

Công thức

Mỗi viên nén bao phim chứa sildenafil citrat tương đương 50 mg sildenafil base (viên 50 mg) hoặc 100 mg sildenafil base (viên 100 mg) và tá dược vừa đủ (ludipress, kollidon CL, magnesi stearat, tá dược bao phim Opadry).

Dạng bào chế

Viên nén bao phim.

Qui cách đóng gói

Hộp 1 vỉ x 3 viên nén bao phim (viên 50 mg).

Hộp 1 vỉ x 3 viên nén bao phim (viên 100 mg).

Chỉ định

Điều trị rối loạn cương dương. Cải thiện đời sống tình dục. Nâng cao chất lượng cuộc sống.

Chống chỉ định

Quá mẫn với bất kỳ thành phần nào của thuốc.

Bị chứng đau thắt ngực hay các bệnh về tim đang được điều trị bằng nitrat hữu cơ, các vấn đề về tim mạch gây ảnh hưởng đến hoạt động sinh lý, đau tim hay đột quỵ trong vòng sáu tháng trở lại.

Suy gan nặng, huyết áp cao quá hay thấp quá. Bệnh về mắt như nhiễm sắc tố võng mạc.

Thuốc chống chỉ định cho trẻ sơ sinh, trẻ em và phụ nữ.

Thận trọng

Cần cân nhắc tình trạng tim mạch của bệnh nhân trước khi tiến hành việc điều trị.

Việc sử dụng sildenafil không bảo vệ bệnh nhân khỏi các bệnh lây nhiễm qua đường tình dục.

Thận trọng sử dụng ở bệnh nhân có bộ phận sinh dục bị biến dạng do giải phẫu (có góc cạnh, xơ hóa hay bệnh Peyronie), bệnh nhân bị mắc các bệnh có thể dẫn đến tình trạng cương đau (bệnh tế bào hồng cầu hình liềm, đa u tủy xương, bệnh bạch cầu).

Vài trường hợp hiếm hoi, bệnh nhân dùng thuốc ức chế PDE5 (thuốc điều trị rối loạn cương dương dùng uống, bao gồm sildenafil) bị mất thị lực đột ngột ở một hoặc cả hai mắt. Dù chưa thể kết luận các thuốc điều trị rối loạn cương dương nhóm ức chế PDE5 là nguyên nhân gây mất thị lực hay là do các tác nhân khác như cao huyết áp, tiểu đường hoặc sự kết hợp của tất cả các vấn đề trên, nếu đột ngột bị giảm hay mất thị lực, bệnh nhân phải ngưng dùng thuốc và báo ngay cho bác sĩ.

Tác dụng phụ

Thường gặp nhất: đau đầu, đỏ bừng, đau dạ dày, các thay đổi về thị giác nhẹ và tạm thời (thay đổi nhận thức về màu sắc, thay đổi nhận thức về ánh sáng, nhìn không rõ), khô tiêu, nghẹt mũi, tiêu chảy.

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

Tương tác thuốc

Do sildenafil chuyển hóa chủ yếu qua CYP3A4 nên việc dùng chung với các chất ức chế CYP3A4 như cimetidin, erythromycin, ketoconazol, itraconazol, ritonavir, saquinavir sẽ làm giảm độ thanh thải sildenafil, dẫn đến tăng nồng độ của thuốc trong huyết thanh. Ngược lại, nồng độ sildenafil trong huyết thanh giảm khi dùng chung với các tác nhân xúc tác CYP3A4 như rifampicin, carbamazepine, phenytoin, phenobarbital.

Bản thân sildenafil là một thuốc giãn mạch nên khi dùng kết hợp với các thuốc giãn mạch khác sẽ gây hạ huyết áp trầm trọng.

Tác dụng của thuốc lên khả năng lái xe hay vận hành máy móc

Nếu dùng thuốc làm thay đổi về thị lực hay hoa mắt thì không nên lái xe hay vận hành máy móc trong thời gian sử dụng thuốc.

Hướng dẫn sử dụng

Để thuốc có công hiệu cần phải có sự kích thích giới tính. Uống khoảng 1 giờ trước khi có hoạt động tình dục và không dùng quá 1 lần mỗi ngày.

Người lớn: liều thường dùng được đề nghị là 50 mg. Dựa theo công hiệu và sự dung nạp, liều có thể tăng lên đến 100 mg hoặc giảm còn 25 mg. Liều tối đa là 100 mg mỗi ngày.

Người trên 65 tuổi, người suy thận vừa và nặng (thanh thải creatinin giảm dưới 30 ml/ phút), người suy gan: liều khởi đầu là 25 mg. Sau đó, dựa theo công hiệu và sự dung nạp có thể tăng lên đến 50 mg và 100 mg.

Người suy thận nhẹ (thanh thải creatinin 30 – 80 ml/ phút): dùng liều như người lớn bình thường.

Người đang dùng thuốc khác: liều khởi đầu không quá 25 mg/ngày nếu đang dùng thuốc ức chế enzyme cytochrom P450 3A4 (ketoconazole, itraconazole, erythromycin, saquinavir); không dùng quá 25 mg sildenafil trong khoảng 48 giờ khi dùng chung với ritonavir; liều khởi đầu 25 mg nên được cân nhắc khi dùng cùng với thuốc chẹn alpha. Không nên dùng liều cao hơn trong vòng 4 giờ dùng thuốc chẹn alpha do nguy cơ hạ huyết áp thế đứng.

Quá liều và xử trí

Các nghiên cứu trên những người tình nguyện khỏe mạnh ở liều dùng lên tới 800 mg, các phản ứng phụ tương tự như với liều thấp hơn, nhưng tỷ lệ mắc phải cao hơn.

Trong trường hợp quá liều, áp dụng một cách linh hoạt các biện pháp điều trị hỗ trợ tiêu chuẩn. Không thể thẩm phân máu nhằm tăng độ thanh thải do sildenafil gắn kết mạnh với protein huyết tương và không thải trừ qua đường tiểu.

Được lực học

Cơ chế sinh lý của sự cương có liên quan đến sự phóng thích nitrogen oxyd (NO) ở thể hang khi có kích thích tình dục. NO sau đó hoạt hóa enzym guanylat cyclase làm gia tăng nồng độ guanosin monophosphat vòng (GMP vòng), dẫn đến sự giãn cơ trơn thể hang làm cho máu tràn vào thể hang.

Sildenafil không có tác động độc lập làm giãn cơ trực tiếp trên thể hang ở người, nhưng làm gia tăng tác động của nitrogen oxyd bằng cách ức chế men phosphodiesterase týp 5 (PDE5), một enzym có vai trò làm thoái biến GMP vòng ở thể hang. Khi sự kích thích tình dục làm phóng thích NO tại chỗ, sự ức chế của sildenafil lên PDE5 gây ra sự gia tăng nồng độ GMP vòng trong thể hang, dẫn đến sự giãn cơ trơn mạch máu và máu tràn vào thể hang gây ra sự cương dương. Ở liều đề nghị, sildenafil sẽ không có tác dụng nếu không có sự kích thích tình dục.

Sildenafil tác động ức chế chọn lọc và hiệu quả trên PDE5. Tác động của sildenafil trên PDE5 mạnh hơn nhiều lần so với các phosphodiesterase đã biết khác (trên 80 lần so với PDE1, trên 1000 lần so với PDE2, PDE3 và PDE4). Tác động chọn lọc của sildenafil lên PDE5 mạnh hơn khoảng 4000 lần so với tác động lên PDE3, điều này rất quan trọng vì PDE3 có liên quan đến sự điều khiển hoạt động cơ bóp của tim. Tác động của sildenafil lên PDE5 chỉ mạnh hơn 10 lần so với tác động lên PDE6 – một enzym có trong võng mạc, tính chất kém chọn lọc trên PDE6 này được cho là cơ sở của những bất thường có liên quan đến sự cảm nhận màu sắc thị giác ghi nhận được khi thử nghiệm với liều cao hay khi nồng độ sildenafil trong huyết tương cao hơn.

Được động học

Hấp thu và phân bố

Sildenafil nhanh chóng được hấp thu ngay sau khi uống, độ khả dụng sinh học tuyệt đối vào khoảng 40%. Nồng độ đỉnh trong huyết thanh đạt được trong khoảng thời gian từ 30 – 120 phút (trung bình là 60 phút), sau khi uống thuốc lúc bụng đói.

Dùng thuốc khi có thức ăn giàu chất béo thì mức độ hấp thu của thuốc giảm đi, với sự trì hoãn trung bình ở T_{max} là 60 phút và mức giảm trung bình ở C_{max} là 29%. Thể tích phân bố ổn định (V_{ss}) của sildenafil là 105 lít, phân bố vào các mô. Cả sildenafil và chất chuyển hóa chủ yếu của nó là N-desmethyl đều gắn kết với protein huyết thanh xấp xỉ 96%. Sự gắn kết với protein không phụ thuộc vào nồng độ tổng của thuốc. Trên cơ sở ước lượng sildenafil trong tinh dịch của những người tình nguyện khỏe mạnh ở thời điểm khoảng 90 phút sau khi uống thuốc, dưới 0,001% liều dùng có thể xuất hiện trong tinh dịch của bệnh nhân.

Chuyển hóa và thải trừ

Sildenafil phần lớn được chuyển hóa thông qua isoenzym vi thể ở gan CYP3A4 (con đường chủ yếu) và CYP2C9 (con đường thứ yếu). Việc ức chế các isoenzym này có thể làm hạn chế mức độ thanh thải sildenafil. Các dữ liệu thu được từ bệnh nhân trong các thử nghiệm lâm sàng đã cho thấy rằng có thể làm giảm độ thanh thải của sildenafil khi dùng kèm thuốc với các tác nhân ức chế CYP3A4 (như ketoconazol, erythromycin, cimetidin).

Có thể hy vọng rằng việc dùng kèm với các tác nhân xúc tác CYP3A4 như rifampicin sẽ làm giảm nồng độ sildenafil trong huyết thanh. Các dữ liệu dược động học từ các nghiên cứu lâm sàng cho thấy các chất ức chế CYP2C9 không ảnh hưởng đến được động học của sildenafil (như tolbutamid, warfarin).

Sau khi uống, sildenafil được thải trừ phần lớn dưới dạng chất trao đổi qua phân (gần 80% liều dùng đường uống) và một lượng ít hơn được thải trừ qua nước tiểu (chiếm khoảng 13% liều dùng đường uống). Các số liệu tương tự cũng được thu thập từ những người bình thường tình nguyện tham gia thử nghiệm cũng như từ người bệnh bằng phương pháp nghiên cứu thâm dò.

Hạn dùng

36 tháng kể từ ngày sản xuất.

Bảo quản

Giữ nơi khô mát (< 30°C).

Để xa tầm tay trẻ em.

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.

CÔNG TY CỔ PHẦN CÔNG NGHỆ SINH HỌC - DƯỢC PHẨM ICA

Lô 10, Đường số 5, Khu công nghiệp Việt Nam-Singapore,

Thuận An, Bình Dương, Việt Nam

Website: www.icabiopharma.com