐỊNH

Montelukast được chỉ định cho người bệnh lớn tuổi và trẻ em trên 6 tháng tuổi để dự phòng và điều trị hen phế quản mạn tính, bao gồm dự phòng cả các triệu chứng hen ban ngày và ban đêm, điều trị người hen nhạy cảm với aspirin và dự phòng cơn co thắt phế quản do gắng sức.

Montelukast được chỉ định để làm giảm các triệu chứng ban ngày và ban đêm của viêm mũi dị ứng (viêm mũi dị ứng theo mùa cho người lớn và trẻ em từ 2 năm tuổi trở lên, viêm mũi dị ứng quanh năm cho người lớn và trẻ em từ 6 tháng tuổi trở lên).

Để chữa hen, cần uống thuốc vào buổi tối.

Với viêm mũi dị ứng, thời gian dùng thuốc tùy thuộc vào nhu cầu của từng đối tượng.

CÁCH DÙNG VÀ LIỀU DÙNG

Để chữa hen, cần uống thuốc vào buổi tối.

Với viêm mũi dị ứng, thời gian dùng thuốc tùy thuộc vào nhu cầu của từng đối tượng.

Liều lượng

- Trẻ từ 6 tháng đến 5 tuổi bị hen và/hoặc viêm mũi dị ứng: 4 mg/ngày.
- Trẻ từ 6 tuổi đến 14 tuổi bị hen và/hoặc viêm mũi dị ứng: 4 - 8 mg/ngày (tùy theo tình hình thực tế của trẻ)
- Người lớn và trẻ em trên 15 tuổi bị hen và/hoặc viêm mũi dị ứng: 8mg/ngày (tùy theo tình hình của bệnh nhân có thể hiệu chỉnh liều).
- Trẻ cần được đánh giá hiệu quả điều trị sau 2-4 tuần điều trị thuốc, ngưng sử dụng nếu không đáp ứng điều trị.
- Không khuyến cáo sử dụng cho trẻ dưới 6 tháng tuổi.

Sản phẩm sử dụng cho trẻ dưới sự giám sát của người lớn.

Cách dùng

Cốm được sử dụng trực tiếp. Chế phẩm phải còn gói nguyên vẹn cho đến khi sử dụng.

Sau khi mở gói thuốc nên sử dụng trong vòng 15 phút. Nếu đã trộn với thức ăn thì không giữ cho sử dụng lần sau.

CHỐNG CHỈ ĐỊNH

Quá mẫn với bất kỳ thành phần nào của thuốc.

CẢNH BÁO VÀ THẬN TRỌNG KHI DÙNG THUỐC

Chẩn đoán bệnh hen mãn tính ở trẻ nhỏ từ 6 tháng- 2 tuổi cần được thực hiện bởi bác sĩ chuyên khoa nhi hoặc chuyên khoa phổi.

Bệnh nhân không nên dùng thuốc đường uống trong điều trị các cơn hen cấp. Nếu có biểu hiện của cơn hen phế quản cấp tính nên sử dụng dạng hít thuốc chủ vận β tác dụng ngắn. Cần tham khảo ý kiến bác sĩ nếu bệnh nhân liên tục phải sử dụng thuốc chủ vận β tác dụng ngắn dạng hít.

Montelukast không nên thay thế đột ngột cho corticoid dạng hít hoặc uống.

Không có đủ dữ liệu chứng minh có thể giảm liều corticoid khi sử dụng đồng thời cả montelukast.

Trường hợp có tăng bạch cầu ái toan đường toàn thân, đôi khi có các biểu hiện lâm sàng của viêm mạch máu tương tự như hội chứng Churg-Strauss thường được điều trị bằng corticoid đường toàn thân. Những trường hợp này có liên quan đến giảm liều corticoid đường toàn thân.

Thận trọng khi sử dụng đồng thời cùng với aspirin và các thuốc chống viêm NSAID khác.

SỬ DỤNG THUỐC CHO PHỤ NỮ CÓ THAI VÀ CHO CON BÚ

Thời kỳ mang thai

Các dữ liệu nghiên cứu trên động vật cho thấy không có dị tật gây ra cho bào thai. Tuy nhiên các dữ liệu nghiên cứu trên người còn hạn chế. Chỉ nên sử dụng cho phụ nữ có thai khi đánh giá được lợi ích của thuốc cao hơn rất nhiều so với nguy cơ.

Nghiên cứu trên chuột cho thấy thuốc bài tiết được qua sữa. Chưa có đầy đủ dữ liệu nghiên cứu trên phụ nữ cho con bú. Cần cân nhắc đánh giá lợi ích khi sử dụng cho phụ nữ cho con bú, chỉ sử dụng khi thật cần thiết.

ẢNH HƯỞNG CỦA THUỐC LÊN KHẢ NĂNG LÁI XE VÀ VẬN HÀNH MÁY MÓC

Thuốc không ảnh hưởng đến khả năng lái xe và vận hành máy móc, tuy nhiên cũng đã có những báo cáo về biểu hiện chóng mặt hay buồn ngủ khi sử dụng thuốc.

TƯƠNG TÁC, TƯƠNG Kỵ CỦA THUỐC

Montelukast được sử dụng trong dự phòng và điều trị bệnh hen.

Nồng độ trong huyết tương (AUC) của montelukast giảm khoảng 40% ở những bệnh nhân dùng cùng với phenobarbital. Vì montelukast được chuyển hóa bởi CYP 3A4, 2C8, và 2C9, cần thận trọng, đặc biệt ở trẻ em, khi montelukast dùng cùng với các thuốc cảm ứng CYP 3A4, 2C8, và 2C9, như phenytoin, phenobarbital và rifampicin.

Các nghiên cứu *in vitro* cho thấy montelukast là một chất ức chế mạnh của CYP 2C8. Tuy nhiên, dữ liệu từ một nghiên cứu tương tác thuốc lâm sàng giữa montelukast và rosiglitazon (chất chuyển hóa chính qua CYP 2C8) cho thấy montelukast không ức chế CYP 2C8 *in vivo*. Vì vậy, montelukast sẽ không làm thay đổi có ý nghĩa sự chuyển hóa của các sản phẩm được chuyển hóa bởi enzym này (ví dụ paclitaxel, rosiglitazon và repaglinid).

Các nghiên cứu *in vitro* cho thấy rằng montelukast ức chế CYP 2C8, ức chế không đáng kể là 2C9 và 3A4. Trong nghiên cứu tương tác thuốc lâm sàng giữa thuốc montelukast và gemfibrozil (thuốc ức chế CYP 2C8 và 2C9), gemfibrozil làm tăng nồng độ montelukast gấp 4,4 lần. Không cần hiệu chỉnh liều montelukast khi dùng đồng thời với gemfibrozil hoặc các chất ức chế mạnh CYP 2C8, nhưng bác sĩ nên biết về khả năng xảy ra các phản ứng phụ bất lợi.

Dựa trên dữ liệu *in vitro*, không tương tác thuốc quan trọng thể hiện trên lâm sàng với thuốc ức chế yếu CYP 2C8 (như trimethoprim). Sử dụng đồng thời montelukast với itraconazol - một chất ức chế mạnh của CYP 3A4, không làm tăng đáng kể nồng độ montelukast đường toàn thân.

TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN CỦA THUỐC

Những thuật ngữ sau đây được dùng để phân loại các phản ứng bất lợi dựa trên tần suất:

- Rất thường gặp: $\geq 1/10$;
- Thường gặp: $\geq 1/100$ và $< 1/10$;
- Ít gặp: $\geq 1/1000$ và $< 1/100$;
- Hiếm gặp: $\geq 1/10000$ và $< 1/1000$;
- Rất hiếm gặp: $< 1/10000$;
- Không đủ bằng chứng để kết luận

Hệ cơ quan	Tác dụng không mong muốn	Tần suất
Nhiễm trùng và lây nhiễm	Nhiễm khuẩn đường hô hấp trên	Rất thường gặp
Rối loạn máu và bạch huyết	Tăng xu hướng chảy máu	Hiếm gặp
Rối loạn hệ miễn dịch	Phản ứng quá mẫn	Ít gặp
	Tăng bạch cầu ái toan toàn thân	Rất hiếm gặp
Rối loạn tâm thần	Mơ bất thường bao gồm những cơn ác mộng, mất ngủ, lo âu, kích động bao gồm hành vi gây hấn hay thù địch, trầm cảm, khó chịu, bồn chồn, run	Ít gặp
	Giảm chú ý, suy giảm trí nhớ	Hiếm gặp
	Áo giác, mất phương hướng, có suy nghĩ tự tử	Rất hiếm gặp
Rối loạn hệ thần kinh	Chóng mặt, buồn ngủ, gây buồn ngủ	Ít gặp
Rối loạn nhịp tim	Đánh trống ngực	Hiếm gặp
Rối loạn hô hấp, lồng ngực và trung gian	Đau thắt ngực	Ít gặp
	Hội chứng Churg-Strauss	Rất hiếm gặp
	Tăng bạch cầu ái toan trong phổi	Rất hiếm gặp
Rối loạn tiêu hóa	Tiêu chảy, buồn nôn, nôn mửa	Thường gặp
	Khô miệng, chứng khó tiêu	Ít gặp
Rối loạn mật	Nồng độ ALT, AST huyết thanh tăng cao	Thường gặp
	Viêm gan	Rất hiếm gặp
Rối loạn mô da và mô dưới da	Phát ban	Thường gặp
	Bầm tím, nổi mào đay, ngứa	Ít gặp
	Phù mạch	Hiếm gặp
	Ban nốt đỏ, hồng ban đa dạng	Rất hiếm gặp
Rối loạn cơ xương và mô liên kết	Đau khớp, đau cơ bao gồm chuột rút cơ	Ít gặp
Rối loạn chung	Sốt cao	Thường gặp
	Suy nhược / mệt mỏi, khó chịu, phù	Ít gặp

HƯỚNG DẪN XỬ TRÍ TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN

Thông báo ngay cho bác sĩ hoặc dược sĩ khi gặp phải các tác dụng không mong muốn của thuốc.

QUÁ LIỀU VÀ CÁCH XỬ TRÍ

Không có các phản ứng quá liều khi sử dụng liều cao 200 mg/ ngày ở người lớn trong 22 tuần và liều cao 900 mg/ ngày trong thời gian 1-2 tuần.

Các triệu chứng của phản ứng quá liều như đau bụng, buồn ngủ, đau đầu, nôn mửa, chứng động kinh.

Cần dừng thuốc và đến cơ sở y tế gần nhất khi có các triệu chứng quá liều.

ĐIỀU KIỆN BẢO QUẢN:

Nơi khô ráo, tránh ánh sáng, nhiệt độ dưới 30°C.

HẠN DÙNG:

24 tháng kể từ ngày sản xuất.

TIÊU CHUẨN CHẤT LƯỢNG: TCCS

TÊN, ĐỊA CHỈ CỦA CƠ SỞ SẢN XUẤT THUỐC:



ITP PHARMA

CÔNG TY CP DƯỢC VẬT TƯ Y TẾ HÀ NAM

Cụm công nghiệp Hoàng Đông, Duy Tiên, Hà Nam