

Tài liệu thông tin cho cán bộ Y tế

Tài liệu thông tin cho cán bộ

ACTIV-GRA 50mg

THUỐC ĐIỀU TRỊ RỐI LOẠN CƯƠNG DƯƠNG

● **THÀNH PHẦN:** Mỗi viên nén bao phim có chứa:
Sildenafil: 50mg (dưới dạng Sildenafil citrat)
Tá dược: Lactose monohydrat, dicalci phosphat, microcrystalline cellulose, croscarmellose sodium, povidone, sodium lauryl sulfat, talc, magnesi stearat, aerosil 200, HPMC, titan dioxide, talc, indigotin.

● **DẠNG TRINH BÀY:** Hộp 1 vỉ x 4 viên.

● **ĐƯỢC LƯU HỌC:**
- Cơ chế của sự cương dương liên quan tới việc giải phóng oxyd nitric (NO) ở thể hang dương vật trong quá trình kích thích tình dục. NO hoạt hóa enzym Guaninyl cyclase làm tăng nồng độ Guanin monophosphat vòng (cGMP), làm giãn cơ trơn và tăng lưu lượng máu tới thể hang. Sildenafil không có tác dụng gián cơ trực tiếp nhưng làm tăng tác dụng của NO bằng cách ức chế PDE5 (phosphodiesterase typ 5) là enzym làm thoái hóa cGMP ở thể hang. Khi kích thích tình dục, Sildenafil làm tăng giải phóng NO làm ức chế PDE5 dẫn tới tăng cGMP ở thể hang, gây giãn cơ và tăng lưu lượng máu tới thể hang. Khi dùng sildenafil ở liều đề xuất, nếu không có kích thích tình dục thì sẽ không có tác dụng.

- Nghiên cứu trên invitro cho thấy Sildenafil có tác dụng chọn lọc trên PDE5 (gấp 10 lần so với PDE6, gấp 80 lần PDE1, gấp 700 lần PDE2, PDE4, PDE7, PDE8, PDE9, PDE10, PDE11).

● **ĐƯỢC BÔNG HỌC:**
- Hấp thu và phân bố: Sildenafil được hấp thu nhanh qua đường uống. Sau khi uống 30-120 phút, thuốc đạt nồng độ tối đa trong huyết tương (Cmax). Sildenafil bị giảm hấp thu khi dùng cùng với các thức ăn giàu chất béo khi đó thời gian đạt nồng độ tối đa trong huyết tương (Tmax) kéo dài tới 60 phút và Cmax giảm 29%. Sildenafil được phân bố rộng rãi vào các mô của cơ thể. Sildenafil và các chất chuyển hóa của nó (dạng N-demethyl hóa) liên kết mạnh với protein huyết tương khoảng 96%.

- Chuyển hóa và thải trừ: Sildenafil được chuyển hóa chủ yếu nhờ CYP3A4 và một phần nhỏ nhờ CYP2C9 (các isoenzym của microsomal gan). Sildenafil sau khi bị demethyl hóa lại được chuyển hóa tiếp. Chất chuyển hóa này có tác dụng chọn lọc trên PDE tương tự như Sildenafil, tác dụng trên PDE5 bằng khoảng 50% chất ban đầu. Nồng độ chất chuyển hóa bằng khoảng 40% nồng độ Sildenafil, gây ra 20% tác dụng dược lý. Sildenafil được thải trừ chủ yếu qua phân ở dạng chất chuyển hóa và một phần nhỏ qua nước tiểu.

● **CHỈ ĐỊNH:**
- ACTIV-GRA dùng để điều trị các rối loạn cương dương, là tình trạng không có khả năng đạt được hoặc duy trì cương cứng đủ để thỏa mãn hoạt động tình dục.

- ACTIV-GRA chỉ có tác dụng khi có kích thích tình dục kèm theo.

● **LIỀU LƯỢNG VÀ CÁCH DÙNG:**
Thuốc dùng theo đường uống.
- Liều thông thường: 1 viên/lần/ngày, uống trước khi quan hệ tình dục khoảng 1 giờ.
- Tùy đáp ứng trên bệnh nhân mà có thể dùng liều từ 25mg tới 100mg/lần/ngày.
- Không dùng quá 100mg/ngày và không dùng quá 1 lần trong 24 giờ.

Đối với bệnh nhân suy thận:
- Các trường hợp suy thận nhẹ hoặc trung bình (độ thanh thải Creatinine = 30-80 ml/phút), không cần điều chỉnh liều.
- Các trường hợp suy thận nặng (độ thanh thải Creatinine <30ml/phút), liều nên dùng là 25mg/lần/ngày vì độ thanh thải của Sildenafil bị giảm ở những bệnh nhân này.

Đối với bệnh nhân suy gan:
- Liều nên dùng là 25mg/ngày vì độ thanh thải của Sildenafil bị giảm ở những bệnh nhân này (ví dụ bệnh xơ gan).

Đối với bệnh nhân đang phải dùng các thuốc khác:
- Những bệnh nhân đang phải dùng Ritonavir thì liều không được vượt quá 1 liều đơn tối đa là 25mg Sildenafil trong vòng 48 giờ (xem thêm phần tương tác với các thuốc khác và các dạng tương tác khác).
- Những bệnh nhân đang phải dùng các thuốc có tác dụng ức chế CYP 3A4 (ví dụ Erythromycin, Saguinavir, Ketoconazole, Itraconazole) thì liều khởi đầu nên dùng là 25mg (xem thêm phần tương tác với các thuốc khác và các dạng tương tác khác).

Đối với trẻ em: Không dùng cho trẻ em dưới 18 tuổi.
Đối với người già: Không cần phải điều chỉnh liều.

● **CHỐNG CHỈ ĐỊNH:**
- Phụ nữ và trẻ em dưới 18 tuổi.
- Người dị ứng với bất cứ thành phần nào của thuốc.
- Bệnh nhân có tiền sử bệnh lý mạch vành, mạch não (vì tăng nguy cơ xuất huyết do vỡ mạch vành, mạch não), nhất là bệnh nhân xơ vữa mạch lan tỏa.
- Sildenafil làm tăng tác dụng hạ huyết áp của các Nitrat. Vì vậy chống chỉ định dùng Sildenafil cho những bệnh nhân đang dùng những chất cung cấp Nitric oxide, các Nitrate hữu cơ (xem thêm phần tương tác với các thuốc khác và các dạng tương tác khác).

● **THẬN TRỌNG:**
- Bệnh nhân suy gan, suy thận nặng.
- Bệnh nhân có tiền sử bị nhồi máu cơ tim, đột quỵ, loạn nhịp tim trong vòng 06 tháng.
- Bệnh nhân bị huyết áp thấp.
- Bệnh nhân bị viêm võng mạc, người mất thị lực một bên mắt.
- Thận trọng với bệnh nhân có bộ phận sinh dục biến dạng có giải phẫu (góc cạnh, xơ hóa), các bệnh có thể dẫn đến cương đau (tế bào hồng cầu liềm, đau tủy xương, bệnh bạch cầu).
- Khi hiệp tương cương cứng trên 4 giờ, phải cho bệnh nhân áp dụng ngay các biện pháp y tế nếu không sẽ dẫn tới tổn thương mô dương vật, mất vĩnh viễn khả năng cương cứng.
- Bệnh nhân được khuyến nên ngưng dùng Sildenafil và hỏi ý kiến thầy thuốc trong trường hợp đột nhiên mất khả năng nghe hoặc nhìn.
- Thuốc không bảo vệ bệnh nhân trước các bệnh lây truyền qua đường tình dục.

● **TÁC DỤNG KHÔNG MONG MUỐN:**
- Phản ứng dị ứng, phù mắt, đỏ bừng mắt, tăng nhạy cảm với ánh sáng, sốt, suy nhược, đau ngực, đau bụng, tăng hệ tim mạch: tăng nhịp tim, đánh trống ngực, đau thắt ngực, thiếu máu cục bộ cơ tim, suy tim, tăng huyết áp, hạ huyết áp, hạ huyết áp thể đứng.
- Trên hệ tiêu hóa: nôn, khó tiêu, tiêu chảy, viêm lưỡi, viêm lợi, khô miệng, viêm ruột kết, rối loạn tiêu hóa, trào ngược dạ dày-thực quản, xuất huyết trực tràng, chướng gan bất thường.
- Trên mắt và bạch huyết: thiếu máu và giảm bạch cầu.
- Trên chuyển hóa: tăng cảm giác khát, phù ngoại biên, gù, tăng glucose huyết, tăng sodium huyết, tăng ure huyết, phản xạ giảm glucose.
- Trên hệ cơ xương: viêm khớp, đau cơ, đau lưng, đau xương, nhức mỏi cơ tay, viêm màng hoạt dịch.
- Trên hệ thần kinh: đau đầu, chóng mặt, mất điều vận, run, lo sợ, tăng lượng lực, đau dây thần kinh, giảm phản xạ, mất ngủ, lo mơ, ác mộng.
- Trên hệ hô hấp: hen, khó thở, viêm phế quản, thanh quản, viêm họng, viêm xoang, tăng phản xạ ho.
- Trên da: ngứa, mẩn đỏ, viêm da, phỏng rộp, đỏ mồi, viêm da tiếp xúc.
- Trên mắt: khô mắt, sưng thị, giảm thị lực, tăng nhãn áp, sợ ánh sáng, loạn sắc, đau và đỏ mắt, xuất huyết võng mạc.
- Trên hệ tiết niệu-sinh dục: viêm bàng quang, sỏi, sỏi máu, nhiễm trùng đường tiết niệu, rối loạn bài tiết tinh dịch, phù nề phần sinh dục.
- Các tác dụng không mong muốn khác: rụng tóc, giảm đột ngột hoặc mất khả năng nghe, vú bị nở lớn ở nam.

Thời kỳ có thai và đang cho con bú: không sử dụng.
Người lái xe và vận hành máy móc: dùng thận trọng.
Khi sử dụng Sildenafil có hiện tượng thay đổi thị lực, hoa mắt thì không nên lái xe hay vận hành máy móc.

● **TƯƠNG TÁC THUỐC:**
- Sildenafil được chuyển hóa chủ yếu qua cytochrom P450 3A4 và 2B8 do đó các thuốc ức chế cytochrom như: cimetidin, erythromycin, ketoconazol, itraconazol, ritonavir sẽ làm giảm thải trừ, do đó làm tăng nồng độ Sildenafil trong huyết tương.
- Khi sử dụng đồng thời Sildenafil với các chất kích thích cytochrom P450 3A4 như rifampicin, nồng độ thuốc trong huyết tương sẽ giảm.

● **QUẢ LIỆU VÀ XỬ TRÍ:**
- Ở người bình thường, khi dùng liều cao tới 80mg, tác dụng phụ xuất hiện tương tự khi dùng liều thấp nhưng xảy ra nhanh hơn.
- Trong trường hợp quá liều, phải nhanh chóng áp dụng các biện pháp cần thiết để loại nhanh Sildenafil ra khỏi cơ thể. Tuy nhiên không nên dùng biện pháp thẩm tách thận vì Sildenafil liên kết với protein huyết tương cao và nó cũng không thải trừ qua nước tiểu.

Những lưu ý đặc biệt và cảnh báo khi sử dụng thuốc:
Không nên sử dụng Sildenafil cho người có tiền sử bệnh tim mạch.
Mặc dù những dữ liệu về độ an toàn khi dùng thuốc vẫn chưa có nhưng bác sĩ vẫn cần thận trọng khi kê đơn cho những đối tượng sau:
- Nhồi máu cơ tim, loạn nhịp tim, đột quỵ trong vòng 06 tháng trước đó
- Huyết áp thấp (BP < 90/50) hoặc huyết áp quá cao (BP > 170/110)
- Bệnh động mạch vành
- Bệnh viêm võng mạc
- Khi hiện tượng cương dương kéo dài trên 4 giờ, phải cho bệnh nhân áp dụng các biện pháp y tế. Nếu không cương cứng sẽ bị phá hủy và bệnh nhân sẽ bị mất khả năng tình dục trong một thời gian dài.
- Nếu sử dụng đồng thời với các thuốc ức chế protease như ritonavir, nồng độ Sildenafil trong huyết tương tăng cao (AUC tăng gấp 11 lần). Do vậy cần giảm liều cho những bệnh nhân đang phải dùng ritonavir để giảm tác dụng phụ.
- Khi dùng đồng thời với các thuốc α-blocker, có thể gây hạ huyết áp. Do vậy, trước khi dùng thuốc, không nên sử dụng Sildenafil liều cao trên 25mg trong vòng 4 giờ sau khi sử dụng α-blocker.
- Thận trọng khi dùng thuốc cho bệnh nhân có biến dạng dương vật, bệnh nhân thiếu máu hồng cầu hình lưỡi liềm, bệnh bạch cầu.
- Không nên sử dụng với các thuốc kích thích tình dục khác.
- Cần phải giảm liều khi sử dụng cho bệnh nhân suy gan, thận, người già.
- Cần phải giảm liều khi sử dụng cho bệnh nhân suy gan, thận, người già.

● **HẠN DÙNG:** 36 tháng kể từ ngày sản xuất
● **BẢO QUẢN:** nơi khô mát, dưới 30°C, tránh ánh sáng trực tiếp.
● **TIÊU CHUẨN:** TCCS

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

THUỐC CHỈ DÙNG THEO ĐƠN CỦA BÁC SỸ

ĐỂ XA TÂM VỚI CỦA TRẺ EM - ĐỌC KỸ HƯỚNG DẪN SỬ DỤNG TRƯỚC KHI DÙNG

NẾU CẦN THÊM THÔNG TIN, XIN HỎI Ý KIẾN BÁC SỸ, ĐƯỢC SỸ

Nhà sản xuất:
CÔNG TY CP DƯỢC TW MEDIPLANTEX
35B đường Giải Phóng, quận Thanh Xuân, Hà Nội.
Sản xuất tại NM DP số 2:
Trung Hậu, Tiên Phong, Mê Linh, Hà Nội.

Nhà phân phối:
CÔNG TY TNHH YAMAHAMINH
A8, Lô 19, Khu DT Bình Công, Hoàng Mai, Hà Nội
Tel: 36403241, Fax: 36403239
Website: haminh.com.vn
Email: contact@haminh.com.vn

