

Rx Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc

Lercastad 10

1. Tên thuốc

Lercastad 10

2. Các dấu hiệu lưu ý và khuyến cáo khi dùng thuốc

Để xa tầm tay trẻ em
Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng

3. Thành phần công thức thuốc

Thành phần hoạt chất:

Lercanidipine hydrochloride 10 mg

Thành phần tá dược:

Lactose monohydrat, tinh bột ngô tiền hồ hóa, croscarmellose natri, hypromellose, colloidal silica khan, magnesi stearat, opadry vàng.

4. Dạng bào chế

Viên nén bao phim.

Viên nén hình tròn, bao phim màu vàng, hai mặt lõm, một mặt khắc vạch, một mặt trơn.

5. Chỉ định

Điều trị tăng huyết áp nguyên phát từ nhẹ đến trung bình.

6. Cách dùng, liều dùng

Cách dùng

Lercastad 10 được uống trước bữa ăn ít nhất 15 phút.

Liều dùng

Liều chỉ định là 10 mg 1 lần/ngày, liều có thể tăng đến 20 mg phụ thuộc vào đáp ứng của từng bệnh nhân.

Do tác dụng hạ huyết áp tối đa chỉ biểu hiện sau 2 tuần nên việc hiệu chỉnh liều dùng nên tiến hành từ từ.

Điều trị cho người lớn tuổi: Cần theo dõi cẩn thận khi bắt đầu điều trị.

Điều trị cho bệnh nhân rối loạn chức năng thận hoặc gan: Cần theo dõi cẩn thận khi bắt đầu điều trị đối với bệnh nhân rối loạn chức năng gan và thận nhẹ đến trung bình. Liều chỉ định thông thường có thể được dung nạp bởi nhóm đối tượng này, nên phải thận trọng khi điều chỉnh tăng liều lên 20 mg mỗi ngày. Tác độ hạ huyết áp ở bệnh nhân suy gan tăng do đó cần xem xét việc điều chỉnh liều dùng.

7. Chống chỉ định

Quá mẫn với lercanidipine, nhóm dihydropyridin hay bất kỳ thành phần nào trong công thức.

Phụ nữ có thai và cho con bú.

Phụ nữ có khả năng mang thai trừ khi sử dụng phương pháp tránh thai hiệu quả.

Tắc nghẽn đường ra tâm thất trái.

Suy tim sung huyết chưa được điều trị.

Đau thắt ngực không ổn định.

Trong 1 tháng sau nhồi máu cơ tim.

Dùng đồng thời với các thuốc ức chế mạnh CYP3A4, cyclosporin, nước bưởi.

Bệnh nhân suy gan hay suy thận trầm trọng (hệ số GFR < 30 ml/phút).

Trẻ em dưới 18 tuổi.

8. Cảnh báo và thận trọng khi dùng thuốc

Nên theo dõi cẩn thận khi lercanidipine được chỉ định cho bệnh nhân có hội chứng nút xoang bệnh lý (trường hợp không sử dụng máy tạo nhịp tim), bệnh nhân rối loạn chức năng tâm thất trái. Tăng nguy cơ tim mạch ở bệnh nhân thiếu máu cục bộ khi sử dụng dihydropyridin tác động ngắn. Lercanidipine mặc dù có tác dụng kéo dài nhưng cũng cần thận trọng khi sử dụng cho đối tượng này.

Lercastad 10 có chứa tá dược lactose. Không nên dùng thuốc này cho bệnh nhân có các vấn đề về di truyền hiếm gặp không dung nạp galactose, thiếu hụt enzym lactase toàn phần hay kém hấp thu glucose-galactose.

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

Phụ nữ có thai

Chưa có kinh nghiệm sử dụng lercanidipine trên lâm sàng cho phụ nữ có thai và cho con bú nhưng những thuốc khác thuộc nhóm dihydropyridin được biết là gây quái thai trên động vật, do đó lercanidipine không nên chỉ định cho phụ nữ có thai hay có khả năng mang thai trừ khi có sử dụng những biện pháp tránh thai có hiệu quả.

Phụ nữ cho con bú

Do có tính thân dầu cao nên lercanidipine có thể phân bố vào sữa. Vì vậy, thuốc không nên được chỉ định với phụ nữ cho con bú.

10. Ảnh hưởng của thuốc lên khả năng lái xe, vận hành máy móc

Dựa vào kinh nghiệm lâm sàng, lercanidipine không làm giảm khả năng lái xe và vận hành máy móc. Tuy nhiên, cần được theo dõi cẩn thận bởi các tác dụng không mong muốn có thể xảy ra như chóng mặt, suy nhược, mệt mỏi, và ngủ gật nhưng hiếm gặp.

11. Tương tác, tương kỵ của thuốc

Tương tác của thuốc

Rượu: Tránh dùng đồng thời vì rượu có khả năng ảnh hưởng đến thuốc hạ huyết áp do làm giãn mạch.

Nhóm ức chế và cảm ứng enzym CYP3A4: Lercanidipine được chuyển hóa bởi men CYP3A4 do đó dùng đồng thời với các thuốc gây ức chế và cảm ứng men CYP3A4 sẽ gây tương tác đến chuyển hóa và thải trừ của lercanidipine.

+ Một nghiên cứu về sự tương tác với chất ức chế mạnh CYP3A4 như ketoconazol cho thấy có sự tăng nồng độ của lercanidipine trong huyết tương.

+ Thận trọng khi dùng đồng thời lercanidipine với các chất cảm ứng CYP3A4 như thuốc chống co giật (phenytoin, carbamazepin) và rifampicin vì có thể làm giảm tác dụng hạ huyết áp nên cần theo dõi huyết áp thường xuyên hơn.

– Midazolam và các chất nền của CYP3A4: Dùng đồng thời lercanidipine liều 20 mg và midazolam đường uống cho người tình nguyện lớn tuổi, nồng độ hấp thu lercanidipine tăng (xấp xỉ 40%) và tốc độ hấp thu giảm (tmax giảm từ 1,75 đến 3 giờ). Nồng độ midazolam không bị thay đổi. Nên thận trọng khi chỉ định đồng thời lercanidipine và các chất nền của CYP3A4 như terfenadin, astemizol, thuốc chống loạn nhịp nhóm III như amiodaron và quinidin.

– Thuốc lợi tiểu, thuốc ức chế enzym chuyển và thuốc chẹn beta: Khi sử dụng đồng thời lercanidipine với metoprolol, một thuốc chẹn beta được thải trừ chủ yếu qua gan, sinh khả dụng metoprolol không thay đổi nhưng lercanidipine giảm 50%. Tác động này cũng xảy ra với các thuốc khác thuộc nhóm này do thuốc chẹn beta làm giảm lưu lượng máu tới gan. Do vậy, lercanidipine sử dụng an toàn khi dùng đồng thời với thuốc chẹn beta nhưng phải điều chỉnh liều.

– Cimetidin: Cần phải thận trọng khi sử dụng cimetidin liều trên 80 mg vì sinh khả dụng và tác động hạ huyết áp của lercanidipine có thể tăng.

– Digoxin: Điều trị đồng thời digoxin và lercanidipine 20 mg, nồng độ Cmax của digoxin tăng 33% trong khi AUC và độ thanh thải thận không có sự thay đổi có ý nghĩa. Bệnh nhân được điều trị đồng thời digoxin nên được theo dõi lâm sàng chặt chẽ các dấu hiệu nhiễm độc digoxin.

– Cyclosporin: Nồng độ của lercanidipine và cyclosporin trong huyết thanh đều tăng khi dùng đồng thời.

– Nước bưởi: Lercanidipine dễ bị ức chế chuyển hóa bởi nước bưởi đưa đến kết quả làm tăng sinh khả dụng và tác động hạ huyết áp.

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.

12. Tác dụng không mong muốn của thuốc

– Ít gặp (1/1000 ≤ ADR < 1/100): Đau đầu, chóng mặt, phù nề ngoại biên, tim đập nhanh, hồi hộp, đỏ bừng.

– Hiếm gặp (1/10.000 ≤ ADR < 1/1000): Ngủ gật, đau thắt ngực, buồn nôn, khó tiêu, tiêu chảy, đau bụng, nôn, phát ban, đau cơ, suy nhược, mệt mỏi.

– Rất hiếm gặp (ADR < 1/10.000): Phì đại nước, tăng thuận nghịch nồng độ các transaminase huyết thanh, hạ huyết áp, đi tiểu nhiều, đau ngực, tăng nhạy cảm, ngất.

– Một số dihydropyridin hiếm khi gây đau vùng ngực phía trước tim hay đau thắt ngực. Bệnh nhân đau thắt ngực có sẵn hiếm khi tăng tần suất, thời gian và tính trầm trọng của cơn đau. Một vài trường hợp bị nhồi máu cơ tim được quan sát thấy.

13. Quá liều và cách xử trí

Triệu chứng

Tương tự các thuốc khác thuộc nhóm dihydropyridin, quá liều có thể gây ra giãn mạch quá mức với triệu chứng hạ huyết áp rõ rệt và phản xạ tim đập nhanh.

Điều trị

Trường hợp hạ huyết áp trầm trọng, nhịp tim chậm và bất tỉnh, trợ tim bằng cách tiêm tĩnh mạch atropin có thể hữu ích cho trường hợp nhịp tim chậm. Do tác động dược lý kéo dài của lercanidipine, nên theo dõi tình trạng tim mạch của bệnh nhân bị quá liều ít nhất 24 giờ. Chưa có thông tin về hiệu quả của sự thẩm tách máu. Vì thuốc có tính thân dầu cao, nên nồng độ huyết tương không chỉ ra khoảng thời gian của giai đoạn nguy hiểm và thẩm tách máu có thể không có hiệu quả.

14. Đặc tính dược lực học

Nhóm dược lý: Thuốc chẹn calci chọn lọc có tác dụng chính trên mạch; Dẫn chất dihydropyridin.

Mã ATC: C08CA13.

Tác động hạ huyết áp của lercanidipine chủ yếu là do chất đối hình (S).

Lercanidipine là thuốc chẹn kênh calci thuộc nhóm dihydropyridin, ức chế dòng calci đi chuyển qua màng tế bào đến cơ trơn mạch máu và cơ tim. Cơ chế hạ huyết áp là do tác động giãn cơ trơn mạch máu trực tiếp nên làm giảm sức cản ngoại vi. Tuy thời gian bán thải ngắn, lercanidipine có tác dụng hạ huyết áp kéo dài do có hệ số phân bố trong màng cao và không gây tác dụng hướng cơ âm tính do có tính chọn lọc cao trên mạch. Vì lercanidipine hydrochloride gây giãn mạch từ lúc khởi đầu nên hiếm gặp các triệu chứng hạ huyết áp cấp với tim đập nhanh do phản xạ trên bệnh nhân cao huyết áp.

15. Đặc tính dược động học

Lercanidipine được hấp thu hoàn toàn qua đường tiêu hóa sau khi uống nhưng chịu sự chuyển hóa lần đầu đáng kể. Sinh khả dụng của thuốc thấp tuy nhiên tăng khi có sự hiện diện của thức ăn. Nồng độ đỉnh trong huyết tương đạt được sau khi uống thuốc 1,5 – 3 giờ. Lercanidipine phân bố rộng rãi và nhanh. Trên 98% lercanidipine gắn kết với protein huyết tương. Lercanidipine chuyển hóa mạnh, chủ yếu bởi isoenzym CYP3A4 của cytochrom P450, thành các chất chuyển hóa không hoạt tính, khoảng 50% liều dùng được bài tiết qua nước tiểu. Thời gian bán thải cuối cùng khoảng 2 – 5 giờ nhưng các nghiên cứu khác sử dụng phương pháp định lượng nhạy hơn đã đưa ra giá trị từ 8 – 10 giờ.

16. Quy cách đóng gói

Ví 10 viên. Hộp 3 vỉ.

Ví 10 viên. Hộp 6 vỉ.

17. Điều kiện bảo quản, hạn dùng, tiêu chuẩn chất lượng của thuốc

17.1. Điều kiện bảo quản

Bảo quản trong bao bì kín, nơi khô, tránh ánh sáng. Nhiệt độ không quá 30°C.

17.2. Hạn dùng

36 tháng kể từ ngày sản xuất.

17.3. Tiêu chuẩn chất lượng

TCCS.

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



STELLA

Công ty TNHH LD Stellapharm - Chi nhánh 1

Số 40 đại lộ Tự Do, KCN Việt Nam - Singapore,

P. An Phú, Tx. Thuận An, T. Bình Dương, Việt Nam

ĐT: (+84 274) 3767 470 Fax: (+84 274) 3767 469