

Thuốc này chỉ sử dụng 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 của bác sĩ.

AZOPT®

Hỗn dịch nhỏ mắt Brinzolamide 1%

THÀNH PHẦN:

Hoạt chất: Brinzolamide 1%

Tá dược: Benzalkonium Chloride, Mannitol, Carbomer 974P, Edetate Disodium, Tyloxapol, Sodium Chloride, Hydrochloric Acid và/hoặc Sodium Hydroxide, Nước vô khuẩn.

TÁC DỤNG DƯỢC LÝ:

Carbonic anhydrase (CA) là một men có trong nhiều loại mô của cơ thể kể cả mắt. CA xúc tác phản ứng thuận nghịch gồm phản ứng hydrat hoá carbon dioxide và phản ứng khử nước của axit carbonic. Ở người, carbonic anhydrase tồn tại như một số các isoenzyme, và có hoạt tính nhất là carbonic anhydrase II (CA-II), có chủ yếu trong hồng cầu (RBCs), và cũng có trong các mô khác. Sự ức chế carbonic anhydrase ở tua mi ở mắt làm giảm tiết thủy dịch, điều này được cho là giảm chuyển vận ion natri và chất dịch làm chậm sự hình thành các ion bicarbonate. Kết quả làm giảm áp lực nội nhãn (IOP). Hỗn dịch AZOPT® chứa Brinzolamide 1%, là một chất ức chế men CA-II. Sau khi nhỏ mắt, Brinzolamide ức chế tạo thủy dịch và làm giảm áp lực nội nhãn; áp lực nội nhãn tăng là yếu tố nguy cơ chủ yếu trong quá trình sinh bệnh học của tổn hại thần kinh thị giác và mất thị trường ở bệnh glaucoma.

DƯỢC ĐỘNG HỌC

Sau khi nhỏ mắt, Brinzolamide được hấp thu vào hệ tuần hoàn vì ái lực của nó với CA-II, Brinzolamide phân bố rộng rãi vào hồng cầu và có thời gian bán hủy lâu trong máu (khoảng 111 ngày). Ở người, chất chuyển hoá N-desethyl-brinzolamide được hình thành, chất này cũng gắn kết với CA và tích tụ trong hồng cầu. Chất chuyển hoá này gắn kết chủ yếu với CA-I trong sự hiện diện của Brinzolamide. Trong huyết tương, cả hai nồng độ của chất gốc Brinzolamide và N-desethyl-brinzolamide thấp, và nói chung dưới giới hạn định lượng (< 10ng/ml). Tỷ lệ gắn kết với protein huyết tương khoảng 60%. Brinzolamide được bài tiết chủ yếu trong nước tiểu dưới dạng không đổi. N-desethyl-brinzolamide cũng được tìm thấy trong nước tiểu với các chất chuyển hoá N-desmethoxypropyl và O-desmethyl ở nồng độ thấp hơn. Nghiên cứu dược động học ở người tình nguyện khoẻ mạnh qua đường uống, mỗi người uống viên nang Brinzolamide 1mg, 2 lần/ngày, trong 32 tuần. Lượng Brinzolamide trong liều này xấp xỉ với lượng thuốc cung cấp bởi hỗn dịch AZOPT® (Brinzolamide 1%) nhỏ vào 2 mắt, 3 lần/ngày và giả được uống; và nồng độ các chất chuyển hoá tương tự như khi dùng nhỏ mắt tại chỗ trong thời gian dài. Hoạt tính của CA trong hồng cầu được đo để đánh giá mức độ ức chế CA toàn thân. Sự bão hoà Brinzolamide của CA-II trong hồng cầu đạt được trong vòng 4 tuần (nồng độ trong hồng cầu khoảng 20µM). N-desethyl-brinzolamide tích tụ trong hồng cầu đến nồng độ bão hoà trong vòng 20-28 tuần, đạt được nồng độ trong khoảng từ 6-30µM. Sự ức chế hoạt tính của CA-II ở nồng độ bão hoà xấp xỉ khoảng 70-75% dưới mức độ ức chế mong đợi để có tác dụng dược lý trên chức năng thận hoặc hô hấp ở người khoẻ mạnh.

CHỈ ĐỊNH:

Hỗn dịch nhỏ mắt AZOPT® (brinzolamide 1%) được chỉ định điều trị tăng áp lực nội nhãn

LIỀU LƯỢNG VÀ CÁCH DÙNG:

LẮC KÝ LỖ THUỐC TRƯỚC KHI DÙNG:

Dùng thuốc đơn độc hoặc phối hợp với các thuốc khác: nhỏ 1 giọt hỗn dịch AZOPT® vào mắt bị bệnh, hai lần mỗi ngày. Một số bệnh nhân có thể đáp ứng tốt hơn khi nhỏ 1 giọt/lần, ba lần mỗi ngày. Khi dùng hỗn dịch AZOPT® thay thế cho một thuốc điều trị glaucoma khác, phải ngưng dùng các thuốc đó một ngày rồi mới bắt đầu dùng hỗn dịch AZOPT® vào ngày kế tiếp. Nếu bệnh nhân sử dụng đồng thời nhiều hơn một thuốc nhỏ mắt, các thuốc cần phải được nhỏ mắt cách nhau ít nhất là 10 phút.

Sử dụng ở trẻ em

Hiệu quả và độ an toàn của hỗn dịch AZOPT® ở trẻ em dưới 18 tuổi chưa được xác lập. Vì vậy không khuyến cáo sử dụng cho đối tượng này.

Sử dụng ở người cao tuổi

Không cần hiệu chỉnh liều khi dùng thuốc cho người cao tuổi

Sử dụng ở người suy gan/thận

Thuốc chưa được nghiên cứu trên bệnh nhân suy gan. Vì vậy không khuyến cáo sử dụng cho đối tượng này. Thuốc chưa được nghiên cứu trên bệnh nhân suy thận nặng (Độ thanh thải creatinin <30 mL/phút). Vì brinzolamide và các chất chuyển hóa chính thải trừ chủ yếu qua thận, chống chỉ định hỗn dịch AZOPT® ở bệnh nhân suy thận nặng

CHỐNG CHỈ ĐỊNH:

Bệnh nhân mẫn cảm với bất kỳ thành phần nào của thuốc.
Bệnh nhân suy thận nặng (Độ thanh thải creatinin <30 mL/phút)

KHUYẾN CÁO VÀ THẬN TRỌNG:

Khuyến cáo

Hỗn dịch AZOPT® là một Sulfonamid và mặc dù dùng nhỏ mắt tại chỗ nhưng thuốc được hấp thu toàn thân. Vì vậy, các loại phản ứng phụ của Sulfonamid có thể xảy ra khi nhỏ hỗn dịch AZOPT®. Sự nguy hại đến tính mạng có thể xảy ra, mặc dù rất hiếm, do các phản ứng phụ nặng của Sulfonamid như hội chứng Steven-Johnson, hoại tử biểu mô nhiễm độc, hoại tử gan cấp, mất bạch cầu hạt, thiếu máu bất sản và các chứng loạn tạo máu. Sự mẫn cảm có thể tái diễn khi Sulfonamid được dùng trở lại bất kể sử dụng thuốc bằng đường nào. Nếu xảy ra các dấu hiệu của các phản ứng trầm trọng hoặc quá mẫn phải ngưng dùng thuốc ngay lập tức.

Thận trọng

Hoạt tính của carbonic anhydrase đã được quan sát trong cả tế bào chất và xung quanh màng huyết tương của tế bào nội mô giác mạc. Tác dụng của việc sử dụng liên tục hỗn dịch AZOPT® trên tế bào nội mô giác mạc chưa được đánh giá đầy đủ. Việc điều trị bệnh nhân bị glaucoma góc đóng cấp tính đòi hỏi phải dùng thêm các thuốc hạ nhãn áp khác. Hỗn dịch AZOPT® không được nghiên cứu ở bệnh nhân bị suy thận nặng (độ thanh thải

dưới 30ml/phút). Vì hỗn dịch AZOPT® và các chất chuyển hoá được bài tiết chủ yếu bởi thận, nên hỗn dịch AZOPT® không được khuyến cáo dùng cho các bệnh nhân bị suy thận nặng. Hỗn dịch AZOPT® không được nghiên cứu ở bệnh nhân bị suy gan và nên dùng thuốc thận trọng ở bệnh nhân này. Có thể có thêm tác dụng khác với tác dụng ức chế carbonic anhydrase toàn thân đã được biết ở bệnh nhân dùng thuốc ức chế carbonic anhydrase đường uống và hỗn dịch AZOPT®. Không khuyến cáo dùng đồng thời hỗn dịch AZOPT® và các thuốc ức chế carbonic anhydrase dùng đường uống.

Thông báo cho bệnh nhân:

Không được để chạm đầu ống nhỏ thuốc vào bất cứ vật gì, vì có thể làm nhiễm bẩn dung dịch thuốc. Hỗn dịch nhỏ mắt AZOPT® có chứa chất bảo quản benzalkonium chloride có thể bị hấp phụ bởi kính áp tròng mềm.

Bệnh nhân cần tháo kính áp tròng khi nhỏ hỗn dịch AZOPT® và chỉ được đeo lại 15 phút sau khi nhỏ thuốc.

Dùng thuốc trong thời kỳ mang thai: Các nghiên cứu độc tính của Brinzolamide ở thỏ tại các liều uống 1, 3 và 6mg/kg/ngày (gấp 20, 62 và 125 lần liều nhỏ mắt khuyến cáo dùng cho người) gây độc tính trên thỏ mẹ tại liều 6mg/kg/ngày và tăng đáng kể một số các biến đổi của tế bào thai, như xương sọ phụ chi hơi cao so với nguyên gốc. Ở chuột cống, có giảm đáng kể về làm sàng trọng lượng của bào thai khi chuột cống mẹ uống liều 18mg/kg/ngày (gấp 375 lần liều nhỏ mắt khuyến cáo dùng cho người) trong thời kỳ mang thai tỉ lệ với sự giảm tăng trọng của chuột mẹ, với không có tác dụng đáng kể về mặt làm sàng trên các bộ phận hoặc sự phát triển mô. Ở chuột cống mang thai sau khi dùng đường uống 14-C-brinzolamide, hoạt tính phóng xạ được tìm thấy qua hàng rào nhau thai và có trong các mô máu của bào thai. Chưa có các nghiên cứu đầy đủ và có kiểm soát tốt ở phụ nữ có thai. Hỗn dịch AZOPT® chỉ nên dùng trong thời kỳ mang thai khi lợi ích điều trị cao hơn so với nguy cơ có thể xảy ra cho bào thai.

Phụ nữ đang nuôi con bú: Trong nghiên cứu dùng Brinzolamide cho chuột cống trong thời kỳ cho con bú dùng liều uống 15 mg/kg/ngày (gấp 312 lần liều nhỏ mắt khuyến cáo dùng cho người), làm giảm sự tăng trọng của chuột con trong suốt thời kỳ cho con bú. Không quan sát thấy có tác dụng phụ nào khác. Tuy nhiên, sau khi cho chuột cống trong thời kỳ cho con bú uống 14C-Brinzolamide, hoạt tính phóng xạ được tìm thấy trong sữa với nồng độ thấp hơn nồng độ trong máu và trong huyết tương. Không được biết rằng là hỗn dịch AZOPT® có bài tiết qua sữa mẹ hay không, tuy nhiên nhiều thuốc được bài tiết qua sữa mẹ và vì khả năng xảy ra các phản ứng phụ trầm trọng ở trẻ bú mẹ, nên xem xét cẩn thận hoặc ngưng cho trẻ bú mẹ hoặc ngưng dùng thuốc.

Dùng thuốc cho nhi khoa: Tính an toàn và hiệu quả ở bệnh nhi chưa được xác định.

ẢNH HƯỞNG TỚI KHẢ NĂNG LÁI XE VÀ ĐIỀU KHIỂN MÁY MÓC

Thuốc có thể gây nhìn mờ tạm thời sau khi nhỏ mắt. Nếu bị nhìn mờ sau khi nhỏ thuốc, bệnh nhân phải chờ đến khi nhìn rõ lại mới được lái xe và điều khiển máy móc.

TƯƠNG TÁC THUỐC:

Hỗn dịch AZOPT® 1% chứa chất ức chế carbonic anhydrase. Không có báo cáo Brinzolamide làm ảnh hưởng đến điện giải và cân bằng acid-base trong các thử nghiệm làm sàng. Tuy nhiên, ở bệnh nhân dùng thuốc ức chế carbonic anhydrase đường uống, có vài trường hợp hiếm xảy ra tương tác thuốc khi điều trị với salicylate liều cao. Vì vậy, khả năng xảy ra các tương tác như vậy nên được xem xét ở bệnh nhân dùng hỗn dịch AZOPT®.

TÁC DỤNG PHỤ:

Trong các nghiên cứu làm sàng của hỗn dịch AZOPT®, các tác dụng phụ được báo cáo xảy ra thường xuyên nhất là thị lực giảm, và vị đắng, thay đổi vị giác (đắng và chua). Các tác dụng phụ này xảy ra ở khoảng 5 – 10 % bệnh nhân. Viêm bờ mi, viêm da, khô mắt, cảm giác dị vật, nhức đầu, chóng sung huyết, có ghèn, khô chấy ở mắt, viêm giác mạc, đau và ngứa mắt và viêm mũi đã được báo cáo với tỉ lệ mắc 1 – 5%. Các tác dụng phụ sau đây đã được báo cáo với tỉ lệ mắc phải dưới 1%: phản ứng dị ứng, đau ngực, viêm kết mạc, tiêu chảy, sưng thỵ, chóng mặt, khô miệng, khô thro, ăn không tiêu, mỏi mệt mắt, viêm giác mạc - kết mạc, bệnh lý giác mạc, đau thân, có vảy cứng ở bờ mi hoặc cảm giác dính ở mi mắt, buồn nôn, viêm họng, chảy nước mắt và chóng mặt đau.

Ghi chú: THÔNG BÁO CHO BÁC SĨ CÁC TÁC DỤNG NGOẠI Ý GẤP PHẢI TRONG QUÁ TRÌNH SỬ DỤNG THUỐC

QUÁ LIỀU:

Không thấy có báo cáo hiện tượng quá liều khi sử dụng hỗn dịch AZOPT® (Brinzolamide 1%) theo đường dùng tại chỗ. Tuy nhiên thuốc dùng quá liều đường uống có thể gây mất cân bằng chất điện giải, nhiễm toan và tác dụng trên hệ thần kinh trung ương có thể xảy ra.

Khi nhỏ mắt quá liều, có thể rửa mắt với nước để loại bỏ thuốc. Điều trị triệu chứng và hỗ trợ khi xảy ra quá liều. Theo dõi chặt chẽ pH máu và nồng độ điện giải trong huyết thanh (đặc biệt là kali)

TIÊU CHUẨN CHẤT LƯỢNG:

Nhà sản xuất.

BẢO QUẢN:

Giữ thuốc nơi khô mát, từ 4 – 30oC. Không được để đông lạnh

ĐỂ THUỐC TRÁNH XA TÂM TAY CỦA TRẺ.

HẠN SỬ DỤNG:

Hạn dùng của thuốc ghi trên nhãn: 24 tháng.

Hạn dùng thuốc sau khi mở nắp lọ: 28 ngày.

KHÔNG DÙNG THUỐC QUÁ HẠN SỬ DỤNG GHI TRÊN NHÃN

TRÌNH BÀY: Hộp chứa 1 lọ đếm giọt có 5ml dung dịch thuốc.



ALCON LABORATORIES, INC.
Fort Worth, Texas 76134, USA.

© 2006, 2010 Alcon, Inc.

9005342-0310